

### Identificación

<b>FECHA</b>	Mayo 2012
<b>UNIDAD</b>	Unidad III
<b>APRENDIZAJE</b>	11. Aumentar su habilidad en el manejo de equipo y de sustancias de <b>laboratorio al experimentar</b> . 13. <b>Reconocer</b> que los grupos funcionales determinan las propiedades de las moléculas orgánicas. 14. <b>Incrementar</b> su capacidad de observación, análisis y síntesis de la información obtenida al experimentar. 15. <b>Describir</b> las condiciones en que se realiza la síntesis del principio activo. 16. Aumentar su capacidad de comunicación oral y escrita al expresar sus conclusiones.
<b>TEMA</b>	¿Cómo se sintetiza un principio activo?
<b>PALABRAS CLAVE</b>	Reacción de síntesis, Condiciones de reacción, Grupos funcionales, Principio activo, Medicamento, moléculas orgánicas.
<b>AUTORES</b>	Castillo Urueta Pável y Guzmán Aguirre Sandra

### Objetivo(s)

El alumno reconocerá la importancia que tienen los grupos funcionales en la reactividad de las moléculas por medio de la identificación de las reacciones de síntesis y así comprender cómo se sintetiza de un principio activo.

### ÍNDICE DE NAVEGACIÓN

1. Introducción
2. Grupos funcionales
  - Reactividad
  - Ejercicio 1. Grupos funcionales
3. Propiedades
4. Condiciones de reacción
  - Síntesis de un principio activo
  - Ejercicio 2. Síntesis de la aspirina
5. Actividad final
6. Glosario
7. Referencias

## INICIO Presentación

### 1. Introducción

A lo largo de tu vida has experimentado diversas enfermedades y al acudir con tu médico, éste te prescribe el uso de diferentes medicamentos de acuerdo con el padecimiento.

Cada uno de los medicamentos que se indican para el tratamiento de las enfermedades contiene un principio activo específico. Pero te has preguntado ¿Cómo es que se tienen tantas moléculas activas que permiten tratar diversas enfermedades?, ¿qué es lo que hace que los principios activos sean específicos para cada enfermedad?.

En esta unidad didáctica podrás analizar distintas las estructuras de moléculas orgánicas que se emplean como principios activos y reconocerás que los grupos funcionales determinan las propiedades y son la parte reactiva de éstas moléculas.

Así comprenderás que las reacciones químicas se llevan a cabo en condiciones específicas de temperatura, concentración de reactivos, uso de catalizadores, entre otras condiciones a través de la actividad experimental de la síntesis del ácido acetil salicílico principio activo de la Aspirina®.

## Desarrollo: Contenidos temáticos

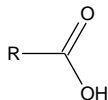
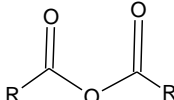
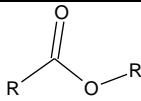
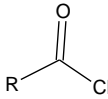
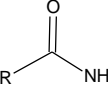
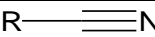
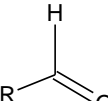
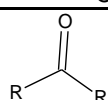
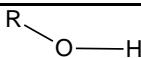
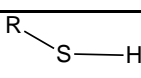
## 2. Grupos funcionales y reactividad química

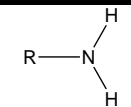
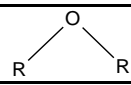
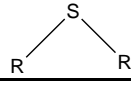
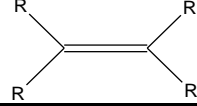
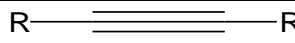

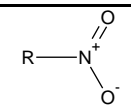

Los medicamentos contienen en su formulación una molécula o moléculas, llamadas principios activos, que son los responsables del efecto terapéutico. En la actualidad la mayoría de los principios activos que son utilizados en la medicina se obtienen por síntesis química, es decir, los laboratorios farmacéuticos realizan distintas reacciones químicas para obtener el compuesto deseado.

Las moléculas empleadas para obtener la gran diversidad de principios activos presentan en su estructura un átomo o átomos que son la parte reactiva de dicha molécula y a los que se les conoce como **grupo funcional**. Este grupo es el responsable de la reactividad. En la siguiente tabla se presentan los grupos funcionales más comunes en química orgánica.

Instrucciones para el diseñador: Cuando el usuario dé clic en “grupo funcional” aparece la siguiente tabla en una ventana emergente light box

Tabla de los principales grupos funcionales

Grupo funcional	Fórmula
Ácidos carboxílicos	
Anhidridos de ácido	
Ésteres	
Halogenuros de ácido	
Amidas	
Nitrilos	
Aldehídos	
Cetonas	
Alcoholes	
Mercaptanos	

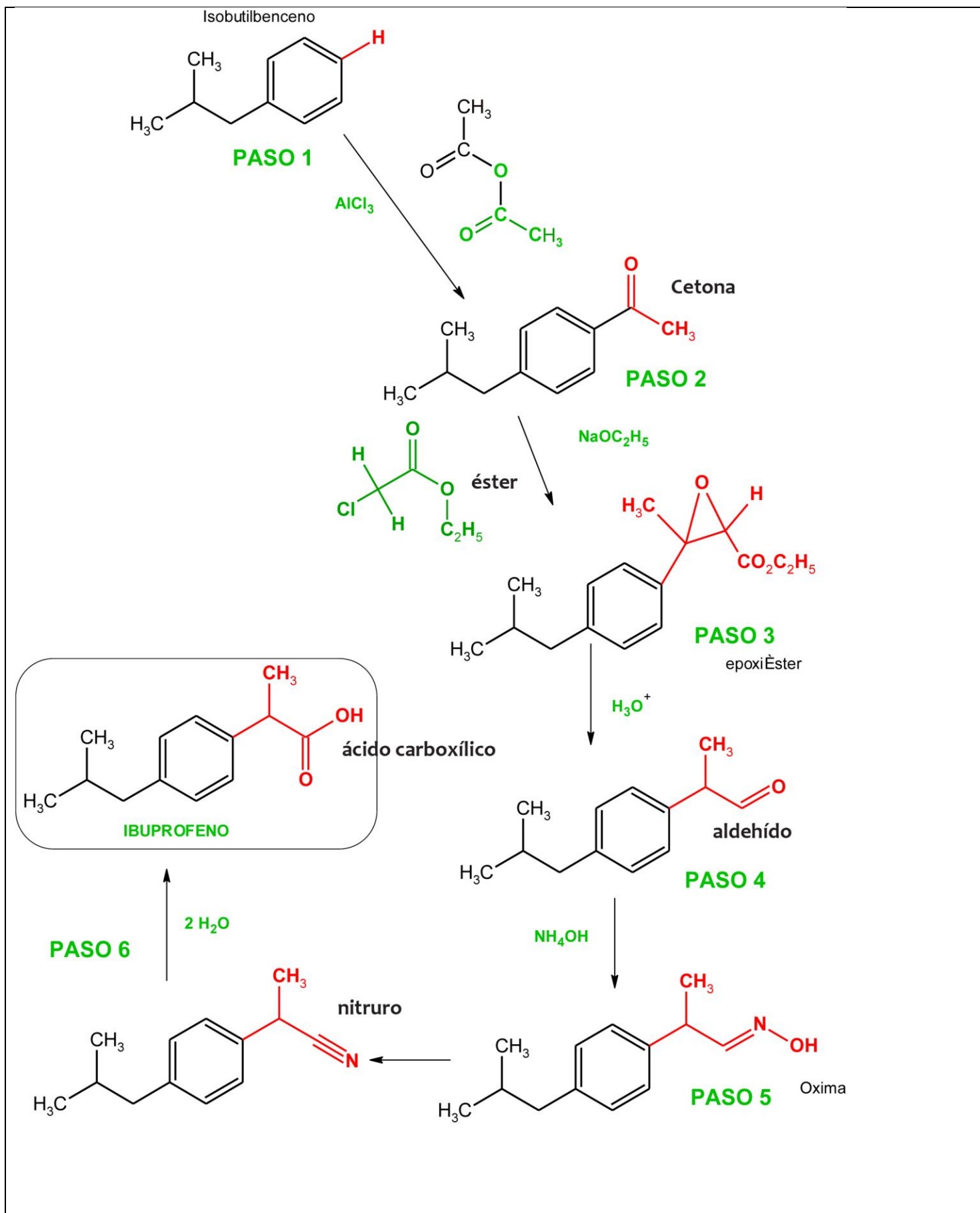
Aminas	
Éteres	
Sulfuros	
Alquenos	
Alquinos	
Halogenuros	
Nitro	
Alcanos	

La reactividad de los grupos funcionales no puede determinarse como fija o establecida por lo que no podemos tabularla, ya que depende de diversos factores como son: frente a que está reaccionando, la estructura global del producto y las condiciones de reacción (disolventes, catalizadores, temperatura, etc.). Por otra parte, en los aldehídos y cetonas el estado de oxidación formal del carbono carbonílico es +1 y +2, respectivamente. En los ácidos carboxílicos y sus derivados su número de oxidación es +3, lo que significa que un aldehído o cetona puede todavía oxidarse, con el reactivo apropiado, para dar un ácido carboxílico o derivado. Así los ácidos carboxílicos, aldehídos y cetonas pueden reducirse a alcanos o alquenos.

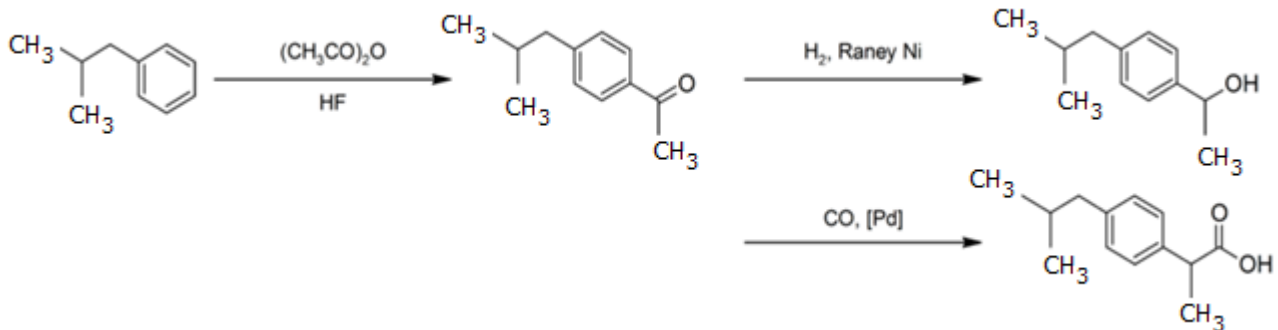
Los grupos funcionales son la parte reactiva de las moléculas, por lo que son muy importantes para la obtención del principio activo. En la siguiente figura se muestra la síntesis completa del ibuprofeno, en ella puedes observar que las moléculas que participan en la síntesis tienen diferentes grupos funcionales que son los reactivos y que permiten ir modificando paso a paso la molécula inicial hasta llegar al principio activo.

El ibuprofeno es el principio activo de varias marcas de productos comerciales como Advil, Motrin y Nuprin. Este compuesto actúa como analgésico (alivio del dolor) y como medicamento antiinflamatorio no **esteroidal** también se emplea para reducir la inflamación producida por la **artritis, osteoartritis y reumatismo**.

Para observar la síntesis completa debes dar clic sobre el grupo funcional resaltado en rojo de cada molécula y paso a paso se desplegará la molécula que se obtiene para que puedas observar el proceso de síntesis.



Existe otra síntesis del ibuprofeno, la cual requiere de solo tres pasos. Después de una **acilación** similar a la de la síntesis anterior, la hidrogenación con el níquel Raney dio el alcohol, que por **carbonilación** catalizada por paladio produjo la molécula fina:



Observa que en la síntesis del ibuprofeno no importa si es larga o corta, son los grupos funcionales quienes generan la reacción y así obtener el principio activo.

Como habrás observado los grupos funcionales son parte trascendental en las moléculas orgánicas, por eso es muy importante conocerlos e identificarlos. Ahora, te invito a que juntos realicemos un ejercicio de identificación de grupos funcionales presentes en diferentes moléculas, las cuales son el principio activo de muchos medicamentos que seguramente conoces o has escuchado.

### Ejercicio 1. Identificación de grupos funcionales en principios activos

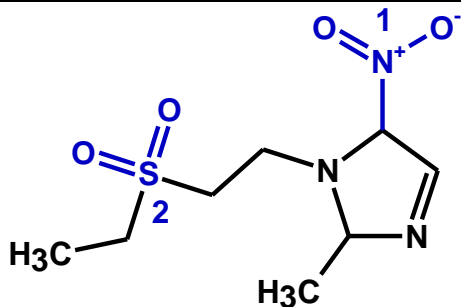
Al resolver el ejercicio identificarás el grupo funcional de algunos fármacos.

A continuación se te presentará la estructura de diferentes fármacos en los que se destaca su grupo funcional, identifícalo haciendo clic sobre la opción que indique sus nombres y si es correcto podrás ver su acción terapéutica. Puedes apoyarte en la tabla de grupos funcionales que está en este mismo tema.

¿Cuáles son los grupos funcionales indicados con los números 1 y 2?

#### 1. Tinidazol

1. Tinidazol	a) 1. Amida 2. Sulfhidrilo
	<b>b) 1. Nitro 2. Sulfóxido</b>  El tinidazol es útil en el tratamiento del absceso hepático amebiano, amebiasis intestinal, giardiasis, infecciones genitourinarias, neumonía, septicemia, sinusitis, tricomoniasis. Profilaxis de



infecciones perioperatorias en cirugía digestiva y ginecológica.

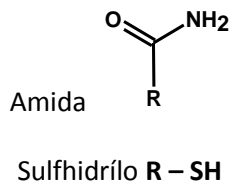
c) 1. Amina  
2. Azúfre

d) 1. Nitro  
2. Sulfhidrilo

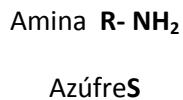
e) 1. Amina  
2. Sulfóxido

### Retroalimentación

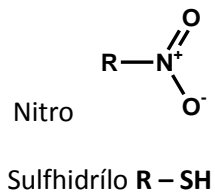
a) Recuerda qué:



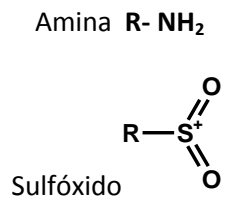
c) Recuerda qué:



d) Recuerda qué:

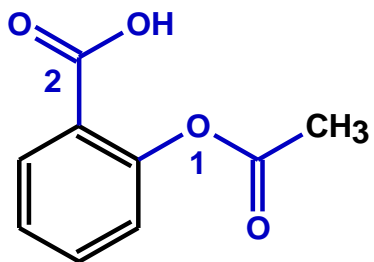


e) Recuerda qué:



### 2. Ácido acetilsalicílico

a) 1. Éter  
2. Alcohol



- b) 1. Cetona  
2. Aldehído

- c) 1. Éster  
2. Cetona

- d) 1. Éster  
2. Ácido carboxílico

El ácido acetilsalicílico, mejor conocido como aspirina, es utilizado como analgésico, anti-inflamatorio, antipirético y antitrombótico. El ácido acetilsalicílico es utilizado en el tratamiento de numerosas condiciones inflamatorias y autoinmunes como la artritis juvenil, la artritis reumatoide, y la osteoartritis. Por sus propiedades antitrombóticas se utiliza para prevenir o reducir el riesgo de infarto de miocardio y de ataques transitorios de isquemia.

- e) 1. Cetona  
2. Alcohol

a) Recuerda qué:

Éter  $R-O-R$

Alcohol  $R-O-H$

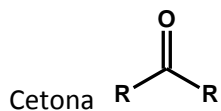
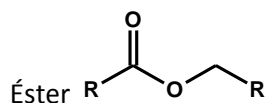
b) Recuerda qué:

Cetona  $R-C(=O)-R$

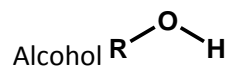
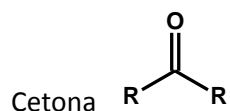
Aldehído  $R-C(=O)-H$



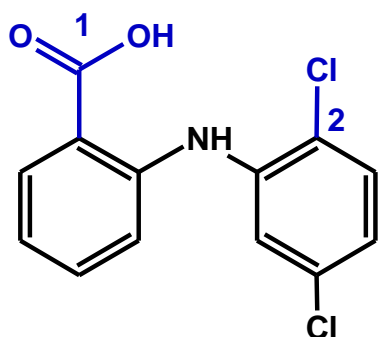
c) Recuerda qué:



e) Recuerda qué:



### 3. Diclofenaco



a) 1. Cetona  
2. Cloro

b) 1. Éster  
2. Carbono

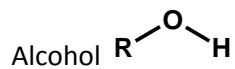
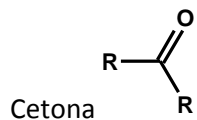
c) 1. **Ácido carboxílico**  
2. **Halógeno**

El diclofenaco sódico es un antiinflamatorio que posee actividades analgésicas y antipiréticas y está indicado por vía oral e intramuscular para el tratamiento de enfermedades reumáticas agudas, artritis reumatoide, espondilitis anquilosante, artrosis, lumbalgia, gota en fase aguda, inflamación postraumática y postoperatoria, cólico renal y biliar, migraña aguda, y como profilaxis para dolor postoperatorio y dismenorrea.

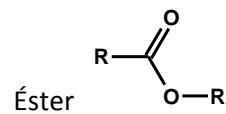
d) 1. Halógeno  
2. Cloro

e) 1. Metilo  
2. Ácido carboxílico

a) Recuerda qué:



b) Recuerda qué:

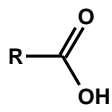


Carbono **C**

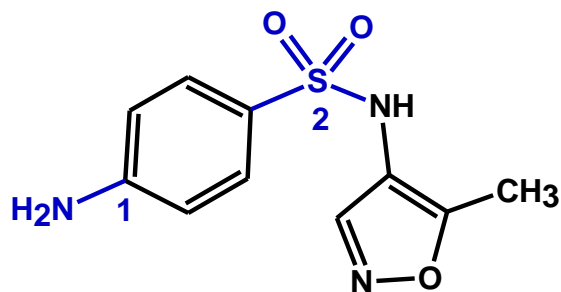
d) Recuerda qué:

Halógeno **R - X**  
(X puede ser F, Cl, Br, I)

e) Recuerda qué:

Metilo **R - CH<sub>3</sub>**  
Ácido carboxílico 

#### 4. Sulfametoxazona



a) 1. Nitro  
2. Sulfhidrilo

b) 1. Amida  
2. Sulfóxido

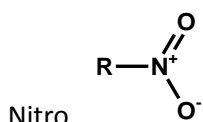
c) 1. Amina  
2. Sulfhidrilo

d) 1. Aldehído  
2. Azúfre

**e) 1. Amina  
2. Sulfóxido**

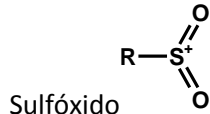
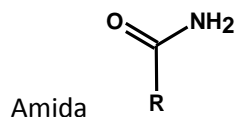
La combinación de sulfametoxazol y trimetoprima se usa para prevenir y tratar las infecciones, como la bronquitis, la infección del oído medio, las infecciones del tracto urinario y la diarrea del viajero. También es usada para prevenir y tratar la neumonía por *Pneumocystis carini*. Este medicamento no tiene efecto en los resfriados, la gripe u otras infecciones causadas por virus. También, este medicamento puede ser usado para otras condiciones según lo determine su médico.

a) Recuerda qué:



Sulfhidrilo  $\text{R}-\text{SH}$

b) Recuerda qué:



c) Recuerda qué:

Amina  $\text{R}-\text{NH}_2$

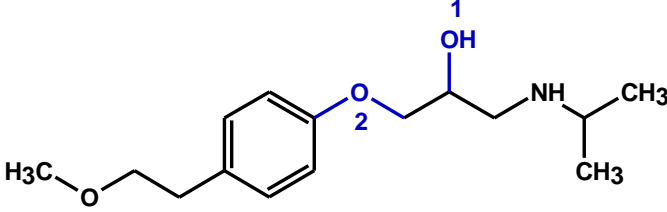
Sulfhidrilo  $\text{R}-\text{SH}$

d) Recuerda qué:

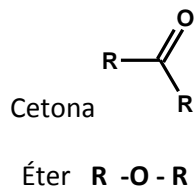


Azúfre  $\text{S}$

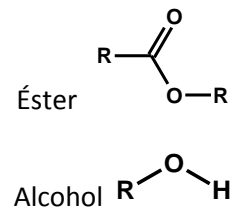
## 5. Metoprolol

	<p>a) 1. Cetona 2. Éter</p>
	<p>b) 1. Alcohol 2. Éster</p>
	<p>c) 1. Aldehído 2. Cetona</p>
	<p>d) 1. Amina 2. Ácido carboxílico</p>
	<p><b>e) 1. Alcohol 2.Éter</b></p> <p>El metoprolol se usa para tratar la presión arterial alta (hipertensión). También se usa para aliviar la angina (dolor de pecho) y para prevenir que se presenten más ataques al corazón en aquellos pacientes que hayan padecido anteriormente uno de estos ataques. También se puede usar para otras condiciones según lo determine su médico.</p>

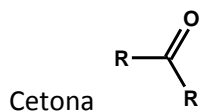
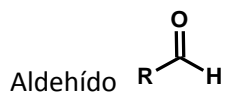
a) Recuerda qué:



b) Recuerda qué:



c) Recuerda qué:

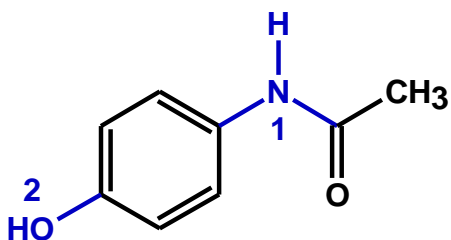


d) Recuerda qué:

Amina  $\text{R}-\text{NH}_2$



## 6. Paracetamol



a) 1. Amina  
2. Alcohol

El paracetamol es un analgésico y antipirético eficaz para el control del dolor leve o moderado causado por afecciones articulares, otalgias, cefaleas, dolor odontogénico, neuralgias, procedimientos quirúrgicos menores etc. También es eficaz para el tratamiento de la fiebre, como la originada por infecciones virales, la fiebre posvacunación, etcétera. Debido a que se metaboliza en el hígado, se debe administrar con precaución en pacientes con daño hepático, al igual que en aquellos que están recibiendo medicamentos hepatotóxicos o que tienen nefropatía. Tampoco se debe administrar por periodos prolongados ni en mujeres embarazadas.

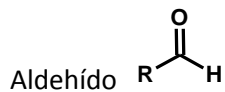
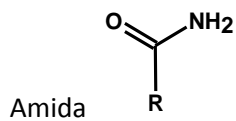
b) 1. Amida  
2. Aldehído

c) 1. Nitro  
2. Alcohol

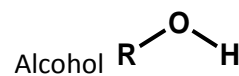
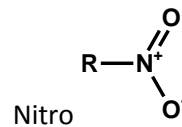
- d) 1. Nitro  
2. Ácido carboxílico

- e) 1. Amina  
2. Éter

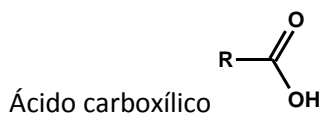
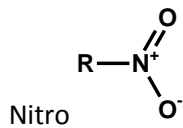
b) Recuerda qué:



c) Recuerda qué:



d) Recuerda qué:



e) Recuerda qué:

Amina  $R-NH_2$

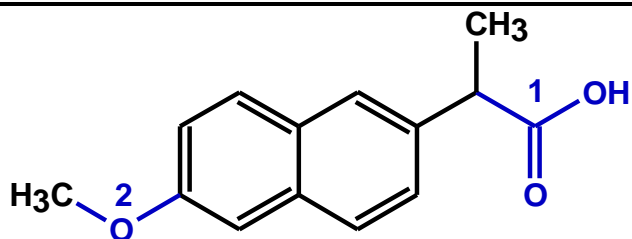
Éter  $R-O-R$

## 7. Naproxeno

- a) 1. Éter  
2. Éster

- b) 1. Ácido carboxílico  
2. Alcohol

- c) 1. Cetona  
2. Éster



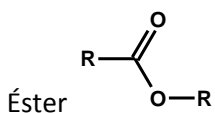
- d) 1. Ácido carboxílico  
2. Éter

*El naproxeno* es un antiinflamatorio no esterooidal con propiedades analgésicas, antitérmicas y antiinflamatorias. Actúa por inhibición central y periférica de la enzima ciclooxigenasa, interrumpiendo de esta manera la síntesis de prostaglandinas, importantes mediadores del dolor, fiebre e inflamación.

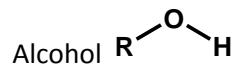
- e) 1. Alcohol  
2. Cetona

a) Recuerda qué:

Éter R -O - R



b) Recuerda qué:

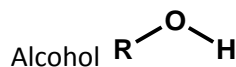
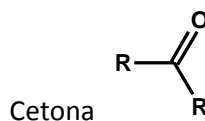


c) Recuerda qué:

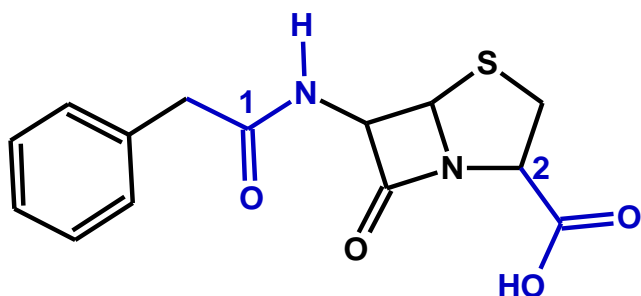
Halógeno R-X



d) Recuerda qué:



## 8. Penicilina



- a) 1. Amida  
2. Cetona

- b) 1. Nitro  
2. Alcohol

- c) 1. Amida  
2. Ácido carboxílico

La penicilina que encuentra su origen en un hongo denominado *Penicillium Notatum*. Es un antibiótico que mata bacterias e impide que éstas continúen con su crecimiento, sin embargo, sólo tiene el poder de combatir a aquellos microorganismos patógenos que se encuentran en crecimiento y multiplicación, y no a esos que aún se encuentran en estado latente.

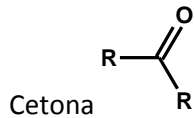
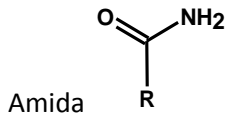
La penicilina es capaz de combatir efectivamente a las bacterias responsables de causar numerosas enfermedades, entre las que podemos encontrar los neumococos, los estreptococos, los gonococos, los meningococos, el *Clostridium tetani* y la espiroqueta. Los dos últimos son los responsables de causar tétanos y sífilis, respectivamente.

- d) 1. Amina  
2. Aldehído

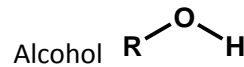
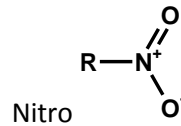
- e) 1. Cetona  
2. Ácido carboxílico



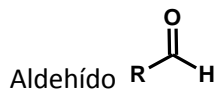
a) Recuerda qué:



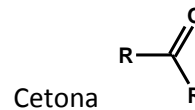
b) Recuerda qué:



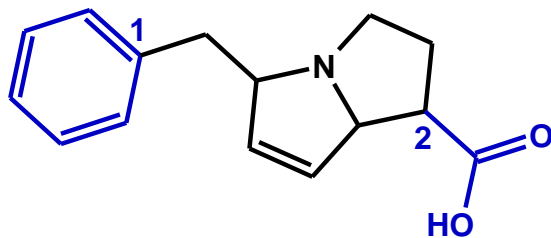
d) Recuerda qué:



e) Recuerda qué:



## 9. Ketorolaco



- a) 1. Éster  
2. Aldehído

- b) 1. Bencilo  
2. Ácido carboxílico

El ketorolaco se usa para aliviar el dolor. Pertenecce al grupo de medicamentos llamados analgésicos antiinflamatorios. El ketorolaco no es un narcótico ni produce hábito. Este medicamento no causa dependencia física o mental, como suelen hacerlo los narcóticos. Sin embargo, en algunos casos, el ketorolaco se usa junto con un narcótico, con el fin de obtener un alivio superior al que ofrecería cualquier otro medicamento que se use individualmente.

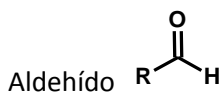
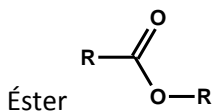
- c) 1. Halogenuro

2. Alcohol

d) 1. Amina  
2. Aldehído

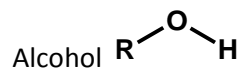
e) 1. Bencilo  
2. Cetona

a) Recuerda qué:



c) Recuerda qué:

Halogenuro  $R - X$

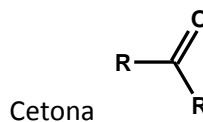
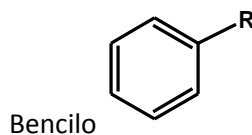


d) Recuerda qué:

Amina  $R - NH_2$



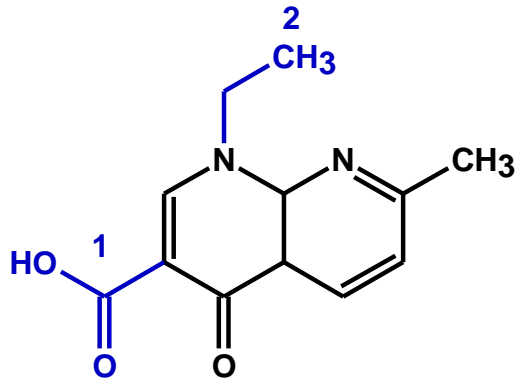
e) Recuerda qué:



## 10. Ácido nalidíxico

a) 1. **Ácido carboxílico**  
2. **Etilo**

El ácido nalidíxico se usa en el tratamiento de infecciones urinarias causadas por microorganismos como *Escherichia coli*, *Proteus*, *Shigella*, *Enterobacter*, y *Klebsiella*. Se emplea también en estudios de



los mecanismos de regulación de la división bacteriana.

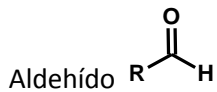
b) 1. Aldehído  
2. Metilo

c) 1. Bencilo  
2. Etilo

d) 1. Aldehído  
2. Etilo

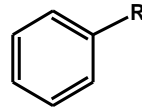
e) 1. Ácido carboxílico  
2. Metilo

b) Recuerda qué:



Metilo  $\text{R}-\text{CH}_3$

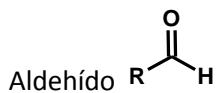
c) Recuerda qué:



Bencilo

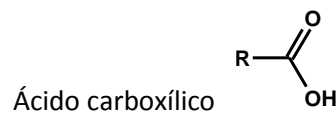
Etilo  $\text{R}-\text{CH}_2-\text{CH}_3$

d) Recuerda qué:



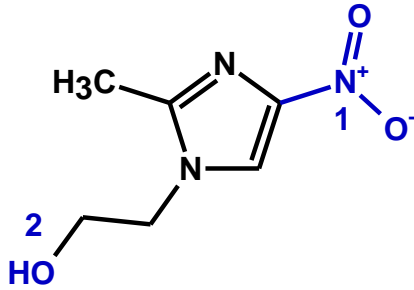
Etilo  $\text{R}-\text{CH}_2-\text{CH}_3$

e) Recuerda qué:



Metilo  $\text{R}-\text{CH}_3$

## 11. Metronidazol



- a) 1. Nitro  
2. Alcohol

El Metronidazol es un medicamento que se viene utilizando desde hace casi ya medio siglo para tratar infecciones provocadas por algunos tipos de bacterias y protozoos anaeróbicos. Es un antibiótico y antiparasitario que pertenece al grupo de los nitroimidazoles. Es utilizado para una amplia variedad de patologías como abscesos cerebrales, endocarditis infecciosas, infecciones óseas, articulares, pleuropulmonares y cutáneas.

Se emplea como tratamiento profiláctico en infecciones quirúrgicas, tratamientos de periodontitis y gingivitis, tratamientos de colitis C y tratamientos de giardiasis.

- b) 1. Amina  
2. Aldehído

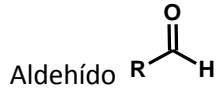
- c) 1. Éter  
2. Alcohol

- d) 1. Nitro  
2. Cetona

- e) 1. Amina  
2. Éster

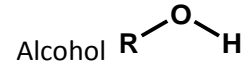
b) Recuerda qué:

Amina  $R-NH_2$

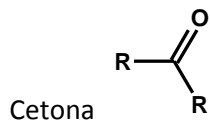
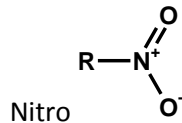


c) Recuerda qué:

Éter  $R-O-R$

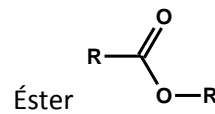


d) Recuerda qué:

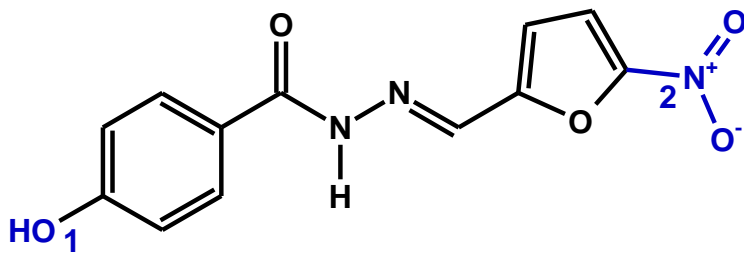


e) Recuerda qué:

Amina  $R-NH_2$



## 12. Nifuroxacina



a) 1. Aldehído  
2. Nitro

b) 1. Alcohol  
2. Amida

c) 1. Cetona  
2. Amina

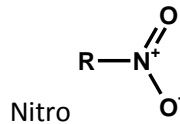
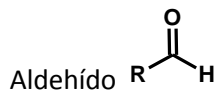
d) 1. Amina  
2. Ácido carboxílico

e) 1. Alcohol  
2. Nitro

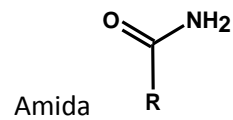
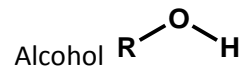
La nifuroxazida es un antiséptico intestinal con acción antibacteriana estrictamente local. Es activa *in vitro* sobre la mayoría de gérmenes

habituales presentes en las infecciones intestinales, independientemente de la susceptibilidad o resistencia de los antibióticos, pruebas que en nuestro medio no se efectúan regularmente para estas entidades patológicas para la selección primaria del tratamiento con un antibiótico.

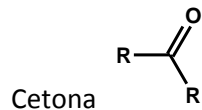
a) Recuerda qué:



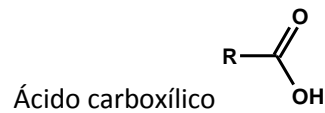
b) Recuerda qué:



c) Recuerda qué:



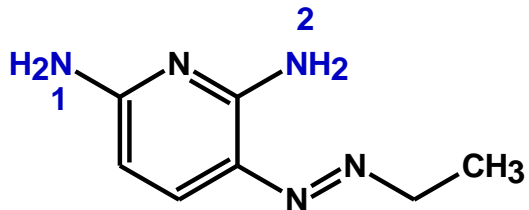
d) Recuerda qué:



### 13. Fenanzopiridina

a) 1. Amina  
2. Nitro

b) 1. Amida  
2. Aldehído



c) 1. Amida  
2. Amida

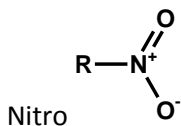
d) 1. Nitro  
2. Amida

e) **1. Amina**  
**2. Amina**

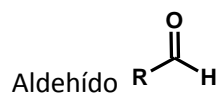
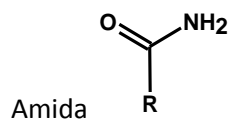
La fenazopiridina es un medicamento usado para aliviar el dolor, el ardor y la molestia, causados por la infección o la irritación del tracto urinario. Este medicamento no es un antibiótico y no curará la infección misma.

a) Recuerda qué:

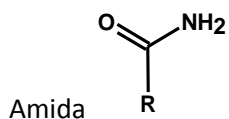
Amina  $R-NH_2$



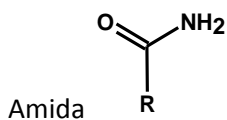
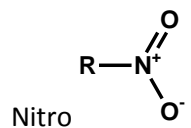
b) Recuerda qué:



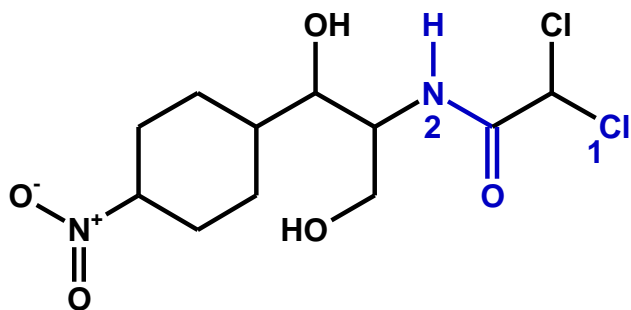
c) Recuerda qué:



d) Recuerda qué:



## 14. Cloranfenicol



- a) 1. Cloro  
2. Nitro

- b) 1. Halogenuro  
2. Amida

El cloranfenicol está indicado para el tratamiento de las infecciones externas del ojo y/o de sus anexos que afectan párpados, conjuntiva y/o córnea, causadas por microorganismos sensibles a los componentes de la fórmula, como: conjuntivitis, blefaritis, queratitis, queratoconjuntivitis, blefaroconjuntivitis, etc.

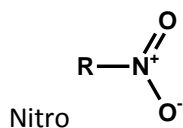
- c) 1. Cloro  
2. Ácido carboxílico

- d) 1. Cloro  
2. Amina

- e) 1. Halogenuro  
2. Amina

a) Recuerda qué:

Cloro **Cl**



c) Recuerda qué:

Cloro **Cl**





d) Recuerda qué:

Cloro Cl

Amina R - NH<sub>2</sub>

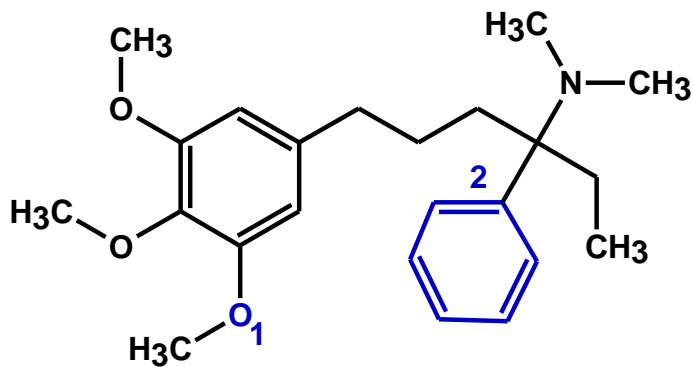
e) Recuerda qué:

Halogenuro R - X

(X puede ser F, Cl, Br, I)

Amina R - NH<sub>2</sub>

### 15. Trimebutina



a) 1. Éster  
2. Butilo

b) 1. Éster  
2. Cilohexano

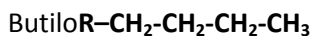
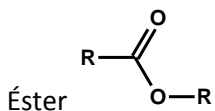
c) 1. Éter  
2. Bencilo

La trimebutina es un fármaco antiespasmódico, que se utiliza en el tratamiento del dolor abdominal y otros trastornos abdominales incluyendo el síndrome del colon irritable.

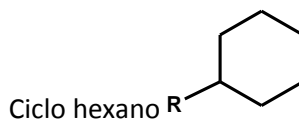
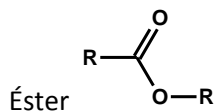
d) 1. Metilo  
2. Bencilo

e) 1. Éter  
2. Ciclohexano

a) Recuerda qué:

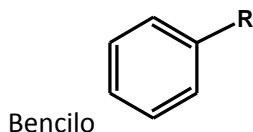


b) Recuerda qué:



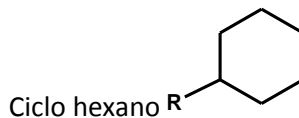
c) Recuerda qué:

Metilo  $R-CH_3$

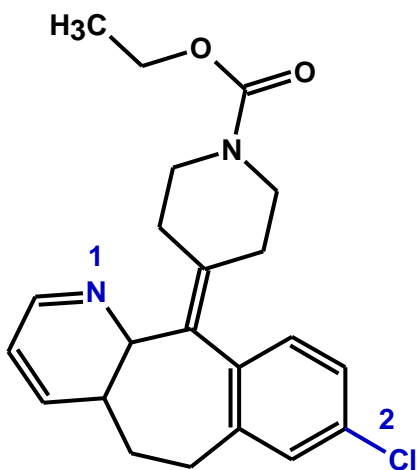


d) Recuerda qué:

Éter  $R-O-R$



## 16. Loratadina



a) 1. Amina  
2. Éter

b) 1. Nitro  
2. Cloro

c) 1. Amida  
2. Halogenuro

d) 1. Amina  
2. Halogenuro

Alivio de los síntomas de urticaria crónica y otras afecciones alérgicas dermatológicas. Alivio de los síntomas de la rinitis alérgica, como estornudos, rinorrea y prurito. Alivio de sintomatología de conjuntivitis alérgica, como lagrimeo y escozor de ojos.

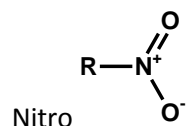
- e) 1. Amida  
2. Cloro

a) Recuerda qué:

Amina  $R - NH_2$

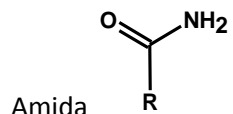
Éter  $R - O - R$

b) Recuerda qué:



Cloro  $Cl$

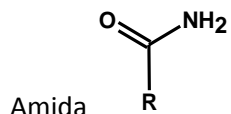
c) Recuerda qué:



Halogenuro  $R - X$

(X puede ser F, Cl, Br, I)

e) Recuerda qué:



Cloro  $Cl$

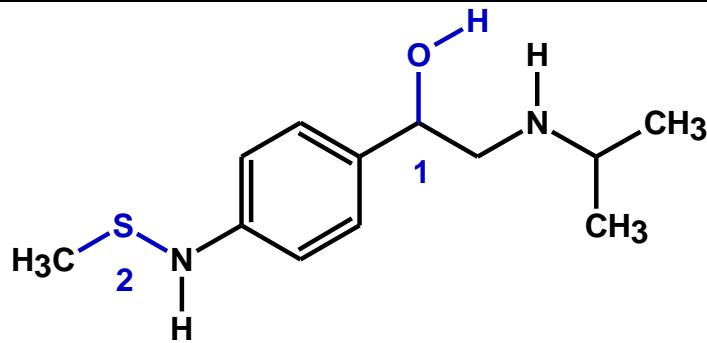
## 17. Sotalol

- a) 1. Cetona  
2. Sulfhidrilo

- b) 1. Alcohol  
2. Sulfóxido

- c) 1. Aldehído  
2. Sulfóxido

- d) 1. Aldehído

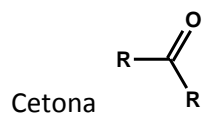


2. Azufre

El sotalol pertenece al grupo de medicamentos llamados betabloqueadores. Se usa para corregir los latidos irregulares.

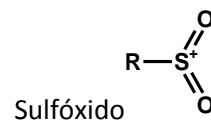
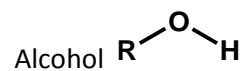
e) 1. Alcohol  
2. Sulfhidrilo

a) Recuerda qué:

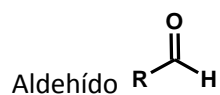


Sulfhidrilo R - SH

b) Recuerda qué:

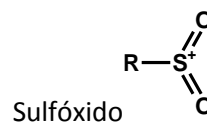
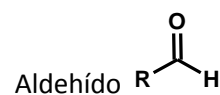


c) Recuerda qué:



Azufre S

d) Recuerda qué:



## 18. Celecoxib

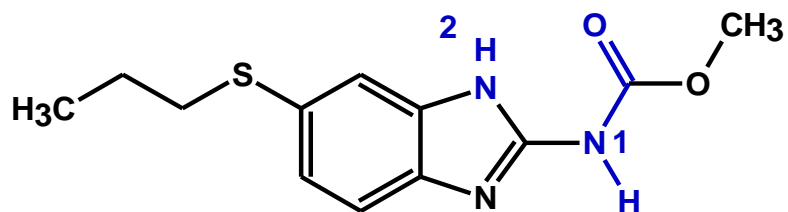
a) 1. Amina  
2. Halogenuro

El celecoxib es un medicamento del tipo antiinflamatorio indicado para el alivio del dolor en pacientes con osteoartritis y dismenorrea. También se utiliza para dolores agudos por traumatismos, osteoartritis y otras formas de

	artritis aguda, dolores de la menstruación.
	b) 1. Amida 2. Fluor
	c) 1. Nitro 2. Fluor
	d) 1. Amida 2. Halogenuro
	e) 1. Amina 2. Metilo

<p>b) Recuerda qué:</p> <p>Amida</p> <p>Fluor R - F</p>	<p>c) Recuerda qué:</p> <p>Nitro</p> <p>Fluor R - F</p>
<p>d) Recuerda qué:</p> <p>Amida</p> <p>Halogenuro R - X</p>	<p>e) Recuerda qué:</p> <p>Amina R - NH<sub>2</sub></p> <p>Metilo R - CH<sub>3</sub></p>

## 19. Albendazol



a) 1. Amina  
2. Ácido carboxílico

b) 1. Amina  
2. Amina

c) 1. Nitro  
2. Amina

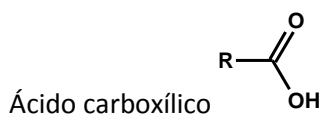
d) 1. Amida  
2. Amina

El albendazol se utiliza en el tratamiento de infecciones parasitarias, causadas por lombrices, anquilostomas, estrongiloidiasis, gusanos nematodos, tiña, tenia, oxiuros, entre otros. Es un fármaco antihelmíntico derivado de la familia de los benzimidazoles-carbamato.

e) 1. Amina  
2. Amida

a) Recuerda qué:

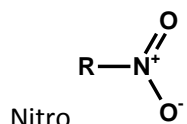
Amina  $R - NH_2$



b) Recuerda qué:

Amina  $R - NH_2$

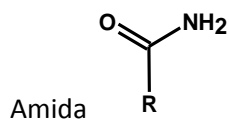
c) Recuerda qué:



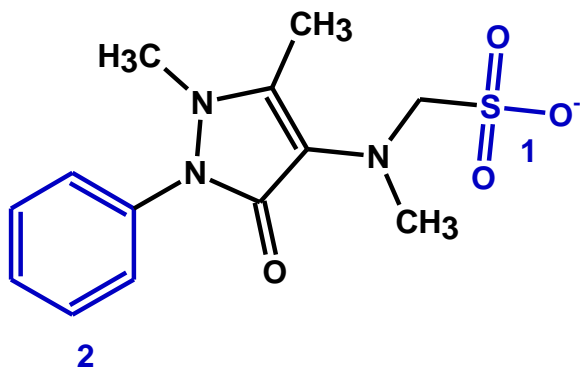
Amina R - NH<sub>2</sub>

e) Recuerda qué:

Amina R - NH<sub>2</sub>



## 20. Metamizol



a) 1.Sulfhidrilo  
2.Bencilo

b) 1. Sulfóxido  
2. Ciclohexano

c) **1. Sulfóxido**  
**2. Bencilo**

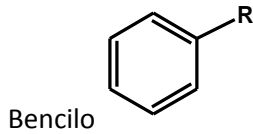
Está indicado para el dolor severo, dolor postraumático y quirúrgico, cefalea, dolor tumoral, dolor espasmódico asociado con espasmos del músculo liso como cólicos en la región gastrointestinal, tracto biliar, riñones y tracto urinario inferior. Reducción de la fiebre refractaria a otras medidas.

d) 1. Azufre  
2. Ciclohexano

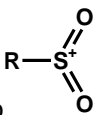
e) 1. Azufre  
2. Cicloheptano

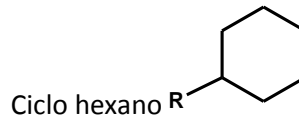
a) Recuerda qué:

Sulfhidrilo  $R - SH$



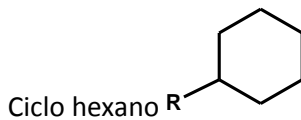
b) Recuerda qué:

Sulfóxido 



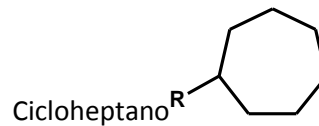
c) Recuerda qué:

Azufre  $S$

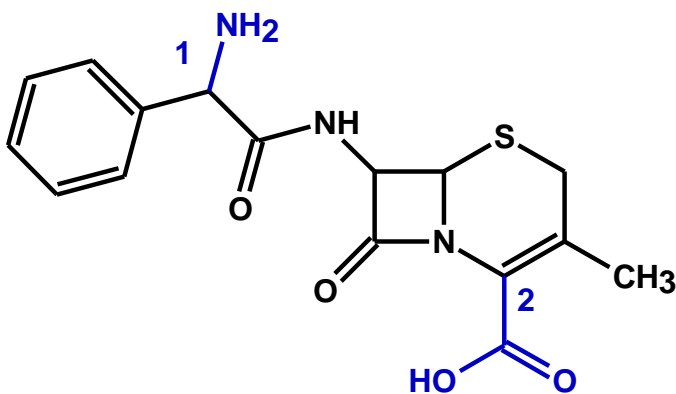


d) Recuerda qué:

Azufre  $S$



## 21. Cefalexina



a) 1. Amina  
2. Alcohol

b) 1. Amina  
2. Ácido carboxílico

La cefalexina está indicada como tratamiento en pacientes alérgicos a penicilinas, infecciones causadas por microorganismos sensibles y enfermedades en las que han fallado otros tratamientos como: infecciones en pacientes con fibrosis quística; profilaxis para intervenciones dentales, infecciones respiratorias bajas, sinusitis, infecciones de piel y tejidos blandos e infecciones de vías urinarias.

c) 1. Nitro  
2. Aldehído



d) 1. Amida  
2. Aldehído

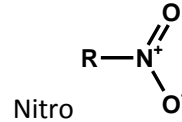
e) 1. Nitro  
2. Ácido carboxílico

a) Recuerda qué:

Amina  $R - NH_2$

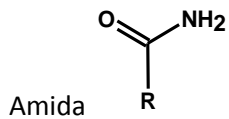
Alcohol  $R - O - H$

c) Recuerda qué:



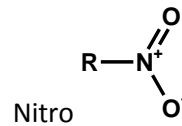
Aldehído  $R - C(=O) - H$

d) Recuerda qué:



Aldehído  $R - C(=O) - H$

e) Recuerda qué:

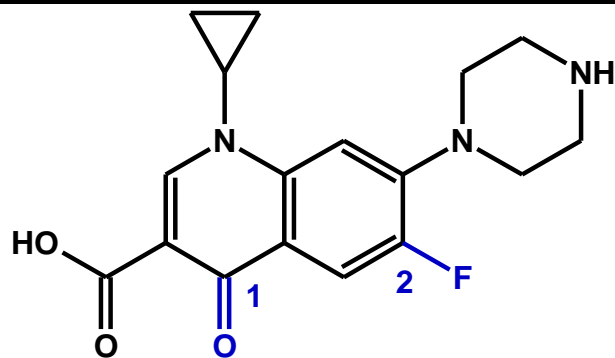


Ácido carboxílico  $R - C(=O) - OH$

## 22. Ciprofloxacino

a) 1. Cetona  
2. Halogenuro

El clorhidrato de ciprofloxacino es una sustancia antibacteriana de amplio espectro: *Infecciones de las*



vías urinarias, incluyendo pielonefritis y otras infecciones de vías altas y bajas, prostatitis aguda y crónica. *Infecciones de vías respiratorias* Neumonía, sinusitis, bronquitis aguda y crónica, reagudizaciones de la bronquitis crónica. *Infecciones de la piel* *Infecciones de huesos y articulaciones:* Osteomielitis, osteoartritis. *Infecciones complicadas de la cavidad abdominal* : Utilizado conjuntamente con otros antimicrobianos  
*Diarrea severa:* Cuando está indicado el tratamiento con fármacos antibacterianos.  
*Enfermedades de transmisión sexual:* Gonorrea en el hombre y la mujer  
*Fiebre tifoidea*  
*Tratamiento preventivo después de exposición al ántrax(carbunco) por inhalación*

b) 1. Ácido carboxílico  
2. Fluor

c) 1. Cetona  
2. Halogenuro

d) 1. Aldehído  
2. Fluor

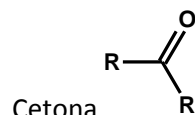
e) 1. Éster  
2. Fluor

b) Recuerda qué:



FluorF

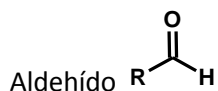
c) Recuerda qué:



Halogenuro R-X

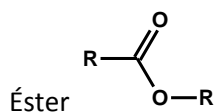
(X puede ser F, Cl, Br, I)

d) Recuerda qué:



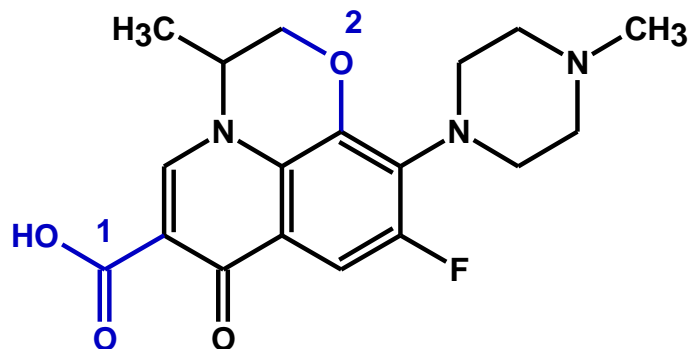
FluorF

e) Recuerda qué:



FluorF

### 23. Levofloxacinó



a) 1. Aldehído  
2. Cetona

b) 1. Ácido carboxílico  
2. Éster

c) 1. Éster  
2. Éter

d) 1. Aldehído  
2. Éster

e) 1. Ácido carboxílico  
2. Éter

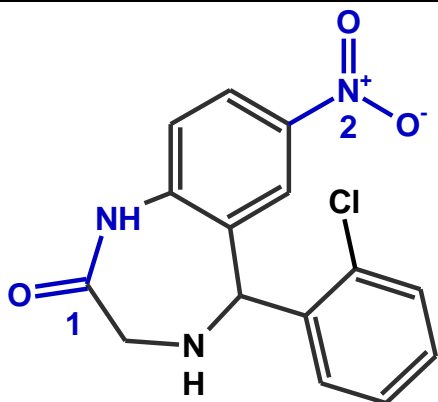
El levofloxacinó es efectivo en contra de un buen número de bacterias Gram positivas y Gram

	<p>negativas, por lo que se considera un antibiótico de amplio espectro. Por esa razón, se acostumbra administrar la levofloxacina de manera empírica en infecciones como la neumonía bacteriana, adquirida en la comunidad o infecciones urinarias antes de que se conozca el organismo causal específico.</p>
--	---

<p>a) Recuerda qué:</p> <p>Aldehído <math>\text{R}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{H}</math></p> <p>Cetona <math>\text{R}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{R}</math></p>	<p>b) Recuerda qué:</p> <p>Ácido carboxílico <math>\text{R}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{OH}</math></p> <p>Éster <math>\text{R}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{O}-\text{R}</math></p>
<p>c) Recuerda qué:</p> <p>Éster <math>\text{R}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{O}-\text{R}</math></p> <p>Éter <math>\text{R}-\text{O}-\text{R}</math></p>	<p>d) Recuerda qué:</p> <p>Aldehído <math>\text{R}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{H}</math></p> <p>Éster <math>\text{R}-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{O}-\text{R}</math></p>

**24. Clonazepam**

	<p>a) 1. Cetona 2. Nitro</p>
	<p>b) 1.Éster 2. Amida</p>



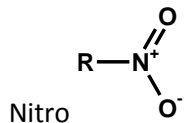
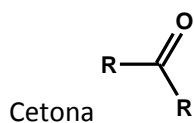
- c) 1. Amida  
2. Nitro

Clonazepam (Rivotril) está indicado como terapia de adición en el tratamiento de las convulsiones tónico-clónicas, convulsiones parciales simples y complejas, en convulsiones tónico-clónicas generalizadas y en el trastorno obsesivo-compulsivo. Clonazepam (Rivotril) está indicado en los diversos trastornos de ansiedad, en los síndromes fóbicos y ataques de pánico

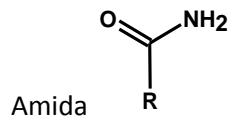
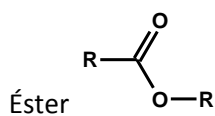
- d) 1. Ácido carboxílico  
2. Amina

- e) 1. Amina  
2. Amida

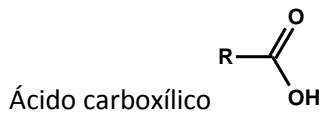
a) Recuerda qué:



b) Recuerda qué:



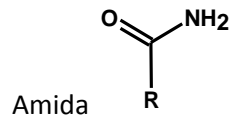
d) Recuerda qué:



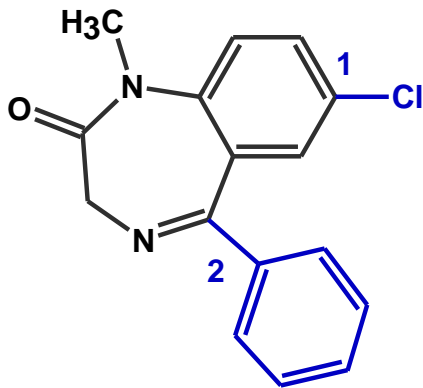
Amina R - NH<sub>2</sub>

e) Recuerda qué:

Amina R - NH<sub>2</sub>



## 25. Diazepam



- a) 1. Cloro  
2. Ciclohexano

- b) 1. Halogenuro  
2. Bencilo

El diazepam es utilizado como medicación preoperatoria en pacientes con ansiedad y estado de estrés. En psiquiatría es utilizado en el tratamiento de pacientes con estados de excitación asociada con ansiedad aguda y pánico, así como el *delirium tremens*. También está indicado en el tratamiento agudo del *status epilepticus* u otros estados convulsivos.

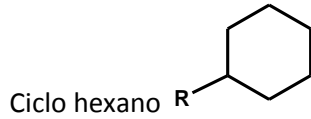
- c) 1. Bencilo  
2. Ciclohexino

- d) 1. Halogenuro  
2. Ciclohexano

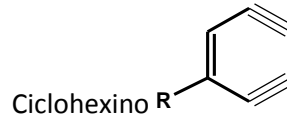
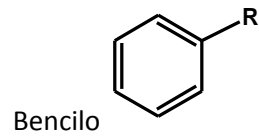
- e) 1. Cloro  
2. Ciclohexino

a) Recuerda qué:

Cloro **Cl**



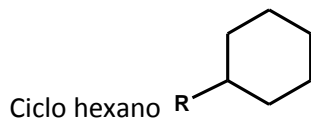
c) Recuerda qué:



d) Recuerda qué:

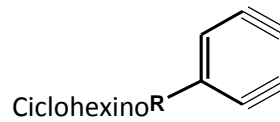
Halogenuro **R - X**

(X puede ser F, Cl, Br, I)

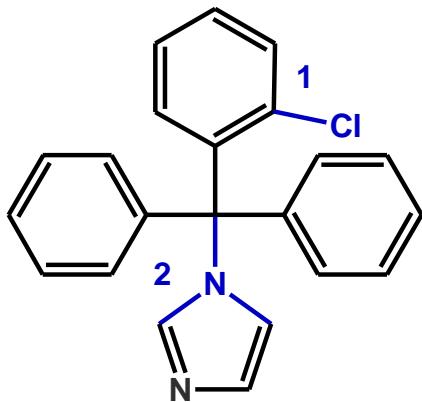


e) Recuerda qué:

Cloro **Cl**



## 26. Clotrimazol



a) 1. Cloro  
2. Nitro

b) 1. Cloro  
2. Amida

c) 1. Halogenuro  
2. Nitro

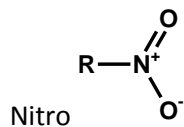
d) 1. Halogenuro  
2. Amina

El clotrimazol se usa para tratar las infecciones por hongos en la vagina, la boca y la piel, como el pie de atleta (tiña podal), la tiña crural o inguinal y la tiña corporal. También puede usarse para prevenir la candidiasis oral en ciertos pacientes.

- e) 1. Halogenuro  
2. Amida

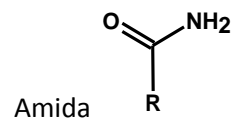
a) Recuerda qué:

Cloro Cl



b) Recuerda qué:

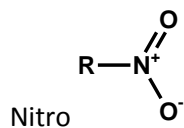
Cloro Cl



c) Recuerda qué:

Halogenuro R - X

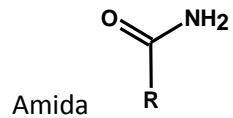
(X puede ser F, Cl, Br, I)



e) Recuerda qué:

Halogenuro R - X

(X puede ser F, Cl, Br, I)



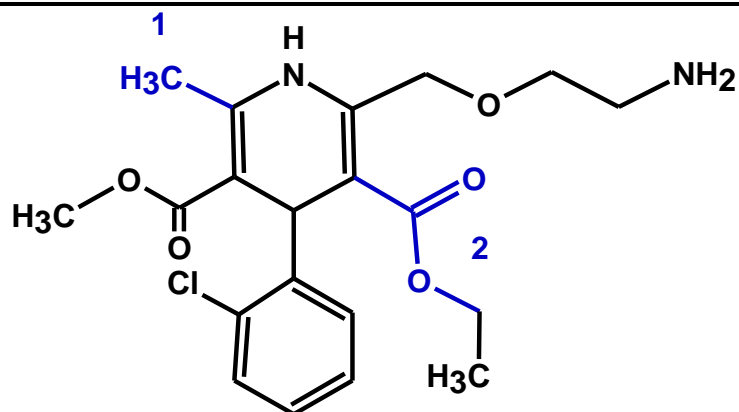
## 27. Amlodipina

- a) 1. Etilo  
2. Aldehído

- b) 1. Metilo  
2. Éster**

Amlodipina Merck está indicada en el tratamiento inicial de la hipertensión y puede ser utilizada como agente único para el control de la presión arterial.





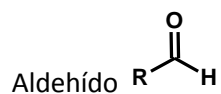
c) 1. Etilo  
2. Cetona

d) 1. Butilo  
2. Éster

e) 1. Metilo  
2. Ácido carboxílico

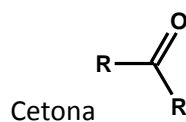
a) Recuerda qué:

Etilo  $R - CH_2 - CH_3$



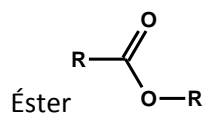
c) Recuerda qué:

Etilo  $R - CH_2 - CH_3$



c) Recuerda qué:

Butilo  $R - CH_2 - CH_2 - CH_2 - CH_3$



d) Recuerda qué:

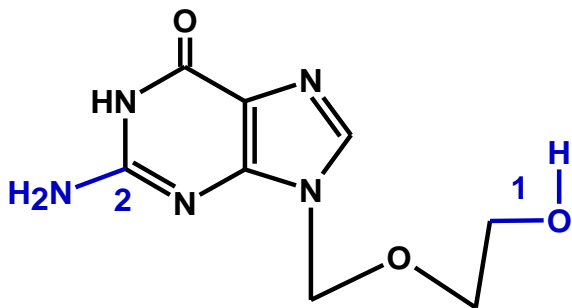
Metilo  $R - CH_3$



## 28. Aciclovir

a) 1. Aldehído  
2. Nitro

b) 1. Alcohol



2. Amida

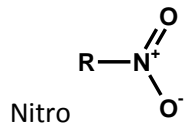
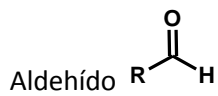
c) 1. Cetona  
2. Amina

d) 1. Éter  
2. Nitro

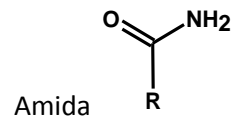
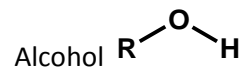
**e) 1. Alcohol  
2. Amina**

El aciclovir es un agente antiviral altamente efectivo *in vitro* en contra de los virus del herpes simple tipos 1 y 2 y el virus de la varicela zoster.

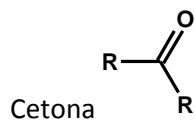
a) Recuerda qué:



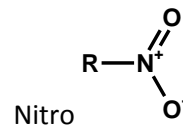
b) Recuerda qué:



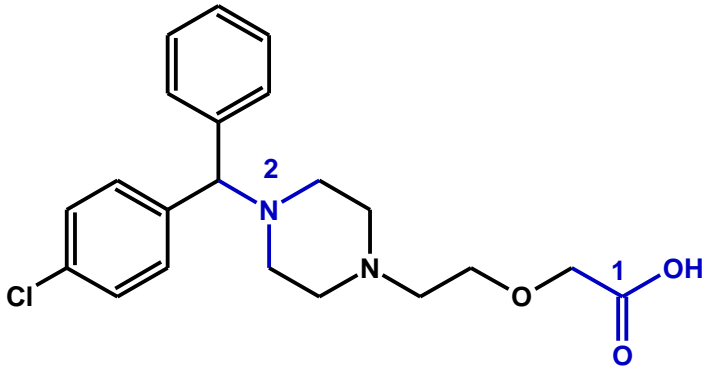
c) Recuerda qué:



d) Recuerda qué:



## 29. Levocetirizina



- a) 1. Ácido carboxílico  
2. Amina

La levocetirizina se usa para aliviar el escurrimiento nasal; los estornudos; y el enrojecimiento, la comezón y el lagrimeo de los ojos resultantes de la fiebre del heno, alergias estacionales y alergias a otras sustancias como ácaros del polvo, caspa de animales y moho. También se usa para tratar síntomas de urticaria, como prurito y sarpullido.

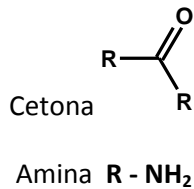
- b) 1. Cetona  
2. Amina

- c) 1. Aldehído  
2. Amida

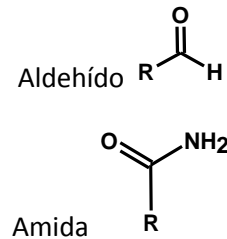
- d) 1. Ácido carboxílico  
2. Nitro

- e) 1. Éster  
2. Amida

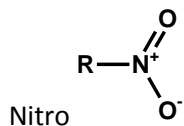
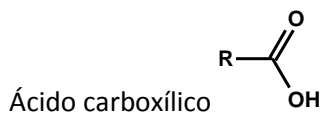
b) Recuerda qué:



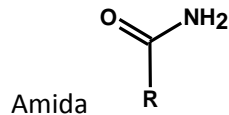
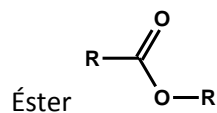
c) Recuerda qué:



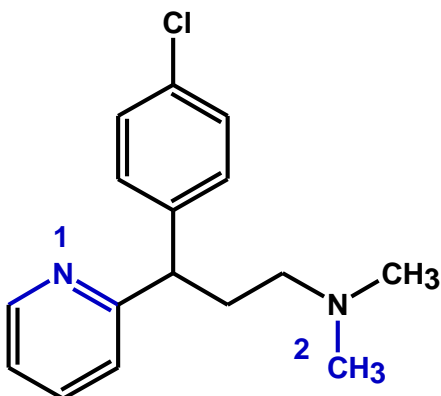
d) Recuerda qué:



e) Recuerda qué:



### 30. Clorfenamina



- a) 1. Amida  
2. Etilo

- b) 1. Amina  
2. Metilo

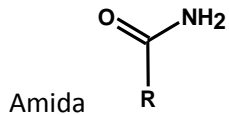
La clorfenamina es un antihistamínico indicado en rinitis alérgica estacional y perenne, conjuntivitis alérgica, alergias cutáneas no complicadas, rinitis vasomotora, urticaria, angioedema (edema angioneurótico), eccema alérgico, dermatitis atópica y de contacto, reacciones de hipersensibilidad a medicamentos, reacciones anafilácticas conjuntamente con epinefrina.

- c) 1. Nitro  
2. Etilo

- d) 1. Nitro  
2. Propilo

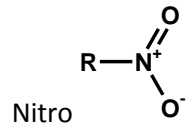
- e) 1. Amina  
2. Etilo

a) Recuerda qué:



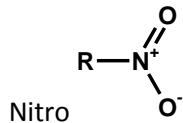
Etilo  $R - CH_2 - CH_3$

b) Recuerda qué:



Etilo  $R - CH_2 - CH_3$

c) Recuerda qué:



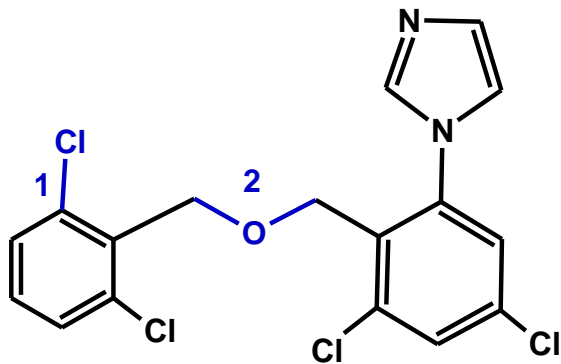
Propilo  $R - CH_2 - CH_2 - CH_3$

d) Recuerda qué:

Amina  $R - NH_2$

Etilo  $R - CH_2 - CH_3$

### 31. Isoconazol



a) 1. Halogenuro  
2. Éster

b) 1. Cloro  
2. Cetona

c) 1. Halogenuro  
2. Alcohol

d) 1. Cloro  
2. Aldehído

e) 1. Halogenuro  
2. Éter

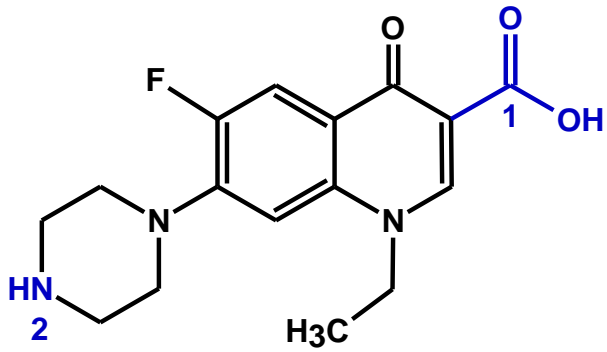
El isoconazol es un antimicótico de amplio espectro, indicado en el tratamiento de micosis superficiales

	<p>de la piel como en los espacios interdigitales de los pies, en las manos, en la ingle y en la región genital, eritrasma. También está indicado para el tratamiento de la balanitis candidomycótica, siendo por ello apropiado para la profilaxis de las reinfecciones genitales.</p>	
--	---	--

<p>a) Recuerda qué:</p> <p>Halogenuro <math>R-X</math></p> <p>(X puede ser F, Cl, Br, I)</p> <p>Éster</p> $\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{R}-\text{C} \\ \diagdown \\ \text{O}-\text{R} \end{array}$	<p>b) Recuerda qué:</p> <p>Cloro <math>\text{Cl}</math></p> <p>Cetona</p> $\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{R}-\text{C}-\text{R} \end{array}$
<p>c) Recuerda qué:</p> <p>Halogenuro <math>R-X</math></p> <p>(X puede ser F, Cl, Br, I)</p> <p>Alcohol</p> $\begin{array}{c} \text{O} \\ \diagup \quad \diagdown \\ \text{R}-\text{O}-\text{H} \end{array}$	<p>d) Recuerda qué:</p> <p>Cloro <math>\text{Cl}</math></p> <p>Aldehído</p> $\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{R}-\text{C}-\text{H} \end{array}$

**32. Norfloxacin**

	<p>a) <b>1. Ácido carboxílico</b> <b>2. Amina</b></p> <p>Tratamiento de las infecciones del tracto urinario superior e inferior, incluyendo cistitis (inflamación de la vejiga urinaria), pielitis (inflamación de la pelvis renal), cistopielitis (inflamación de la</p>
--	---



vejiga urinaria y de la pelvis renal) y pielonefritis (inflamación de la pelvis renal y del tejido renal), causadas por bacterias sensibles a norfloxacin.

b) 1. Alcohol  
2. Amida

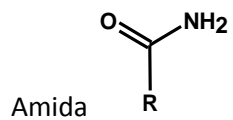
c) 1. Aldehído  
2. Nitro

d) 1. Cetona  
2. Amina

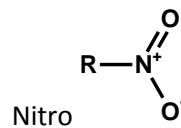
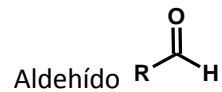
e) 1. Éster  
2. Amida

a) Recuerda qué:

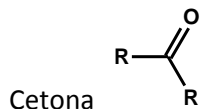
Alcohol  $R-OH$



b) Recuerda qué:

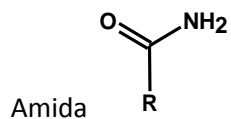
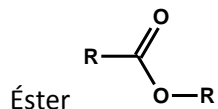


c) Recuerda qué:

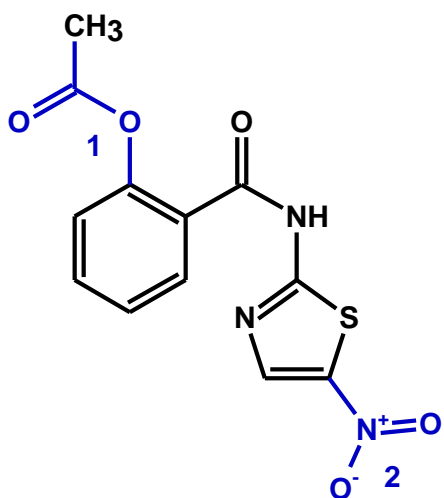


Amina  $R - NH_2$

d) Recuerda qué:



### 33. Nitazoxanida



a) 1. Éter  
2. Amida

b) 1. Ácido carboxílico  
2. Nitro

c) 1. Cetona  
2. Amina

d) 1. Éster  
2. Nitro

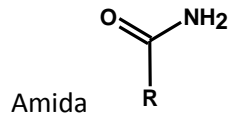
La nitazoxanida se usa en niños y adultos para tratar la diarrea causada por el protozoo *criptosporidio* o *giardia*. Funciona al detener el crecimiento de protozoos que causan diarrea.

e) 1. Aldehído  
2. Amina

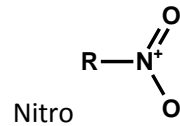
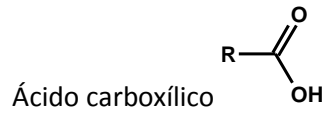


a) Recuerda qué:

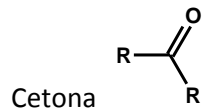
Éter  $R-O-R$



b) Recuerda qué:

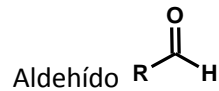


c) Recuerda qué:



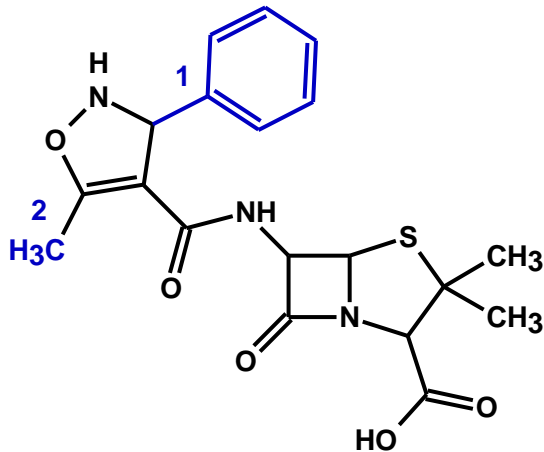
Amina  $R-NH_2$

e) Recuerda qué:



Amina  $R-NH_2$

### 34. Oxacilina



a) 1. Ciclohexano  
2. Metilo

b) 1. Bencilo  
2. Metilo

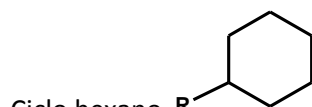
La oxacilina pertenece al grupo de medicamentos llamados penicilinas. Se usa para tratar las infecciones causadas por bacterias. Este medicamento no sirve para el tratamiento de los resfriados, la gripe u otras infecciones por virus.

c) 1. Ciclohexano  
2. Etilo

d) 1. Ciclohexano  
2. Metilo

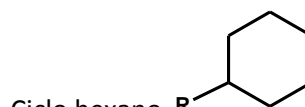
- e) 1. Bencilo  
2. Etilo

a) Recuerda qué:



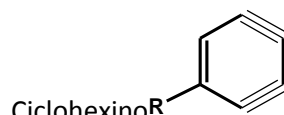
Metilo  $R - CH_3$

c) Recuerda qué:



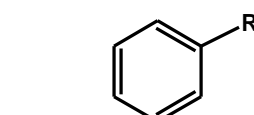
Etilo  $R - CH_2 - CH_3$

d) Recuerda qué:



Metilo  $R - CH_3$

e) Recuerda qué:



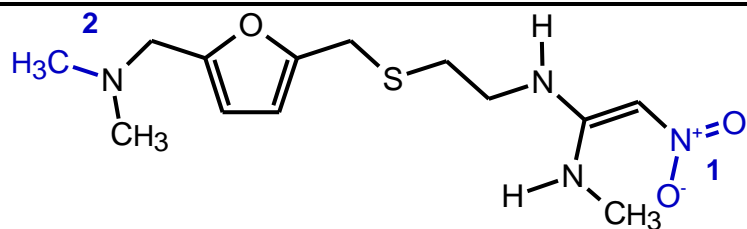
Etilo  $R - CH_2 - CH_3$

### 35. Ranitidina

- a) 1. Amida  
2. Metilo

- b) 1. Nitro  
2. Etilo

- c) 1. Aldehído  
2. Etilo

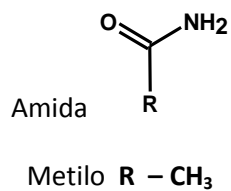


d) 1. Nitro  
2. Metilo

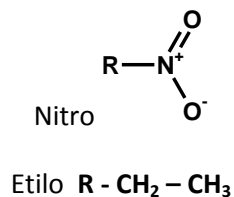
La ranitidina se usa para tratar úlceras; reflujo gastroesofágico, una condición en la que el reflujo del ácido del estómago provoca pirosis (calor estomacal) y lesiones en el tubo alimenticio (esófago); y en aquellas condiciones en las que el estómago produce demasiado ácido, como el síndrome de Zollinger-Ellison. Reduce la cantidad de ácido producido en el estómago.

e) 1. Amina  
2. Propilo

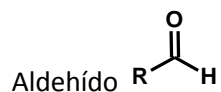
a) Recuerda qué:



b) Recuerda qué:



c) Recuerda qué:



e) Recuerda qué:



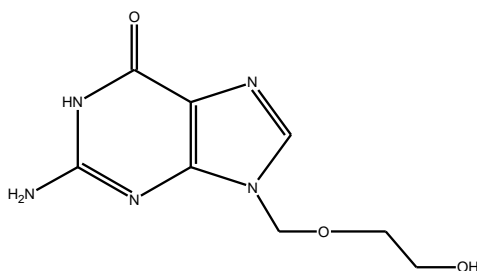
### 3. Los grupos funcionales y las propiedades de las moléculas orgánicas

Fichero con los siguientes conceptos: Macrólidos y Tetraciclinas. Las definiciones están en el glosario

Hasta el momento hemos visto que los grupos funcionales son los responsables de la reactividad de una molécula orgánica y lo analizamos mediante una reacción de síntesis del Ibuprofeno. Ahora analizaremos como es que los grupos funcionales determinan las propiedades de las moléculas.

Una molécula de principio activo posee una estructura específica y presenta determinados grupos funcionales que serán activos para el tratamiento de cierta enfermedad o adecimiento, sin embargo, si modificamos la estructura o cambiamos alguno de los grupos funcionales, entonces la molécula puede resultar más o menos activa al cambiar su capacidad de unión al sitio activo de una proteína, al tener menor absorción o permanencia en el organismo.

Veamos un ejemplo, el Aciclovir (Zovirax, Lisan, Cicloferon) es un medicamento que se emplea para el tratamiento de infecciones por el virus del Herpes simple (HVS) tipo 1 y 2. El HVS tiene la enzima timidina kinasa (TK), que es el centro de activación del Aciclovir. Los análogos de nucleosidos bloquean el proceso de replicación viral, primero se inicia la fosforilación por la enzima TK, y subsecuentemente se termina la elongación del ADN de la AND polimerasa viral. La cadena hidroxietoximetil del Aciclovir se une a distintos residuos de los aminoácidos (Lys-62, Glu-83, Asp-162 y Arg-163) de la TK por puentes de hidrógeno, por otra parte, el anillo de la guanina se une por el grupo  $-\text{NH}_2$ , a la cadena del carbonilo del Gln-125 de la TK.



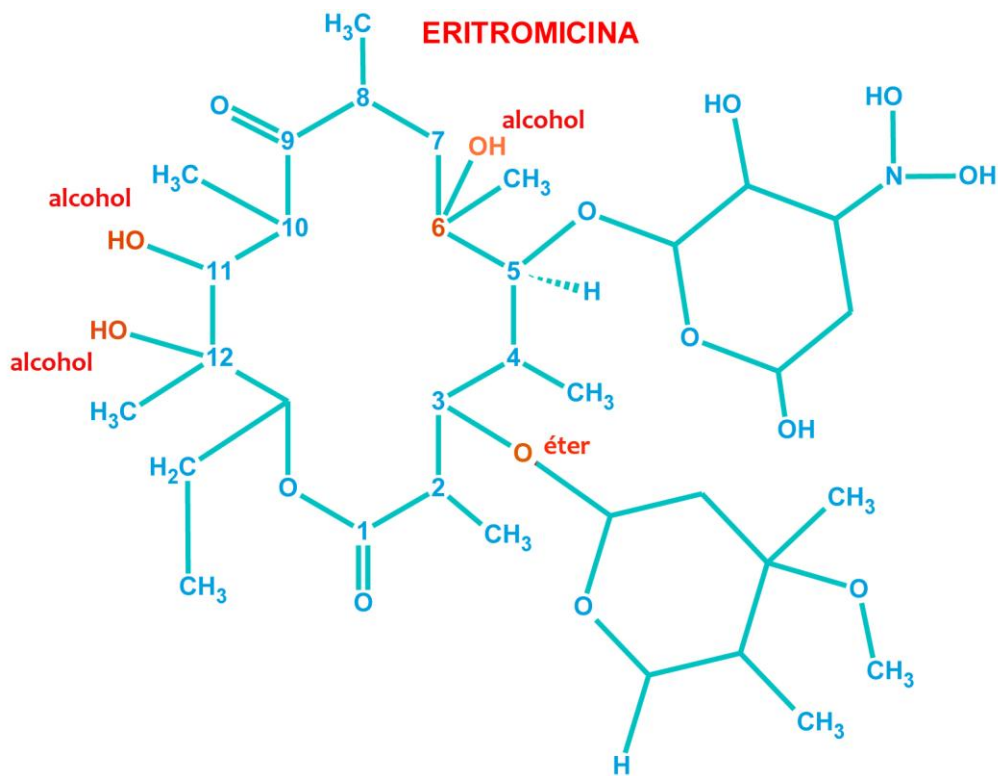
Estructura del Aciclovir (9-[(2-hidroxietoxi)metil]guanina)

## Inicio de fichero

### a. Macrólidos

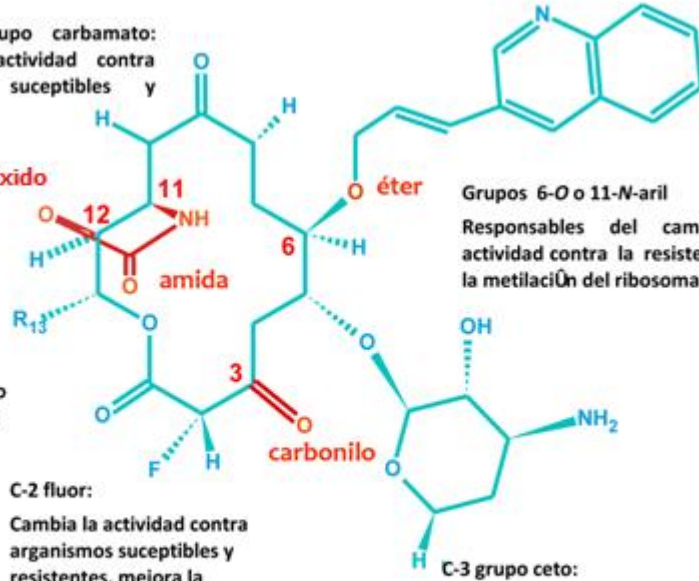
Te invito a que veas las siguientes estructuras correspondientes a una serie de antibióticos llamados **Macrólidos** (molécula con una estructura cíclica muy grande), la primera de ellas corresponde a la Eritromicina, la segunda a un fármaco prototipo y la tercera a la Telitromicina, los dos últimos son derivados de la primera.

Muchos microorganismos desarrollaron resistencia a la eritromicina por lo que fue necesario desarrollar nuevos fármacos que fueran más eficaces. Por tal motivo, la estructura base de la eritromicina se modificó cambiando los grupos funcionales en los carbonos 3, 6, 11 y 12. El comportamiento dentro del organismo y hacia las bacterias mejoró notablemente tan sólo por cambiar algunos grupos funcionales.



C-11, 12 grupo carbamato:  
Cambia la actividad contra  
organismos susceptibles y  
resistentes

epóxido



Grupos 6-O o 11-N-aryl

Responsables del cambio de  
actividad contra la resistencia a  
la metilación del ribosoma

C-13  
Grupos selectos  
Promueven  
actividad y espectro  
de acción similares

C-2 fluor:

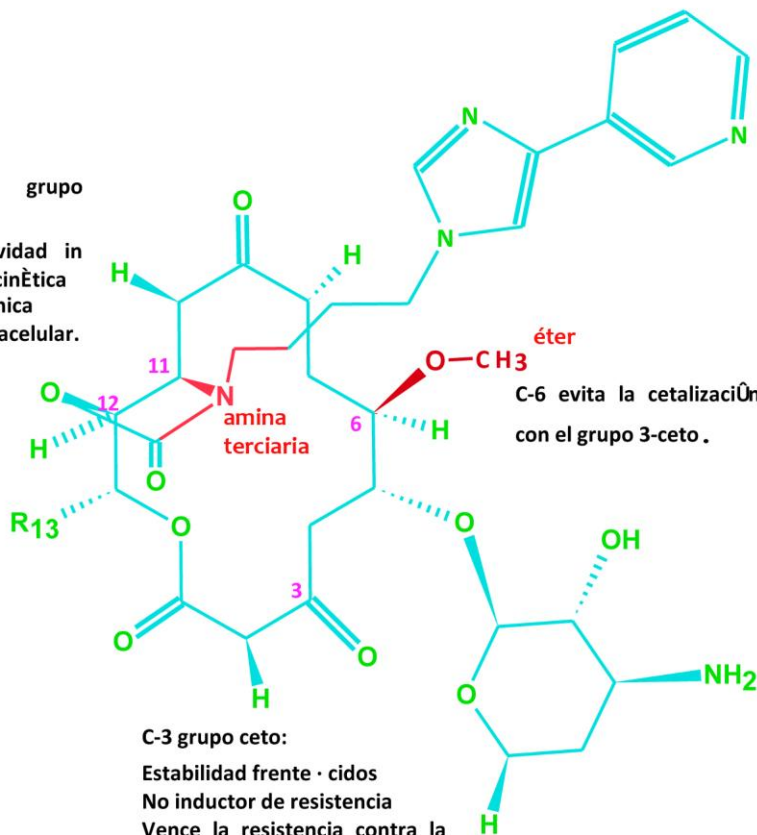
Cambia la actividad contra  
organismos susceptibles y  
resistentes, mejora la  
farmacocinética

C-3 grupo ceto:

Responsable del cambio de  
actividad contra la bomba de  
flujo del antibiótico

C-11 y 12 grupo carbamato:

Potencia actividad in vitro  
Farmacocinética  
Farmacodinámica  
Captación intracelular.

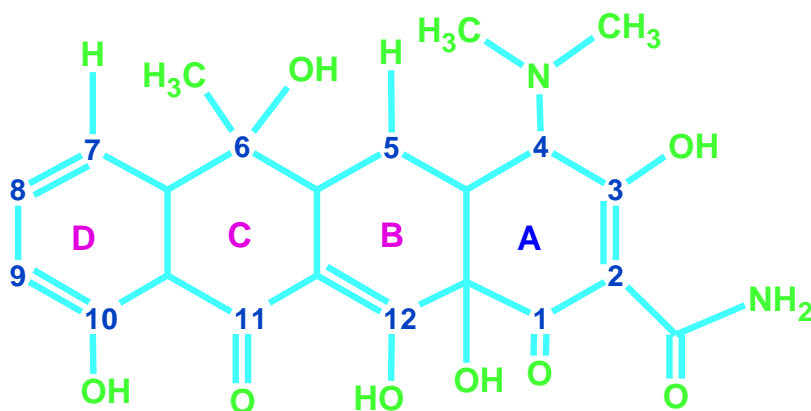


C-3 grupo ceto:

Estabilidad frente a ácidos  
No inductor de resistencia  
Vence la resistencia contra la eritromicina

## b. Tetraciclinas

Estas son otras estructuras correspondientes a antibióticos muy usados en nuestros días: las tetraciclinas. La primera de ellas es la tetraciclina, esta se usa para tratar infecciones en piel, acné, infecciones por riquetsias, clamidias e infecciones periodontales. La familia de este antibiótico tiene en común los cuatro anillos fusionados marcados con las letras A, B, C y D.

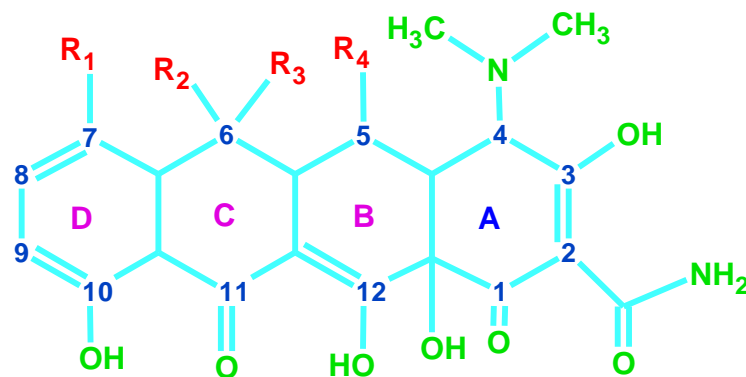


Tetraciclina

Existen algunos sitios tradicionales (**R1**, **R2**, **R3** y **R4**), que al modificar los grupos funcionales en estas posiciones se obtienen distintos fármacos con actividades farmacológicas distintas como los muestra la siguiente tabla.

Compuesto	R1	R2	R3	R4
Clortetraciclina	Cl	CH <sub>3</sub>	OH	H
Doxiciclina	H	CH <sub>3</sub>	H	OH
Minociclina	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	H
Oxitetraciclina	H	CH <sub>3</sub>	OH	OH
Tetraciclina	H	CH <sub>3</sub>	OH	H

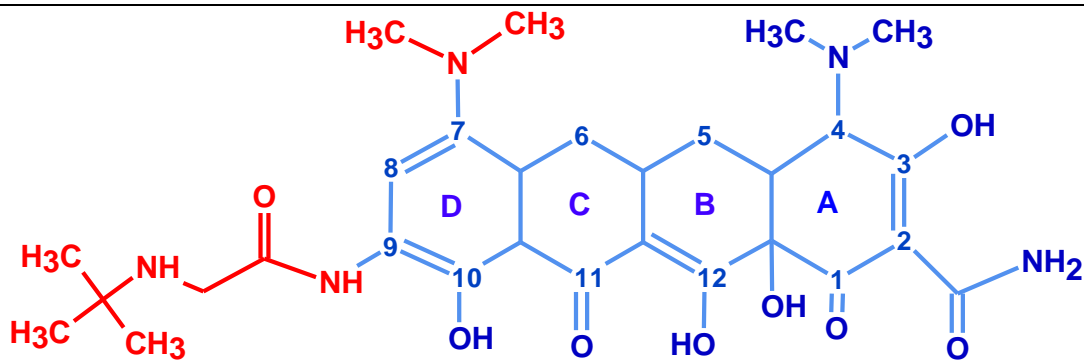
La siguiente imagen muestra la estructura base del grupo de antibióticos llamados tetraciclinas, en ella se han marcado las posiciones de los carbonos 5, 6 y 7 en donde tradicionalmente se hacen las modificaciones estructurales.



La siguiente estructura corresponde a la Tigeciclina en ella se modificaron los grupos funcionales correspondientes a los carbonos 7 y 9, lo que generó un antibiótico innovador que fue aceptado y aprobado por la Agencia Federal de Drogas (FDA), en el año 2005.

Da clic sobre los grupos funcionales marcados con rojo y entérate de que propiedad son responsables los diferentes grupos funcionales presentes en la Tetraciclina.





Tigeciclina (Tigacil o GAR-936)

Da clic sobre el nombre del antibiótico para que descubras algunas propiedades de este principio activo.

Se usa para tratamiento por infecciones en piel, acné, infecciones sub-epidérmicas, sarcoïdosis cutánea, rosacea, periodontitis, escleroderma, colitis, perforaciones duodenales gástricas.

Fin de fichero

#### 4. Condiciones de reacción

Una reacción química es un proceso en el que un conjunto de sustancias llamadas reactivo se transforman en un nuevo conjunto de sustancias llamadas productos. En otras palabras, una reacción química es el proceso mediante el cual tiene lugar una transformación química.

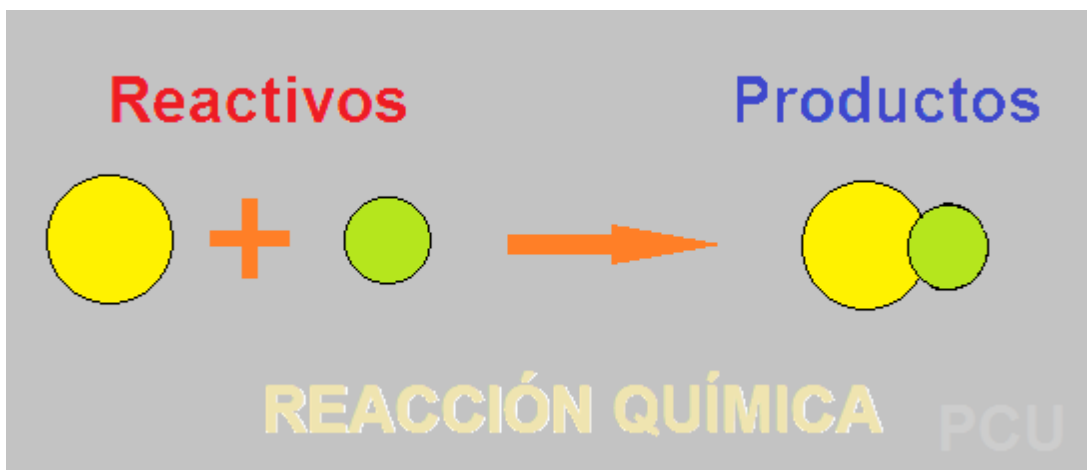


Imagen del profesor Pável Castillo Urueta

En muchos casos, cuando se mezclan dos sustancias no sucede nada y éstas pueden mantener su composición original y propiedades. Por lo que es necesario una evidencia experimental para determinar que ha tenido lugar una reacción. Esta

evidencia puede ser física como:

- Cambio de color
- Formación de un sólido (precipitado)
- Desprendimiento de gas
- Desprendimiento o absorción de calor
- Liberación de luz y sonido, etc.

### Inicio de fichero

#### a. Reacción de Síntesis

Una reacción química se representa a través de una ecuación, sin embargo, muchas veces ésta por sí sola no proporciona suficiente información para saber cómo llevar a cabo la reacción en el laboratorio; es decir, es necesario conocer toda la información sobre las condiciones en que se realiza la reacción química, ya que dependiendo de estas condiciones se puede llevar a cabo o no la reacción o se pueden obtener otros productos no deseados. Generalmente las condiciones de reacción se escriben sobre la flecha de la ecuación química.

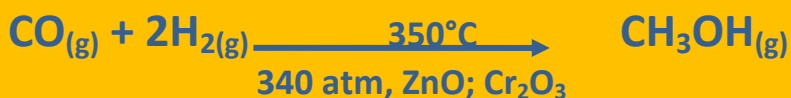
Por ejemplo, la letra griega  $\Delta$  significa que la reacción se lleva a cabo con la ayuda de **energía térmica**, también se puede indicar si la reacción ocurre a **presión atmosférica** (1 atmósfera = 1 atm), **presión reducida** o **alta presión** (mayor o menor a 1 atmósfera), si se incluye un **catalizador** (Pt, Fe, etc.), o si la reacción requiere un medio ácido o alcalino ( $H^+$ ,  $OH^-$ ), etc.

Por ejemplo, el óxido de plata se descompone en plata metálica y oxígeno molecular al calentarlo a alta temperatura ( $450^\circ C$ ) como lo muestra la siguiente ecuación:



Otro ejemplo donde se especifican las condiciones de reacción es el caso de la síntesis del metanol a partir de  $CO_{(g)}$  e  $H_{2(g)}$ . Esta reacción se lleva a cabo a  $350^\circ C$  y a una presión de 340 atm, sobre una superficie de ZnO y utilizando  $Cr_2O_3$  como catalizador.

Observa la ecuación química que describe éste proceso.



En una reacción de síntesis se forma uno o varios nuevos compuestos (productos), mediante la reacción de dos o más sustancias simples o compuestas denominadas reactivos.

## b. Síntesis del principio activo de la Aspirina.

Uno de los medicamentos más conocidos es la "Aspirina®", pero veamos algo de historia. En el siglo V a.C., Hipócrates recomendaba el uso de la corteza del sauce para aliviar el dolor; en 1763, M. Edmund Stone observó que algunas personas aliviaban los síntomas del paludismo usando la corteza de un árbol. Karl Jacob Löwig (1835), extrajo de la planta (*Spiraeularia*), un aceite soluble en éter del cual cristalizó un ácido que denominó "Spirsäure", pero fue hasta 1838, que Raffaele Piria sintetizó un compuesto que denominó ácido salicílico que resultó ser el mismo compuesto de Karl Jacob. En 1843, A. Cahours, farmacólogo de Gales, demostró que el aceite de *wintergreen*, utilizado para aliviar dolores, contenía el éster metílico del ácido salicílico.

En 1853, Charles Gerhardt sintetizó la aspirina a partir del ácido salicílico, pero desgraciadamente no hubo mucho interés por parte de la industria farmacéutica. En 1860, Kolbe y Lautermann también sintetizaron el ácido salicílico. Félix Hoffmann, químico de la casa Bayer, modificó el ácido salicílico pues era muy irritante para el tracto gastrointestinal y en su búsqueda de moléculas menos irritantes a través de una acetilación, llegó a la síntesis del ácido acetil salicílico (1898), que fue llamado Aspirina por la casa Bayer, por la "A" (de acetilo) y "spirin", del alemán *spirsäure*(1899).

El proceso de obtención de la aspirina desde la corteza del sauce se describe a continuación:

La corteza del árbol del sauce se sometía a extracción de la cual se obtenía un glucósido llamado salicina, este se sometía a hidrólisis mediante la adición de ácido, agua y calor. De esta reacción se obtenía otro compuesto llamado saligenina que es el alcohol salicílico y glucosa. Después el alcohol salicílico se oxidaba a ácido salicílico. Esta nueva molécula se hacía reaccionar con anhídrido acético en presencia de ácido sulfúrico y de un catalizador a una temperatura de 50 °C, después de algunos minutos se obtenía por cristalización el ácido acetil salicílico.

Fin de fichero

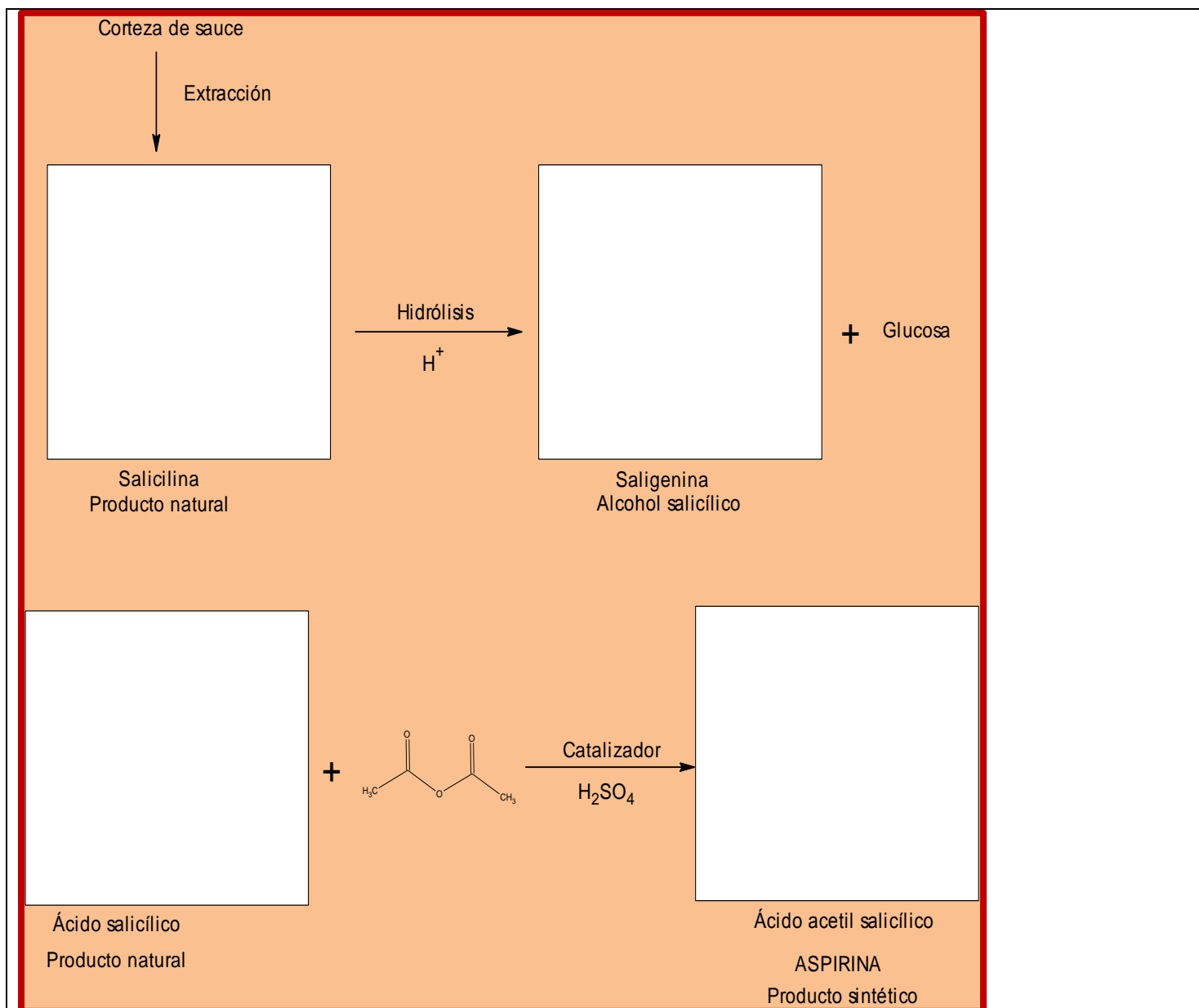
## Ejercicio2: Síntesis de la aspirina

El propósito de este ejercicio es que comprendas las reacciones químicas que participan en la síntesis del ácido acetil salicílico principio activo de la Aspirina®.

El proceso de obtención de la aspirina desde la corteza del sauce se describe a continuación:

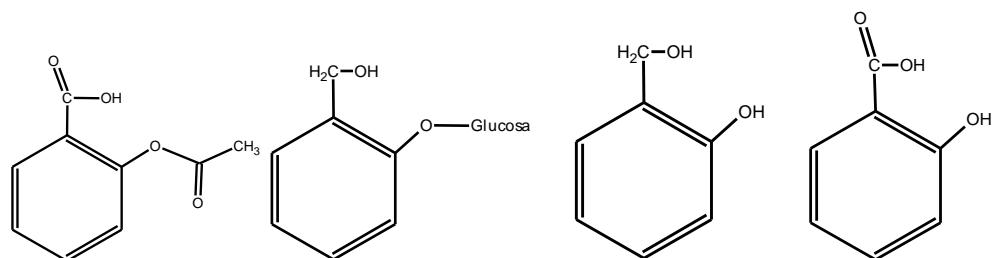
La corteza del árbol del sauce se sometía a extracción de la cual se obtenía un glucósido llamado salicina, este se sometía a hidrólisis mediante la adición de ácido, agua y calor. De esta reacción se obtenía otro compuesto llamado saligenina que es el alcohol salicílico y glucosa. Después el alcohol salicílico se oxidaba a ácido salicílico. Esta nueva molécula se hacía reaccionar con anhídrido acético en presencia de ácido sulfúrico y de un catalizador a una temperatura de 50 °C, después de algunos minutos se obtenía por cristalización el ácido acetil salicílico.

Arrastra las estructuras en el lugar correspondiente de acuerdo a los grupos funcionales que identifiques en ellas.

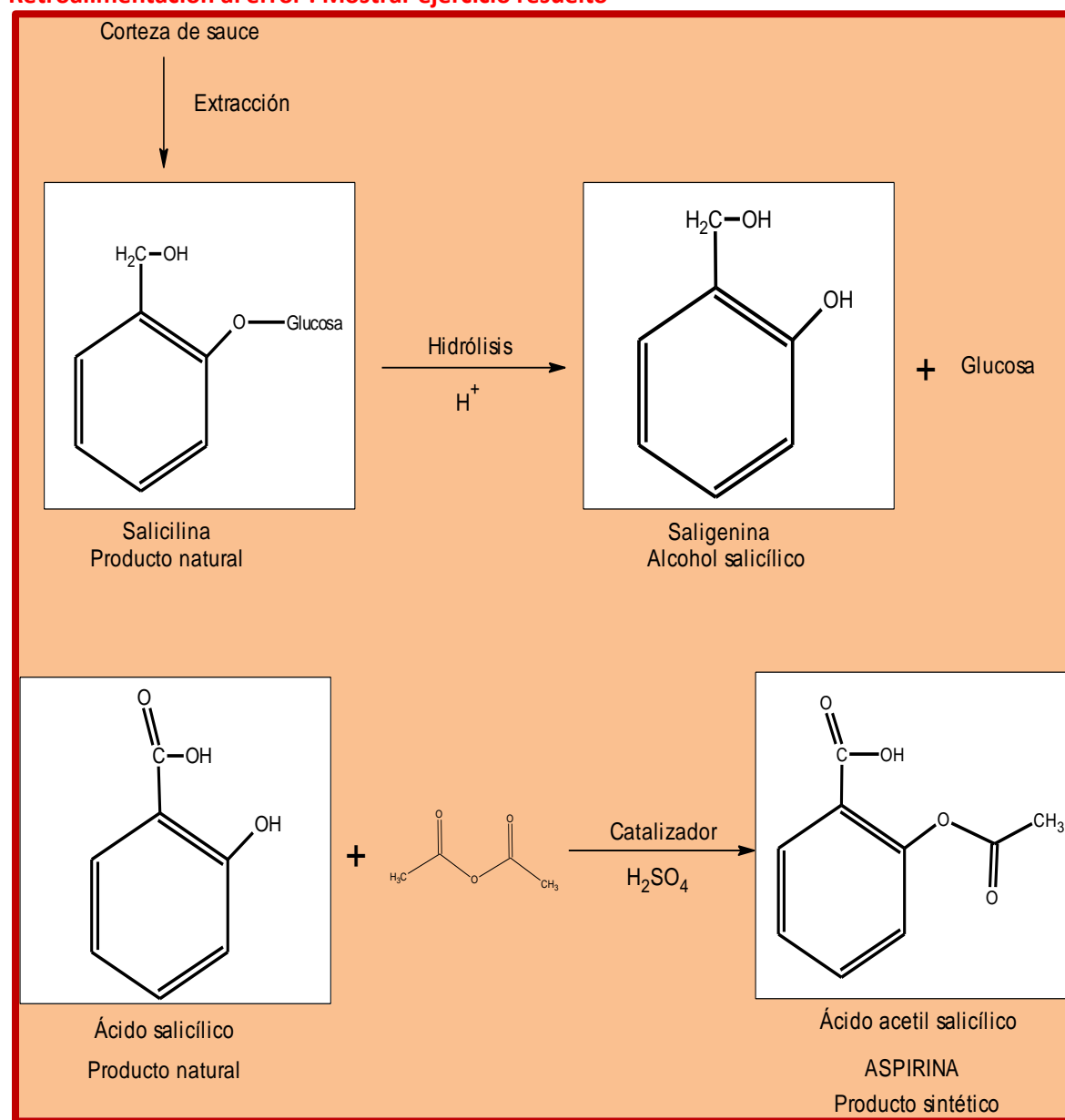


Por favor arrastra correctamente las estructuras para que completes la reacción de síntesis de la Aspirina. Para ello observa que grupos funcionales están presentes en cada una de ellas y analiza el resto de reactivos y productos planteados en las reacciones.

Como habrás notado no toda la molécula cambia en la reacción solo un grupo de átomos que se llaman grupos funcionales.



**Retroalimentación al error : Mostrar ejercicio resuelto**



Verifica

## 5. Actividad Final Laboratorio

**El propósito de esta actividad es que** realices a través de una actividad experimental, las reacciones químicas que participan en la síntesis del ácido acetil salicílico, principio activo de la Aspirina e identifiques algunas de sus propiedades físicas como temperatura de fusión, color y forma de los cristales.

### Preparación del Experimento

Arrastra y coloca cada sobre la mesa de trabajo cada uno de los siguientes materiales:

Instrumentos	Materiales	Sustancias
1 aparato de Fisher para punto de fusión. 1 balanza digital  1 microscopio o una lupa	1 vidrio de reloj 2 tubos de ensayo 1 pipeta de 5 mL 1 soporte universal con aro de metal y tela de asbesto. 2 pinzas para tubo de ensayo 1 embudo de tallo corto 1 vaso de precipitado de 250 mL 2 papeles filtro Whatman No. 5 1. termómetro 1 vaso de precipitados de 50 mL 2 pipetas Beral 1 piseta con agua destilada	1.0 g. de ácido salicílico ( $\text{COOH}\text{C}_6\text{H}_4\text{OH}$ ) 20 mL de agua helada 0.5 mL de ácido sulfúrico ( $\text{H}_2\text{SO}_4$ ) concentrado (18M) en un frasco gotero 20 mL de anhídrido acético ( $\text{C}_4\text{O}_3\text{H}_6$ ) Hielo (hielo)






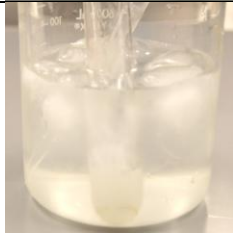

### Problema a resolver:

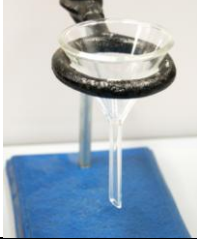
Sintetizar el ácido acetil salicílico que es el principio activo de la aspirina

### Preparación del experimento:

#### Procedimiento

Paso	Descripción del paso	
------	----------------------	--

1.	En un tubo de ensayo perfectamente seco y limpio pesa 1 g de ácido salicílico.	 
2.	Agrega 1 mL (20 gotas) de anhídrido acético, agita ligeramente y agrega un exceso de 1 mL y agita vigorosamente.	
3.	Con precaución, agrega dos gotas de ácido sulfúrico concentrado y agita nuevamente el tubo de ensayo.	
4.	Coloca el tubo en un baño María y mantén una <b>temperatura constante a 50°C durante 8 minutos</b> . Para el baño María utiliza un vaso de precipitado de 250 mL con agua de la llave. Cuida que no entre agua al tubo.	
5.	Retira el tubo de ensayo con las pinzas y agrega 1mL de agua helada y agita vigorosamente. Enseguida coloca el tubo en un baño de hielo y con el agitador raspa las paredes del tubo de ensayo cercanas a la superficie de la disolución para acelerar la cristalización (debes observar la formación de pequeños cristales).	 

6.	Separa los cristales de ácido acetilsalicílico obtenidos, por filtración, y lávalos dos veces, con cantidades pequeñas de agua fría. Observa los cristales al microscopio o con una lupa.	
7.	Coloca los cristales entre dos papeles filtro y presiona para extraer el agua y sécalos.	
8.	Separa unos cristales del producto obtenido y determina su punto de fusión.	
9.	De forma similar toma unos cuantos cristales de ácido acetilsalicílico del frasco de reactivos (reactivo testigo) y determina su punto de fusión.	

**Tabla 1. REGISTRO DE OBSERVACIONES, DATOS, RESULTADOS YEVIDENCIAS EXPERIMENTALES.**

Completa la siguiente tabla con los resultados obtenidos en la actividad experimental.

Nombre de la sustancia	Fórmula química	Color	Propiedades Físicas		¿Es reactivo?	¿Es producto?	¿Qué tipo de reacciones?
			Forma	Punto de fusión			
Ácido Salicílico							
Anhídrido Acético							
Ácido Sulfúrico							
Ácido Acetilsalicílico							

**Análisis del experimento. Preguntas:**

- ¿Cuál es el principio activo de la aspirina?
- ¿Qué cantidad de ácido acetilsalicílico en peso se obtuvo?
- ¿Qué problemas tuviste para la síntesis de ácido acetilsalicílico y cómo los resolviste?
- ¿Cuál es la función del ácido acetilsalicílico en el organismo?

**GLOSARIO**

**Acilación:** Proceso de agregar un grupo acilo a un compuesto. El compuesto que provee el grupo acilo es denominado el grupo acilante.

**Alta presión:** Presión medida por arriba del valor de la presión atmosférica.



**Artritis:** Enfermedad degenerativa de las articulaciones consistente en la inflamación o desgaste de una articulación.

**Carbonilación:** Proceso o reacción química en la que una molécula de monóxido de carbono, por sí sola o junto a otro reactivo, se inserta o adiciona sobre una molécula de un sustrato orgánico.

**Catalizador:** Sustancia que interviene en una reacción para acelerarla, pero sin que participe y se consuma durante el proceso.

**Clamidias:** Es un género de bacterias gramnegativas patógenas para el hombre, perteneciente a la familia Chlamydiaceae, orden Chlamydiales, filo Chlamydiae.

**Colitis:** Enfermedad inflamatoria del colon (el intestino grueso) y del recto, puede llegar a presentarse ulceración.

**Energía térmica:** Es la fuerza liberada en forma de calor. Puede ser obtenida de la naturaleza o del sol, mediante una reacción exotérmica, como la combustión de algún combustible; por una reacción nuclear de fisión o de fusión; mediante energía eléctrica por efecto Joule o por efecto termoeléctrico; o por rozamiento, como residuo de otros procesos mecánicos o químicos.

**Esclerodermia:** Significa piel dura y se refiere a un grupo de enfermedades que causa un crecimiento anormal del tejido conectivo, las proteínas que mantienen la piel y los órganos.

**Esteroidal:** Que proviene de los esteroides o son derivados de los esteroides por modificación de la estructura básica (esterano) por adición de diversos grupos funcionales, como carbonilos e hidroxilos (hidrófilos) o cadenas hidrocarbonadas (hidrófobas).



**Grupo funcional:** Parte de una molécula que se caracteriza por un acomodo especial de los átomos y que determina sus características químicas.

**Macrólidos:** Los **macrólidos** son un grupo de antibióticos muy relacionadas entre sí que se caracterizan por tener un anillo macrocíclico de lactona con 14 a 16 átomos, cuyo prototipo, y el macrólido más utilizado, es la eritromicina.

**Osteoartritis:** La osteoartritis es la forma más común de artritis. Causa dolor, inflamación y disminución de los movimientos en las articulaciones.

**Perforaciones duodenales gástricas:** Se conoce médicamente como úlcera péptica y es una afectación a la mucosa que recubre el estómago o el duodeno. Se clasifican en úlceras gástricas y úlceras duodenales. Las úlceras pépticas pueden aparecer tanto en las mujeres como en los hombres desde la infancia hasta edades avanzadas.

**Periodontales:** La enfermedad periodontal es una enfermedad que afecta a las encías y a la estructura de soporte de los dientes. La bacteria presente en la placa causa la enfermedad periodontal. Si no se retira, cuidadosamente, todos los días con el cepillo y el hilo dental, la placa se endurece y se convierte en una sustancia dura y porosa llamada cálculo.

**Periodontitis:** La **periodontitis**, denominada comúnmente **piorrea**, es una enfermedad crónica e irreversible que puede cursar con una gingivitis inicial, para luego proseguir con una retracción gingival y pérdida de hueso hasta, en el caso de no ser tratada, dejar sin soporte óseo al diente.

**Presión atmosférica:** Presión que ejerce la atmósfera que rodea la Tierra (barométrica), sobre todos los objetos que se hallan en ella. Mientras mayor sea la altitud de la ciudad en que vives, menor será la presión atmosférica. Esto debido a

que la columna de aire que existe sobre ti es menor. Por otra parte, en las regiones localizadas a nivel de mar se tiene el valor máximo de presión atmosférica que es de una atmosfera.

**Presión reducida:** Presión medida por debajo del valor de la presión atmosférica local, también conocida como vacío.

**Reumatismo:** Es el nombre corriente para las enfermedades que afectan al sistema músculo esquelético. Estas son enfermedades frecuentes que causan dolor e incapacidad pero que rara vez son mortales. En esta denominación se encuentran 6 categorías que son: lumbago, reumatismo peri-articular, artrosis, artritis inflamatorias, enfermedades óseas y las enfermedades del tejido conectivo.

**Riquetsias:** Se refiere a un género de bacterias patógenas que pertenece a la familia Rickettsiaceae. Las rickettsias son parásitos intracelulares obligados, muy pequeñas, Gram-negativas y no forman esporas.

**Rosácea:** Enfermedad conocida también como la maldición de los celtas. Comienza como un enrojecimiento en la parte central de la cara o en las mejillas sin embargo puede progresar afectando a toda la cara, nariz, cuello y pecho. Evoluciona provocando dilatación de los vasos sanguíneos superficiales de la cara, pápulas circulares enrojecidas, pústulas, enrojecimiento ocular, quemazón, ardor y picazón, y en algunos casos avanzados, nariz roja lobulada.

**Sarcoidosis cutánea:** Se forman pequeñas masas de tejido anormal (granulomas, racimos de células inmunitarias) en ciertos órganos del cuerpo. La enfermedad puede afectar a casi cualquier órgano del cuerpo, aunque lo más común es que afecte los pulmones.

**Tetraciclinas:** Las tetraciclinas constituyen un grupo de antibióticos naturales y semisintéticos, que abarcan un amplio espectro en su actividad antimicrobiana. Químicamente son derivados de la naftacenocarboxamida policíclica, núcleo tetracíclico, de donde deriva el nombre del grupo.

## REFERENCIAS

REFERENCIAS	
<b>Fuentes consultadas</b>	<p><b>Bibliográficas</b></p> <p>Real Academia de Ciencias Exactas, Física y Naturales. 2002. <b>Diccionario Esencial de la Ciencias</b>. Editorial Espasa – Calpe, Madrid, España. 1036 pp.</p> <p><b>Hemerográficas</b></p> <ol style="list-style-type: none"> <li>1. Nilius, A., &amp; Ma., Z. 2002. Ketolides: the future of the macrolides? <b>Current Opinion in Pharmacology</b>, 2: 1-8. 24.</li> <li>2. Sanjurjo, M. 1996. La aspirina, legado de la medicina tradicional. <b>Educación Química</b>, 7(1): 13-15.</li> <li>3. Sapidin, A.N. &amp; Fleischmajer, R. 2006. Tetracyclines: nonantibiotic properties and their clinical implications. <b>Journal American Academy of Dermatology</b>, 54: 258-265.</li> <li>4. Sum, P.E., Ross, A.T., Petersen, P.J., Testa, R.T. 2006. Synthesis and antibacterial activity of 9-substituted minocycline derivatives. <b>Bioorganic and Medicinal Chemistry</b>, 16: 400-403.</li> <li>5. Thomas M. File, T.M. 2005. Telithromycin new product overview. <b>The Journal of Allergy and Clinical Immunology</b>, 115(2): S361-S373</li> <li>6. Bennett, M.S., Wien, F., Champness, J.N., Batuwangala, T., Rutherford, T., Summers, W.C., Sun, H., Wright, G., Sanderson, M.R. 1999. Structure to 1.9 Å resolution of a complex with herpes simplex virus type-1 thymidine kinase of a</li> </ol>

novel, non-substrate inhibitor: X-ray crystallographic comparison with binding of acyclovir. *FEBS Letters*, 443: 121 - 125

**Ciberográficas**

[http://es.wikipedia.org/wiki/Energ%C3%ADa\\_t%C3%A9rmica](http://es.wikipedia.org/wiki/Energ%C3%ADa_t%C3%A9rmica)

<http://grupo-verde-uni.blogspot.mx/2009/09/blog-post.html>

**Audiovisuales**