

6.0 crédits

45.0 h + 30.0 h

Enseignants:	Poupaert Jacques ; Lambert Didier (coordinateur) ; Frédérick Raphaël ;
Langue d'enseignement:	Français
Lieu du cours	Bruxelles Woluwe
Préalables :	WFARM1231 chimie organique WFARM1221 biochimie WFARM1232 pharmacologie générale WFARM1008 conception du médicament L'unité d'enseignement suivante devra être acquise ou figurer dans le programme de l'étudiant la même année académique : WFARM1300 (pharmacocinétique et métabolisme des xénobiotiques).
Thèmes abordés :	Le thème général est la relation structure-activité des médicaments. Comme ce thème est très large, il est nécessaire de l'illustrer par des exemples spécifiques. Sont abordés, (i) les propriétés chimiques et physico-chimiques des médicaments en relation avec leur comportement pharmacocinétique et pharmacodynamique (phototoxicité, hydrolyse in vitro et in vivo, charge (pKa), log P (règles de Lipinski), chiralité) (ii) les interactions ligand-récepteur, sous l'angle physico-chimique: nature des interactions intermoléculaires, types de cibles (récepteurs, canaux ioniques, enzymes, transporteurs, pompes), conséquences de la fixation d'un xénobiotique sur ces cibles. (iii) le processus de découverte et d'optimisation du médicament. Description des méthodes et des contraintes du "drug design". Les travaux pratiques proposent aux étudiants d'établir eux-mêmes un plan expérimental permettant de déterminer la structure de molécules simples ("spot tests", synthèse de dérivés cristallins, spectroscopie IR).
Acquis d'apprentissage	Au sortir de cette formation, les étudiants doivent être capables de faire le lien entre une formule de structure et l'interaction du médicament avec le vivant. Ils doivent pouvoir tenir un discours critique sur les corrélations structure-pharmacodynamique ("drug design", pharmacophore, actions diverses possibles d'une molécule sur un récepteur donné) et les corrélations structure-pharmacocinétique (passage des barrières physiologiques, pKa, logP, stabilité chimique et photochimique). Les travaux pratiques ont pour but d'assurer la transition entre ceux de FARM1230 et de FARM2205: les étudiants doivent être capables d'établir un plan expérimental rationnel. <i>La contribution de cette UE au développement et à la maîtrise des compétences et acquis du (des) programme(s) est accessible à la fin de cette fiche, dans la partie « Programmes/formations proposant cette unité d'enseignement (UE) ».</i>
Modes d'évaluation des acquis des étudiants :	Evaluation: examen écrit. L'étudiant doit démontrer son aptitude à une réflexion critique sur les interactions médicaments-vivant. Les résultats obtenus au laboratoire font l'objet d'une cote séparée.
Contenu :	Le cours se veut une description approfondie d'exemples typiques de relations structure-activité plutôt que la couverture exhaustive du champ beaucoup trop vaste de la chimie médicinale. Il se charpente donc sur des étude de cas. Par exemple, les domaines des dérivés de type sulfonamides, AINS, inhibiteurs de l'enzyme de conversion, chloroquine, etc. illustrent l'importance de paramètres tels que le pKa et logP sur la pharmacodynamique et la pharmacocinétique des médicaments. Les récepteurs bêta-adrénergiques, nicotiques, au glutamate, à l'insuline, aux oestrogènes, les canaux calciques, les pompes Na ⁺ /K ⁺ et H ⁺ /K ⁺ ATPases, permettent d'illustrer l'interaction moléculaire effecteur-cible. Les développements classiques et récents des médicaments actifs sur le CNS (opioïdes p. ex.) introduisent au "drug design".
Autres infos :	Encadrement: 3 enseignants pour le cours théorique; 1 enseignant, 3 assistants et deux membres du PATO (dont une universitaire) pour les travaux pratiques.
Cycle et année d'étude: :	> Bachelier en sciences pharmaceutiques
Faculté ou entité en charge:	FARM