

Bioisosterismo Clássico e Não-Clássico no Planejamento de Fármacos

Por Cristiano Ricardo · Publicado em 28/10/2012

Mini aula de Ciências Farmacêuticas pelo Prof. Cristiano Ricardo sobre bioisosterismo clássico e não-clássico no planejamento de fármacos (Química Farmacêutica Medicinal), cobrindo teoria fundamental, diagrama e aplicação clínica.

Versão online e eventuais atualizações:

<https://cristianorichardo.com/post/bioisosterismo-classico-e-nao-classico-no-planejamento-de-farmacos-2012-10-28>

Química Farmacêutica Medicinal

Objetivo da Aula: Explorar a substituição de grupos atômicos que preservam ou aprimoram a afinidade pelo receptor biológico.

Fundamentos Teóricos & Bioquímicos

O bioisosterismo fundamenta-se na troca de átomos ou agrupamentos que possuem similaridade eletrônica, estérica ou propriedades físico-químicas equivalentes. No bioisosterismo clássico, substituem-se átomos monovalentes (como -F por -H, ou -OH por -NH₂). No não-clássico, substitui-se o anel carboxílico por um anel tetrazol, garantindo acidez semelhante, porém com maior lipofilicidade e resistência à degradação metabólica.

Esquema Visual do Mecanismo

Ácido Carboxílico

-COOH (pKa ~ 4-5)

Anel Tetrazol

Bioisóster Não-Clássico

Aplicação na Prática Farmacêutica & Cuidado Clínico

Essa estratégia química transformou a losartana e outros antagonistas de receptores AT1 da angiotensina em anti-hipertensivos orais potentes, prolongando a meia-vida e reduzindo efeitos adversos.

Prof. Cristiano Ricardo

Docência & Prática em Ciências Farmacêuticas · Aula ministrada em 28/10/2012 às 07:57