



UAEM | Universidad Autónoma
del Estado de México



Universidad Autónoma del Estado de México • Secretaría de Docencia • Dirección de Estudios Profesionales

Universidad Autónoma del Estado de México

Licenciatura de Químico Farmacéutico Biólogo 2006

Programa de Estudios:

Química Orgánica Heterocíclica



I. Datos de identificación

Licenciatura **Químico Farmacéutico Biólogo 2006**

Unidad de aprendizaje **Química Orgánica Heterocíclica** Clave

Carga académica
Horas teóricas Horas prácticas Total de horas Créditos

Período escolar en que se ubica

Seriación
UA Antecedente UA Consecuente

Tipo de Unidad de Aprendizaje

Curso Curso taller
Seminario Taller
Laboratorio Práctica profesional
Otro tipo (especificar)

Modalidad educativa

Escolarizada. Sistema rígido No escolarizada. Sistema virtual
Escolarizada. Sistema flexible No escolarizada. Sistema a distancia
No escolarizada. Sistema abierto Mixta (especificar)

Formación común

Ingeniería Química 2003 Química 2003
Química en Alimentos 2003

Formación equivalente

Unidad de Aprendizaje

Ingeniería Química 2003
Química 2003
Química en Alimentos 2003



II. Presentación

El plan de estudio del programa educativo del químico farmacéutico biólogo que se imparte en la Facultad de Química de la Universidad Autónoma del Estado de México se diseñó bajo un modelo educativo basado en competencias, con el fin de consolidar su pertinencia y calidad, organizándose en tres áreas de formación: básica, sustantiva e integral, que en conjunto pretenden dar una formación acorde a los tiempos actuales de una sociedad cada vez más dinámica, participativa y demandante.

La Unidad de Aprendizaje (UA) de Química Orgánica Heterocíclica es una materia obligatoria y se ubica en el núcleo de formación sustantiva y pretende destacar que la química orgánica es una ciencia activa y en continuo desarrollo; su importancia es fundamental en nuestro mundo tanto en el ámbito de la naturaleza como en el de la sociedad y por consiguiente en la formación de estos profesionales de la Química.

La contribución de esta Unidad de Aprendizaje al perfil de egreso de los estudiantes de esta licenciatura se centra en el desarrollo de competencias, que incidirán en la solución de problemas relacionados al área de la química farmacéutica y biológica y su transformación mediante la aplicación de las ciencias básicas.

Las competencias que la Unidad de Aprendizaje promueve en el estudiante, tienen un carácter integral, el nivel cognoscitivo pretende alcanzar los niveles de comprensión de conceptos y su aplicación en la solución de problemas relacionados con la transformación de la materia, el manejo de instrumentos y equipos que se utilizan en el campo de la química orgánica (rotavapores, bombas de vacío, muflas, estufas, balanzas, potenciómetros, entre otros), además de promover la comunicación efectiva de los estudiantes al participar en trabajos por equipo, comprometiéndose en un desempeño de calidad en el trabajo, que le permitan de manera eficaz iniciar los estudios de su profesión ante los retos actuales y futuros que esto demanda.

La Unidad de aprendizaje consta de siete unidades: (i) Nomenclatura para sistemas heterocíclicos, (ii) Anillos heterocíclicos de cinco miembros con un heteroátomo, (iii) anillos de cinco miembros con un heteroátomo fusionados, (iv) anillos de cinco miembros con dos heteroátomos, (v) anillos de seis miembros con un heteroátomo, (vi) anillos de seis miembros con dos heteroátomos, (vii) anillos de tres y cuatro miembros con un heteroátomo. Todas estas unidades sustentadas en un proceso educativo centrado en el estudiante, con la finalidad de propiciar el autoaprendizaje desarrollando de manera integral habilidades, actitudes y valores. Por lo que estrategias como la investigación documental, la discusión de temas, exposiciones del profesor y de los estudiantes conformaran las actividades centrales durante el desarrollo de las actividades del semestre Los criterios de evaluación tienen



un carácter de proceso continuo en el que la realimentación oportuna a los estudiantes acerca de su desempeño será factor clave en el aprendizaje de manera que el estudiante realizará trabajos previos y posteriores a las sesiones de clase como: investigación documental de temas, elaboración de mapas conceptuales, resolución de problemas, trabajo activo en clase (discusión de temas, resolución de problemas tipo y exposiciones ante el grupo); y presentación de las evaluaciones tanto las señaladas en el calendario oficial de la facultad, así como las de diagnóstico y de carácter formativo.

III. Ubicación de la unidad de aprendizaje en el mapa curricular

Núcleo de formación:	Sustantivo
Área Curricular:	Ciencias Básicas y Matemáticas
Carácter de la UA:	Obligatoria

IV. Objetivos de la formación profesional.

Objetivos del programa educativo:

Poseer los conocimientos básicos en las áreas de matemáticas, biología, física y química para que pueda utilizarlos en las áreas farmacéutica, clínica y ambiental.

Integrar los conocimientos de tipo conceptual en las ciencias biomédicas para analizar y formular programas de diagnóstico, prevención, tratamiento y vigilancia de enfermedades de diversas etiologías principalmente infectocontagiosas y crónico degenerativas.

Poseer los conocimientos de tipo conceptual en las ciencias farmacéuticas, para diseñar, sintetizar formular y evaluar nuevas presentaciones farmacéuticas que satisfagan las necesidades de nuestro medio.

Integrar los conocimientos de tipo conceptual en las áreas de especialidad farmacéutica para resolver problemas en las áreas farmoquímicas y farmacéutica, del sector productivo.

Integrar los conocimientos de tipo conceptual en las áreas de especialidad clínica para integrarse a grupos de trabajo interdisciplinario con el propósito de resolver problemas en el sector salud.

Integrar los conocimientos de tipo conceptual en las áreas de especialidad ambiental para resolver problemas ambientales que afectan a la sociedad.



Objetivos del núcleo de formación:

Proporcionar los conceptos, conocimientos y habilidades básicas comunes a varias áreas o disciplinas; se inicia la apropiación de un conocimiento profundo sobre las disciplinas relacionadas con el programa educativo, colaborando en el desarrollo de un profesionalista con una visión multidisciplinario e interdisciplinaria compartiendo experiencias de aprendizaje en diversos organismos académicos.

Objetivos del área curricular o disciplinaria:

V. Objetivos de la unidad de aprendizaje.

Proporcionar a los estudiantes los conocimientos básicos de la Química Orgánica Heterocíclica, así como el fortalecer y desarrollar habilidades, actitudes y valores que les permitan trabajar de manera individual o en equipo en la nomenclatura para los sistemas heterocíclicos y su interpretación de las propiedades físicas, químicas y métodos de síntesis de los principales grupos heterocíclicos de cinco y seis miembros cuatro y tres miembros con uno o más heteroátomos tanto monocíclicos como fusionados, empleando el método científico como un procedimiento sistemático, el cual implica el diseño y comprobación de hipótesis, leyes y teorías a través del planteamiento, análisis y solución de problemas que permiten a los alumnos comprender alternativas y propuestas relacionadas con la transformación de materias primas en compuestos heterocíclicos, además de emplear software específico para el desarrollo de las actividades de esta unidad de aprendizaje tomando en cuenta el beneficio social y el cuidado del medio ambiente.

VI. Contenidos de la unidad de aprendizaje y su organización

Unidad 1. Nomenclatura para sistemas heterocíclicos

Objetivo: En base a la nomenclatura trivial para los sistemas heterocíclicos y empleando las reglas de Hantzsch- Widman se estudiará la nomenclatura sistemática para los sistemas heterocíclicos tanto de tipo monocíclicos como de tipo fusionados, tomando en consideración las reglas para la nomenclatura sistemática de acuerdo a la presencia de los heteroátomos en los compuestos heterocíclicos basado en nomenclatura de tipo internacional. Mostrando calidad en el trabajo individual o en equipo. Con una visión de flexibilidad de pensamiento, perseverancia y tolerancia, así como la disposición a aprender a aprender.



- 1.1 Sistema de nomenclatura tipo Hantzsch-Widman para sistemas monocíclicos.
- 1.2 Nomenclatura trivial para sistemas monocíclicos y fusionados.
- 1.3 Sistema de nomenclatura tipo Hantzsch-Widman para sistemas fusionados.
- 1.4 Nomenclatura para sistemas espiroheterocíclicos.

Unidad 2. Anillos heterocíclicos de cinco miembros con un heteroátomo

Objetivo: En la resolución de problemas relacionados con las propiedades físicas y químicas se estudiarán las principales cuestiones de tipo estructural de los anillos heterocíclicos de cinco miembros con un heteroátomo como pirrol, furano y tiofeno; y su importancia desde el punto de vista de derivados naturales, así como sus derivados industriales, analizando su función como núcleo central de diversos fármacos, analizando primeramente los principales métodos de obtención tanto de tipo clásico como métodos modernos de este tipo de anillos heterocíclicos; analizando sus propiedades químicas que caractericen la reactividad de este tipo de anillos como es la sustitución electrofílica aromática, reacciones a través de radicales libres, reacciones de inserción de carbenos, reacciones de metalación, reacciones de apertura de ciclos, reacciones de cicloadición, y reacciones de reducción. Mostrando calidad en el trabajo individual o en equipo. Con una visión de flexibilidad de pensamiento, perseverancia y tolerancia, así como la disposición a aprender a aprender.

- 2.1 Análisis estructural de anillos de cinco miembros con un heteroátomo.
- 2.2 Propiedades físicas de los anillos heterocíclicos de cinco miembros con un heteroátomo.
- 2.3 Importancia de los anillos heterocíclicos con un heteroátomo desde el punto de vista natural, industrial y farmacéutico.
- 2.4 Métodos de preparación.

Síntesis clásicas, Síntesis de Paal-Knorr, Síntesis de Feist-Benary, Síntesis de Hantzsch, Síntesis de Hinsberg, a partir de ésteres acetilénicos

- 2.5 Propiedades químicas:

Sustitución electrofílica aromática, Efecto del grupo sustituyente. Sustitución nucleofílica aromática. Sustitución a través de radicales libres. Adición de carbenos, Reacciones de metalación, Reacciones de reducción Reacciones de cicloadición



Unidad 3. Anillos de cinco miembros con un heteroátomo fusionados.

Objetivo: En la resolución de problemas relacionados con las propiedades físicas y químicas de los anillos de cinco miembros con un heteroátomo, se estudiara principalmente la química del indol por ser un núcleo que tiene una gran importancia desde el punto de vista natural como sintético. Se analizarán conceptos básicos de su estructura, así como su representación en una gran diversidad de productos con actividad biológica presentándose como núcleo central. En base a los métodos de obtención para el anillo del indol se estudiará desde el punto de vista de síntesis clásicas y actuales. Dentro de sus propiedades químicas se estudiará la reacción de sustitución electrófila aromática como característica primordial en este tipo de núcleo comparándola con la reacción de adición que algunos miembros de este grupo presentan, analizando sus efectos orientadores de los grupos sustituyentes, la reacción de sustitución nucleofílica aromática, jugará un papel muy importante dentro de su análisis de reactividad así como la reacción de inserción de carbenos y sus respectivas reacciones de metalación, en competencia con las reacciones de apertura del ciclo. Mostrando calidad en el trabajo individual o en equipo. Con una visión de flexibilidad de pensamiento, perseverancia y tolerancia, así como la disposición a aprender a aprender.

3.1 Característica general del anillo de indol.

3.2 Importancia del núcleo de indol desde el punto de vista natural, industrial y farmacéutico.

3.3 Métodos de síntesis:

Síntesis de Fisher, Síntesis de Madelung Síntesis de Reissert Síntesis de Nenitzescu Síntesis de Bischler

3.4 Propiedades Químicas:

Sustitución electrofílica aromática
Efecto del grupo sustituyente
Sustitución a través de radicales libres.
Adición de carbenos
Reacciones de metalación
Reacciones de apertura.

Unidad 4. Anillos Heterocíclicos de cinco miembros con dos heteroátomos.

Objetivo: En la resolución de problemas relacionados con las propiedades físicas y químicas de los anillos heterocíclicos de esta unidad, se clasificaran los azoles en dos grupos muy importantes. Los 1,2-azoles (isoxazol, pirazol, isotiazol) y los 1,3-azoles (oxazol, imidazol y tiazoles) desde el punto de vista estructural y natural, haciendo énfasis en la presencia de éste núcleo como parte central de algunos fármacos. Dentro del punto de vista sintético, se analizaran los diferentes



métodos de obtención tanto de tipo clásico como actuales, dentro de sus propiedades químicas se analizara la poca importancia de la reacción de sustitución electrofílica aromática comparada con la reacción de sustitución electrofílica aromática que en este tipo de heterocíclicos juega un papel muy importante. Se estudiara la reactividad de estos compuestos frente a las reacciones a través de radicales libres, tomando en consideración las diferentes reacciones de apertura del ciclo, así como sus respectivas reacciones de metalación; desde el punto de vista ácido-base se analizará su reactividad frente a los ácidos minerales para la conversión a las respectivas sales cuaternarias de azoleo como una metodología alternativa para aumentar la reactividad química de la cadena lateral para este tipo de núcleos. Mostrando calidad en el trabajo individual o en equipo. Con una visión de flexibilidad de pensamiento, perseverancia y tolerancia, así como la disposición a aprender a aprender.

4.1 Generalidades de los azoles

4.2 Importancia de los azoles desde el punto de vista natural, industrial y farmacéutico.

4.3 Métodos de preparación de 1,2-azoles.

4.4 Métodos de síntesis de 1,3-azoles

4.5 Propiedades químicas:

Sustitución electrofílica aromática

Efecto del grupo sustituyente

Sustitución nucleofílica aromática

Sustitución a través de radicales libres.

Reacciones de metalación

Reacciones de cicloadición

Reacciones de apertura cíclica

Formación de sales cuaternarias de azoleo

Reactividad de la cadena lateral

Unidad 5. Anillos Heterocíclicos de seis miembros con un heteroátomo.

Objetivo: En la resolución de problemas relacionados con las propiedades físicas y químicas del anillos de la piridina como núcleo representativo de esta unidad. Se analizará su importancia estructural tanto en forma natural como en la de productos de interés industrial y derivados farmacéuticos; los métodos de obtención clásicos como actualizados jugarán un papel muy importante para la formación de este tipo de heterociclos. Las propiedades químicas como la poca participación de este tipo de núcleos para la reacción de sustitución electrofílica aromática se relacionara con la importante reacción de sustitución nucleofílica aromática y se vera la ventaja de utilizar en este tipo de núcleos las reacciones a través de radicales libres, la formación a los respectivos N-óxidos y su estudio



sobre su reactividad le otorgará al estudiante el conocimiento adecuado sobre la química de este tipo de anillos heterocíclicos, el análisis de la reactividad de la cadena lateral desarrollara el interés en la formación de cadenas de mayor complejidad. El estudio de sus diferentes reacciones de metalación complementará los conocimientos básicos sobre la reactividad de este tipo de anillo heterocíclico. Mostrando calidad en el trabajo individual o en equipo. Con una visión de flexibilidad de pensamiento, perseverancia y tolerancia, así como la disposición a aprender a aprender.

5.1 Generalidades del anillo de piridina.

5.2 Importancia del anillo de la piridina desde el punto de vista natural, industrial y farmacéutico.

5.3 Métodos de preparación de piridinas.

5.4 Propiedades químicas:

Sustitución electrofílica aromática

Efecto del grupo sustituyente

Sustitución nucleofílica aromática

Formación de N-óxidos de piridina

Sustitución a través de radicales libres.

Reactividad de la cadena lateral

Reacciones de metalación

Reacciones de transposición.

Unidad 6. Anillos heterocíclicos de seis miembros Fusionados con un heteroátomo

Objetivo: En la resolución de problemas relacionados con las propiedades físicas y químicas del anillos de la piridina como núcleo representativo de esta unidad. Se analizará la química de las quinolinas e isoquinolinas, tomando en consideración su importancia desde el punto de vista estructural para compuestos de origen natural, importancia industrial y farmacéutico. El análisis sobre sus métodos de preparación tanto de tipo clásico como actualizados le dará al estudiante un panorama general sobre sus métodos de formación. Dentro de las propiedades químicas se comparará y se relacionara con la reactividad química del anillo de la piridina que son núcleos químicamente semejantes y que prácticamente sufren el mismo tipo de reacciones químicas. Mostrando calidad en el trabajo individual o en equipo. Con una visión de flexibilidad de pensamiento, perseverancia y tolerancia, así como la disposición a aprender a aprender.

6.1 Generalidades de quinolinas e Isoquinolinas



6.2 Importancia del anillo de quinolina e isoquinolina desde el punto de vista natural, industrial y farmacéutico.

6.3 Métodos de preparación de quinolinas e isoquinolinas.

6.4 Propiedades químicas:

- Sustitución electrofílica aromática
- Efecto del grupo sustituyente
- Sustitución nucleofílica aromática
- Sustitución a través de radicales libres.
- Reacciones de metalación
- Reacciones de apertura cíclica
- Reactividad de la cadena lateral

Unidad 7. Anillos heterocíclicos de tres y cuatro miembros con un heteroátomo.

Objetivo: En la resolución de problemas relacionados con las propiedades físicas y químicas de esta unidad, se analizará la química de los anillos heterocíclicos de tres miembros con un heteroátomo (aziridinas, oxiranos y episulfuros) tomando como base sus métodos de obtención tanto clásicos como modernos. Las propiedades químicas más importantes de estos núcleos se estudiarán de una manera general debido a su importancia que hoy en día tienen este tipo de heterociclos, principalmente como intermediarios claves en un gran número de reacciones orgánicas que presentan los anillos de tres miembros. Por otra parte, se analizará desde el punto de vista biológico la importancia que tienen los anillos heterocíclicos de cuatro miembros como núcleos centrales de antibióticos naturales. De manera general se analizarán sus principales rutas sintéticas así como sus principales propiedades químicas. Mostrando calidad en el trabajo individual o en equipo. Con una visión de flexibilidad de pensamiento, perseverancia y tolerancia, así como la disposición a aprender a aprender.

7.1 Generalidades de los anillos de tres y cuatro miembros con un heteroátomo

7.2 Importancia de los anillos de tres y cuatro miembros con un heteroátomo desde el punto de vista natural, industrial y farmacéutico.

7.3 Métodos de preparación los anillos de tres y cuatro miembros con un heteroátomo.

7.4 Propiedades químicas:

- Reacciones de apertura



VII. Sistema de Evaluación

- ✓ En el desarrollo de la UA se evaluará la identificación y la aplicación de los conocimientos, las habilidades adquiridas, las actitudes y valores desarrollados, mediante:
 - Actividades individuales como: Resúmenes, mapas conceptuales, gráficos de recuperación y series resueltas de problemas tipo¹ (examen previo y evaluaciones departamentales)
 - Actividades en equipo como: Series resueltas de problemas tipo¹ (ejercicio semanales y problemarios)

- ✓ La UA se acreditará a través de dos evaluaciones parciales, una final sumaria (equivalente al examen ordinario) y el laboratorio, con un promedio mínimo de calificación de 6.0 puntos en una escala de 10.0 para ser promovido. No hay pase automático, es obligatoria la presentación del examen departamental final.

- ✓ Para acreditar la UA el estudiante debe obtener en el laboratorio una calificación promedio final de 6.0 puntos.

- ✓ Los porcentajes de las calificaciones e integración de cada evaluación son los siguientes:
 - Primera evaluación 50%
 - Segunda evaluación 50%
 - Si el promedio de las dos evaluaciones es mayor al 8.0 el alumno se considera exento del resto de las evaluaciones según lo establecido en el reglamento interno de la Facultad de química de la UAEMéx.
 - Para calificaciones dentro del rango de 6.0 a 7.9 puntos el alumno presentará evaluación final, siendo esta última el 50% de la calificación total final
 - Alumnos con promedio de 5.9 o menos presentar directo el examen extraordinario

 - Evaluación final 50%

- ✓ Las evaluaciones primera y segunda se conformaran por las siguientes actividades:
 - Actividades en o fuera del aula (Escala) 25%
 - Resúmenes 20%
 - Mapa conceptual o gráfico de recuperación (ver cuadro 2) 20%
 - Series de problemas 60%

 - Ejercicios semanales 30%



- Problemario 30%
- Examen previo 40%
- Examen departamental 75%

¹ Problemas tipo: Relacionados con la estequiometría de reacciones químicas típicas², interacción de la materia (a nivel atómico) con la energía y el comportamiento de la materia en función de los átomos que la conforman y el tipo de unión química que presentan.

² Reacciones químicas típicas: Combustión, ácido-base, óxido-reducción, entre otras.

VIII. Acervo bibliográfico

Paquette, L. A. Fundamentos de Química Heterocíclica, Ed. Limusa, 1ª Edición en Español, México, 1987.

Gilchrist, T.L. Heterocyclic Chemistry, Ed. Logma Scientific & Technical, Sec. Edi, New York 1992.

Acheson, R. M. Química heterocíclica, Publicaciones Cultural S.A. México, 1981. QD 400 A17

G.F. Smith, G. F., Joule, A.J. Heterocyclic Chemistry, Ed., Van Nostrand Reinhold London, 1978.

Young, D.J. Heterocyclic Chemistry, Ed. Longman Scientific, London, 1975 QD 400 Y68

A. R. Katritzky, Handbook of Heterocyclic Chemistry, Ed. Pergamon Press, New York, 1985

Herrera, L., Miranda, R., Punieres, G., Velasco, B. Nomenclatura Sistemática en Química Heterocíclica. Ed. UNAM 1ª Ed. 1995, México D.F.

Contemporary Heterocyclic Chemistry, G.R. Newkome and W.W. Paudler, John Wiley & Sons, N.Y. 1982.

Lednicher, D., Mitscher, L. A., Georg, G. The Organic Chemistry of Drug Synthesis John Wiley & Sons, N.Y.

Carey, F.A. Advanced Organic Chemistry, Plenum Press, 2ª Edición. New York. 1984

March J. Advanced Organic Chemistry, 4ª Edición. Wiley Interscience, New York. 1992 QD2512M37



Rodriguez H. L: Miranda R.R.; Nomenclatura Sistematizada en química heterocíclica, UNAM 1995

Taylor C. E. Heterocyclic Compounds Wiley Interscience 1990

Carey F.A. Advanced Organic Chemistry, Plenum Press, 2ª Edición. New York. 1984

March Jerry, Advanced Organic Chemistry, 6ª Edición. Wiley Interscience, New York. 2007

Pine B. Química Orgánica, Mc Graw Hill 4a Edición. México 1990

Sikes P. “ Mecanismos de reacciones orgánicas”, Editorial Reverte, Barcelona 1986.

Breslow R. “Mecanismos de reacciones orgánicas”, Editorial Reverte, Barcelona 1976.

Eliel E. “Elementos de estereoquímica”, Editorial Limusa, México 1970.

Giese R. W. “Estereoquímica texto programado introductor” Editorial Publicaciones Culturales, México 1978.

Juaristi E. “Tópicos modernos de estereoquímica”, Editorial Limusa, México 1983.

Morrison J. D. “Asimetric Organic Reactions” Englewood, New Jersey Prentice Hall 1971.

Henderson P.B. “Problems in Organic Chemistry”, Prentice Hall New Jersey 1986.

Yurcans Bruce Paula, “Organic Chemistry”, Ed. Prentice Hall Inc. First Ed. New Jersey, 1995.

www.acs.org.pubs (revistas electrónicas)