UCL Université catholique de Louvain

LCHM2244

2015-2016

Medicinal chemistry

3.0 crédits	22.5 h + 7.5 h	1q

Enseignants:	Marko Istvan ; Schneider Yves-Jacques ;
Langue d'enseignement:	Anglais
Lieu du cours	Louvain-la-Neuve
Thèmes abordés :	1. L'industrie pharmaceutique actuelle dans son contexte socio-économique. 2. Les techniques de " discovery ". 3. L'optimisation des propriétés ADMET. 4. Les relations structure-activité. 5. Les méthodes de screening. 6. Exemples de " structure-based drug design ".
Acquis d'apprentissage	L'objectif du cours est de sensibiliser l'étudiant de maîtrise en chimie (ou biochimie) aux différents problèmes traités dans l'industrie pharmaceutique, depuis la découverte d'un principe actif (molécule " lead ") jusqu'à la production d'un médicament commercialisable. Il s'agit d'un cours de formation générale qui intègre les notions de chimie physique, chimie organique, spectroscopie et biochimie (enseignées en baccalauréat) dans le contexte interdisciplinaire de la recherche et du développement des médicaments. L'accent est mis sur l'intégration des connaissances et la réflexion multidisciplinaire telle que pratiquée actuellement dans l'industrie pharmaceutique. *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) ».*
Contenu :	Le cours débute par une présentation générale de l'industrie pharmaceutique, avec les principales étapes de la recherche et du développement d'un médicament, de la genèse à la commercialisation. Cette industrie à vocation particulière est située dans son contexte socio-économique mondial (aspects scientifiques, stratégiques et économiques). On explique ensuite comment on peut découvrir un nouveau principe actif (molécule " lead "), en partant du hasard pour arriver à une conception rationnelle : la méthode " serendipity ", l'exploitation de la chimie de synthèse, l'exploitation des produits naturels d'origine végétale, animale ou humaine (hormones, neurotransmetteurs,). Chaque approche est illustrée par des exemples : chlorodiazepoxide, sildenafil, dihydropyridines, anti-inflammatoires non stéroïdiens, analogues opiacés et cannabinoides, taxanes, épibatidine, squalamine, dolastatine, peptides et peptidomimétiques, béta-bloquants, anti-dépresseurs, Le choix difficile entre racémate ou énantiomère est discuté (de la thalidomide à la lévocétérizine). La démarche d'optimisation des molécules " lead " est présentée sur la base du cahier des charges des propriétés ADMET à satisfaire (adsorption, distribution, métabolisme, excrétion, toxicité). Dans ce contexte, on présente aussi les notions de pro-drogues et de " drug delivery systems ". Les méthodes QSAR (quantitative structure-activity relationship) sont abordées (bioisostérique, " drug likeness ", modélisation moléculaire, méthodes in silico). On évoque également les méthodes actuelles de screening rapide d'activité (HTS, high throughput screening) et les outils spectroscopiques associés (RMN, masse). Finalement, l'approche rationnelle " structure-based drug design " est illustrée avec les inhibiteurs de l'ACE (angiotensin converting enzym) de l'HMG-CoA-reductase (les statines), de la thrombine et des agonistes delta-opioïdes. Méthode d'enseignement et d'apprentissage Exposé avec présentation de transparents (ou méthode power point)-Enseignement interactif avec discussions-Distribution de documents complémentaires (articles récents,) à examiner à domicile.

Autres infos :	Pré-requis : - cours de chimie et biochimie de baccalauréat (Bac CHIM avec mineure en biologie ou Bac BIOL avec mineure en chimie) - Relation avec d'autres enseignements : Le cours est construit de manière à être accessible avec un strict minimum de rappel de définitions des termes pharmacologiques. Cependant, une bonne introduction sur les bases de la pharmacologie serait très profitable aux chimistes (les cibles pharmacologiques et leur fonctionnement, les agonistes et antagonistes, la biodistribution, l'élimination,). Les chimistes intéressés par la chimie médicinale, sont invités à inclure dans leur programme le cours BIOL 2226 de pharmacologie cellulaire et AGRO 2750 de toxicologie humaine et animale. La protection de l'innovation dans l'industrie du médicament est également un aspect très important, non traité dans le cours CHM 2244, car elle fait partie d'un autre enseignement SC 3001-Recherche, innovation et propriété intellectuelle : application aux secteur de la chimie et aux sciences de la vie. Évaluation : - Présentation d'un travail (écrit et séminaire) sur base d'articles de la littérature. Le thème est choisi par l'étudiant, en accord avec le titulaire, sur la base de ses centres d'intérêt personnels. Supports : - Notes de cours du professeur - Articles de revues - Livres de la bibliothèque CHIM.
Faculté ou entité en charge:	CHIM

Programmes / formations proposant cette unité d'enseignement (UE)

Intitulé du programme	Sigle	Crédits	Prérequis	Acquis d'apprentissage
Master [120] en biochimie et biologie moléculaire et cellulaire	BBMC2M	3	-	
Master [120] en sciences chimiques	CHIM2M	3	-	