

01



UNIVERSITAT DE BARCELONA



# SÍNTESI ORGÀNICA I DE FÀRMACS

Edifici de Farmàcia, 50 anys

Curs  
2007-08



Ensenyament de Farmàcia



UNIVERSITAT DE BARCELONA



**Pla docent de l'assignatura**

**SÍNTESI ORGÀNICA I DE  
FÀRMACS**

## **Dades generals de l'assignatura**

**Nom de l'assignatura:** Síntesi Orgànica i de Fàrmacs  
**Codi de l'assignatura:** 243123  
**Curs acadèmic:** 2007-2008  
**Coordinació:** JOSE BONJOCH SESE  
**Departament:** Dept. Farmacologia i Química Terapèutica  
**Crèdits:** 6 (Crèdits assig. només no-ECTS)



## **Objectius d'aprenentatge de l'assignatura**

### **Referits a coneixements**

Els objectius de l'assignatura es configuren en tres vessants: a) com una experiència total en química orgànica, relacionant aspectes inclosos de manera parcial en assignatures precedents d'aquesta àrea de coneixement; b) com una iniciació als aspectes concrets que es requereixen per desenvolupar un treball en aquest camp d'aplicació, remarcant-se l'ús de les fonts d'informació; c) com un exercici alhora lògic i heurístic en visualitzar els darrers avenços en el camp del disseny de tàctiques i estratègies per a la síntesi de compostos d'interès terapèutic.

## **Blocs temàtics de l'assignatura**

### **Programa de classes teòriques**

#### **1 Introducció**

Consideracions generals. Objectius i importància de la síntesi orgànica.

Metodologia en l'elaboració d'un pla de síntesi. Síntesi lineal i convergent. Síntesi total i síntesi parcial. Formació de l'esquelet carbonat i manipulació de grups

funcionals. Quimioselectivitat. Regioselectivitat. Estereoselectivitat.

Estereoespecificitat. Enantioselectivitat

## 2 Anàlisi estructural sintètica

Simplificació estructural. Desconnexions heterolítiques: principis heurístics.

Simetria. Grups funcionals. L'esquelet carbonat: cadenes, anells i apèndixs

## 3 Formació d'enllaços carboni-carboni I

Nucleòfils carbonats. Carbanions sense estabilització per heteroàtoms. Acetilurs.

Compostos organometàl·lics. Reactius organolítics i de Grignard. Els organocuprats

## 4 Formació d'enllaços carboni-carboni II

Enolats. Formació d'enolats. Alquilació d'enolats. Condensació aldòlica. Addició de Michael

## 5 Els compostos de sofre, bor, silici i estany en síntesi orgànica

Tioacetals. Inversió de reactivitat. Carbanions estabilitzats: sulfòxids i sulfones.

Transposició de Pummerer. Trialquilborans. Vinilsilans. Al·lilsilans. Reaccions radicalàries

## 6 Formació de dobles enllaços carboni-carboni

Reaccions de beta-eliminació. Sulfòxids i selenòxids. Reaccions de Wittig i relacionades. Aspectes estereoquímics. Reacció de Wadsworth-Emmons

## 7 Formació d'anells

Processos intermoleculars. Síntesi d'anells petits i grans. Les reaccions de

metàtesi. Reaccions electrocícliques. Les reaccions d'acoblament catalitzades per Pd: Suzuki, Stille i Heck

## 8 Reaccions de fragmentació i de transposició

Fragmentacions heterolítiques (Grob). Aspectes estereoquímics. Transposicions sigmatròpiques. Transposició de Cope. Transposició d'oxi-Cope aniònica.

Transposició de Claisen. Transposicions sigmatròpiques [2,3]

## 9 Síntesi de compostos enantiopurs

Estratègies per a l'obtenció de fàrmacs enantiopurs. Síntesi a partir de la reserva quiral. Mètodes catalítics. Utilització d'enzims i microorganismes. Utilització de metalls de transició. Síntesi de la fluoxetina

## 10 Síntesis de fàrmacs relacionats amb productes naturals

Esteroides. Antibiòtics beta-lactàmics. Pèptids. Prostaglandines

## 11 Síntesis orgàniques seleccionades I

Morfina. Quinina. Vinblastina

## 12 Síntesis orgàniques seleccionades II

Estudi analític de processos de síntesi de molècules significatives de recent publicació. Anàlisi de les reaccions més emprades en la indústria farmacèutica



### **Metodologia i organització general de l'assignatura**

La matèria s'impartirà en classes de teoria (4,5 crèdits) i seminaris i problemes (1,5 crèdits). Les classes seran presencials en la seva major part.

### **Avaluació acreditativa dels aprenentatges de l'assignatura**

L'avaluació serà mixta: d'una banda, continuada, mitjançant la correcció personalitzada dels problemes proposats per als seminaris i, de l'altra, hi haurà un examen final.

#### **Avaluació única**

Els alumnes que s'acullin a l'avaluació única realitzaran un examen final en la data que marqui el Consell d'Estudis (4 de juny de 2008). L'examen tindrà un valor màxim de 10 punts.

Data màxima per acollir-se a l'avaluació única: 29 de febrer.

La segona convocatòria (8 de setembre de 2008) serà idèntica a la primera convocatòria.



## Fonts d'informació bàsiques de l'assignatura

### Llibres

BORRELL, J. I.; TEIXIDÓ, J.; FALCÓ, J. L. *Síntesis orgánica*. Madrid: Síntesis, 1999.

CLAYDEN, J.; GREEVES, N.; WARREN, S.; WOTHERS, P. *Organic Chemistry*. Oxford, 2001.

DELGADO, A.; MINGUILLÓN, C.; JOGLAR, J. *Introducción a la síntesis de fármacos*. Madrid: Síntesis, 2002.

NICOLAOU, K. C.; SORENSEN, E. J. *Classics in Total Synthesis*. Weinheim: VCH, 1996.

NICOLAOU, K. C.; SNYDER, S. A. *Classics in Total Synthesis II*. Weinheim: VCH, 2003.

SERRATOSA, F.; XICART, J. *Organic Chemistry in Action*. Elsevier, 1996.

SMITH, M. B. *Organic Synthesis*. 2a ed. McGraw-Hill, 2002.

