

6 crédits	45.0 h + 30.0 h	Q1
-----------	-----------------	----

Enseignants	Frédéric Raphaël coordinateur ; Lambert Didier ;
Langue d'enseignement	Français
Lieu du cours	Bruxelles Woluwe
Préalables	WFARM1008 conception du médicament WFARM1231 chimie organique 2 <sup>ième</sup> partie WFARM1221 Biochimie WFARM1232 Pharmacologie générale <i>Le(s) prérequis de cette Unité d'enseignement (UE) sont précisés à la fin de cette fiche, en regard des programmes/formations qui proposent cette UE.</i>
Thèmes abordés	<p>Ce cours est une introduction générale à la chimie médicinale. Le dispositif pédagogique présente deux parties distinctes : (i) des cours théoriques donnés ex cathedra où sont abordés les grandes stratégies de la conception d'un médicament, illustrées aux moyen d'exemples de la littérature et (ii) des activités d'auto-apprentissage/enseignement qui visent la compréhension des propriétés lead-like.</p> <p>Lors des cours théoriques, sont abordés : les rappels des notions de pharmacologie élémentaire, les interactions intermoléculaires, les grande stratégies de découverte de « hits », les grandes stratégies d'optimisation de « hit en lead », les nouvelles stratégies en chimie médicinale (approche par fragments, ').</p> <p>Les activités d'auto-apprentissage permettent à l'étudiant.e de se familiariser avec les propriétés « lead-like » importantes à prendre en compte lors de l'optimisation d'un médicament comme par exemple : la solubilité, la lipophilie, la stabilité, la perméabilité, la toxicité, Herg, la barrière hémato-encéphalique, les transporteurs, etc. Ces activités comprennent deux parties : un travail individuel d'auto-apprentissage écrit sur une propriété lead-like en particulier, et une présentation orale en groupe (auto-enseignement).</p>
Acquis d'apprentissage	<p>Au terme de cette activité pédagogique, l'étudiant.e sera capable de :</p> <ul style="list-style-type: none"> <li>- Comprendre, interpréter, discuter les relations structure-activités et structure-propriétés physicochimiques importantes pour le développement d'un nouveau médicament</li> <li>- Proposer des modifications structurales en vue d'améliorer l'affinité et/ou les propriétés pharmacocinétiques d'un hit</li> <li><sup>1</sup> - Effectuer une recherche bibliographique, analyser les résultats de cette recherche et en extraire les éléments importants</li> <li>- Présenter les résultats d'une recherche de façon structurée</li> <li>- Expliquer oralement une problématique importante de conception de médicaments.</li> <li>- Travailler en équipe</li> </ul> <p>-----</p> <p><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></p>
Modes d'évaluation des acquis des étudiants	<p>L'évaluation consiste :</p> <ul style="list-style-type: none"> <li>- pour 60% de la note finale de l'UE WFARM1302 en un examen écrit portant sur les différentes parties de l'équipe d'enseignant (30% Frédéric et 30% Lambert)</li> <li>- pour 25% de la note finale de l'UE WFARM1302 en un travail sur les propriétés lead-like. La note attribuée pour ce travail comprend :                         <ul style="list-style-type: none"> <li>o Evaluation des travaux écrits individuels (15%)</li> <li>o Evaluation des présentations orales par les co-titulaires (10%).</li> </ul> </li> <li>- pour 15% de la note finale de l'UE WFARM1302, un rapport de TP présenté sous la forme d'une mini-publication.</li> </ul> <p>Pour chacune de ces 3 parties de l'évaluation, une note de 7/20 ou moins implique une pénalité de 1 point sur la note finale de l'UE WFARM1302</p>
Contenu	Notions de pharmacologie générale de chimie, de biochimie ; rappels des interactions ligand-récepteur ; découverte de hit : méthodes, applications, stratégies ; approches de hit-to-lead : aspects qualitatifs, aspects quantitatifs, drug design rationnel ; paramètres physicochimiques : pKa, LogP, PSA, ' ; Propriétés lead-like : solubilité, perméabilité, barrière hématoencéphalique, stabilité métabolique, stabilité en solution et dans le plasma, inhibitions des CYP, transporteurs, liaisons aux protéines plasmatiques, toxicité, prodrogues, '.

Bibliographie	Drug-like Properties: Concepts, Structure Design and Methods, 1st Edition from ADME to Toxicity Optimization Authors: Li Di Edward Kerns The Practice of Medicinal Chemistry, Editors: Camille Wermuth David Aldous Pierre Raboisson Didier Rognan
Autres infos	Encadrement : Cours théorique : Prof. Raphaël Frédérick et Prof Didier Lambert; TP : 2 assistants + un membre du personnel technique pour les laboratoires. Coordonnées du coordinateur du cours : Prof. Raphaël Frédérick, Tél : 02 764 73 41, email : raphael.frederick@uclouvain.be, Louvain Drug Research Insitute, Medicinal Chemistry Research group, tour van Belmont (4ième étage) 73 avenue Mounier, 1200 Bruxelles
Faculté ou entité en charge:	FARM

<b>Programmes / formations proposant cette unité d'enseignement (UE)</b>				
Intitulé du programme	Sigle	Crédits	Prérequis	Acquis d'apprentissage
Bachelier en sciences pharmaceutiques	FARM1BA	6	WFARM1008 ET WFARM1231 ET WFARM1232 ET WFARM1219	