UCLouvain

wfarm1231

Structure et stratégie de synthèse des médicaments

10.00 crédits	45.0 h + 120.0 h	Q1 et Q2

Enseignants	Ayadim Mohamed ;Frédérick Raphaël (coordinateur(trice)) ;
Langue d'enseignement	Français
Lieu du cours	Bruxelles Woluwe
Préalables	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.
Thèmes abordés	L'essentiel de la réactivité des composés organiques a été décrit en WMD1106. Le cours de Chimie Organique de deuxième année ajoute quelques éléments nouveaux (p. ex. la chimie hétérocyclique) et complète la formation (importance des réactions permettant la formation des liens carbone-carbone), mais son objectif essentiel est de faire travailler les étudiants sur la rétrosynthèse des principes actifs. Il s'agit de présenter aux étudiants un certain nombre de principes actifs commercialisés en Belgique et de les amener à proposer une voie de synthèse de ces composés à partir de blocs de construction (synthons) élémentaires. Les buts de l'opération sont (i) de mettre en oeuvre l'analyse fonctionnelle des composés organiques (ii) de montrer que la plupart des principes actifs ont été conçus de façon modulaire (pour assurer la diversité de structure des familles) (iii) d'appliquer les connaissances acquises en chimie organique aux grandes classes pharmacologiques. Le but général est de développer les raisonnements basés sur la structure moléculaire des principes actifs. Les laboratoires sont là pour illustrer la synthèse organique et former les étudiants aux manipulations pratiques, acquis important pour la recherche et la galénique officinale, voire industrielle. Le dispositif pédagogique est construit sur base de la méthode des classes inversées (flipped classroom). Selon ce dispositif pédagogique, les étudiants sont amenés à visionner, avant la séance en présentiel, une petite capsule vidéo disponible via la plateforme Moodle. Dans cette capsule vidéo, les éléments de théorie de chimie organique indispensables à la compréhension et à la réalisation des exercices et des rétrosynthèses proposées sont détaillés. Les séances en présentiel sont dédicacées à la réalisation de problèmes de rétrosynthèse de principes actifs de médicament. Pour chaque principe actif, une « lecture moléculaire » est systématiquement réalisée ensemble. Ensuite l'application des éléments de théorie repris dans les capsules vidéo permet aux
Acquis d'apprentissage	A la fin de cette unité d'enseignement, l'étudiant est capable de : Au terme de cette activité pédagogique, l'étudiant e sera capable de : Adopter une lecture moléculaire (renforcement des concepts vus en WFARM1004 et WMD1106) Comprendre et détailler les mécanismes des principales réactions en chimie organique Proposer un chemin rétro-synthétique pour une molécule ou un principe actif en particulier Proposer des conditions expérimentales permettant d'envisager la synthèse de molécules et de principes actifs Mettre en pratique la synthèse de molécules simples

Modes d'évaluation des acquis des étudiants

L'évaluation de l'UE WFARM1231 comporte trois parties :

- 1) L'évaluation du cours théorique se présente sous la forme d'un examen écrit final en juin et intervient pour 70% de la note finale. Une évaluation écrite dispensatoire est proposée en janvier. Les étudiants qui obtiennent une note en janvier supérieure ou égale à 10/20 sont dispensés de la matière vue au Q1 lors de l'examen de juin. La note obtenue en janvier intervient dans ce cas pour la moitié de la note finale de juin (35% janvier + 35% juin portant sur la matière du Q2)
- 2) L'évaluation des travaux dirigés (TD) se présente sous la forme de 4 interrogations écrites obligatoires, 2 interrogations au Q1 et 2 interrogations au Q2. La moyenne de ces 4 interrogations intervient pour 15% de la note finale.
- 3) L'évaluation des travaux pratiques (TP) se présente sous la forme de 4 interrogations obligatoires, 2 interrogations au Q1 et 2 interrogations au Q2. La moyenne de ces 4 interrogations intervient pour 15% de la note finale. En outre, le cahier de laboratoire doit être jugé suffisamment complet et propre. L'état du cahier de laboratoire doit notamment permettre à un expérimentateur extérieur de refaire n'importe quelle manipulation du cahier.

Mesures pour les étudiant.e.s répétant le cours suite à un échec l'année précédente :

Les étudiant.e.s ayant une note finale pour l'UE WFARM1231 < 10 sont dispensé.e.s des TP (participation aux séances expérimentales et interros) si ils.elles ont obtenu une moyenne > ou égale à 10 pour les 4 interrogations de TP. Ceci n'est valable que si ils.elles ont présenté au moins 3 interros de TP (max 1 absence justifiée ou non). Les étudiant.e.s ayant une note finale pour l'UE WFARM1231 < 10 sont dispensé.e.s des TP (participation aux séances expérimentales uniquement) mais pas des interros de TP, si ils.elles ont participé à toutes les séances (maximum 2 absences injustifiées ou maximum 1/3 d'absence aux séances même si celles-ci sont justifiées). En outre pour ces étudiant.e.s le cahier de laboratoire doit être jugé suffisamment complet et propre. L'état du cahier de laboratoire doit notamment permettre à un expérimentateur extérieur de refaire n'importe quelle manipulation du cahier.

Les étudiant.e.s ayant une note finale pour l'UE WFARM1231 < 10 sont dispensé.e.s des TD (interros) si ils.elles ont une moyenne > 10 pour leurs 4 interros de TD. Ceci n'est valable que si ils.elles ont présenté au moins 3 interros de TD (max 1 absence justifiée ou non).

Les étudiant.e.s dispensé.e.s des interros de TD et de TP auront pour note finale de l'UE WFARM1231 la note de l'examen théorique de WFARM1231.

Les étudiant.e.s dispensé.e.s des interros de TD auront pour note finale la note de l'examen théorique de WFARM1231 (85%) + la note de de TP refaite l'année suivante (15%).

Les étudiant.e.s dispensé.e.s des interros de TP auront pour note finale la note de l'examen théorique de WFARM1231 (85%) + la note de TD refaite l'année suivante (15%).

Méthodes d'enseignement

L'essentiel de la réactivité des composés organiques a été décrit en chimie organique WMD1106. Le cours de "Structure et stratégie de synthèse des médicaments" ajoute quelques éléments nouveaux (p. ex. quelque notions sur la chimie hétérocyclique) et complète la formation (importance des réactions permettant la formation des liens carbone-carbone), mais son objectif essentiel est de faire travailler les étudiants sur leur compréhension de la structure des médicaments et leur rétrosynthèse. Il s'agit de présenter aux étudiants un certain nombre de principes actifs commercialisés en Belgique et de les amener à réfléchir quant aux stratégies de synthèse donnant accès à ces composés à partir de blocs de construction élémentaires. Les buts de l'opération sont (i) de mettre en oeuvre l'analyse fonctionnelle des composés organiques (ii) de montrer que la plupart des principes actifs ont été conçus de façon modulaire (pour assurer la diversité de structure des familles - lien avec le cours de chimie pharmaceutique WFARM1302) (iii) d'appliquer les connaissances acquises en chimie organique aux grandes classes pharmacologiques. Le but général est de développer les raisonnements basés sur la structure moléculaire des principes actifs.

Les laboratoires sont là pour illustrer la synthèse organique et former les étudiants aux manipulations pratiques, acquis important pour la recherche et la galénique officinale, voire industrielle.

Le dispositif pédagogique est construit sur base de la méthode des classes inversées (flipped-classroom). Selon ce dispositif pédagogique, les étudiants sont amenés à visionner, avant la séance en présentiel, une capsule vidéo disponible via la plateforme Moodle. Dans cette capsule vidéo, les éléments de théorie indispensables à la compréhension et à la réalisation des exercices sont détaillés. Les séances en présentiel sont notamment dédicacées à la réalisation de problèmes de rétrosynthèse de principes actifs de médicament. Pour chaque principe actif, une « lecture moléculaire » est systématiquement réalisée ensemble. Ensuite l'application des éléments de théorie repris dans les capsules vidéo permet aux étudiants d'envisager la (rétro)synthèse et, par la suite, la synthèse des molécules. L'étudiant est donc particulièrement acteur de sa propre formation, l'enseignant adoptant une attitude de coach. Le savoir émane donc de tous et pas uniquement du Professeur.

Contenu

Ce cours est en continuité stricte avec les cours WMD1106 (chimie organique), WMD1105 (chimie générale et minérale) et WFARM1004 (chimie appliquée aux médicaments). Il veut familiariser les étudiants avec la structure et les stratégies de synthèse des molécules organiques et des médicaments en particulier. Chaque fois que c'est possible, les exemples de synthèse choisis proviennent de l'ouvrage "Pharmaceutical Substances, Synthesis, Patents, Applications", A.Kleeman, J.Engel, B.Kutscher et D.Reichert, Georg Thieme Eds, Stuttgart, New York (dernière édition). Le critère retenu pour choisir une molécule est sa présence dans le "Répertoire commenté des Médicaments" du Centre Belge d'Information Pharmacothérapeutique disponible en ligne : https://www.cbip.be/ (dernière édition).

Autres infos	Encadrement : Cours théoriques : Prof. Raphaël Frédérick ; TD : Mohamed Ayadim, 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 Helmont (4ième étage) 73 avenue Mounier, 1200 Bruxelles La participation aux travaux pratiques, aux travaux dirigés et séances d'exercices est obligatoire et indispensable pour valider l'unité d'enseignement.Toute absence injustifiée entraîne une pénalité à l'examen de l'UE qui peut aller jusqu'à l'annulation de la cote d'examen pour l'année d'étude considérée (0/20). En cas d'absences répétées même justifiées, l'enseignant peut proposer au jury de s'opposer à l'inscription à l'examen relatif à l'UE en respect de l'article 72 du RGEE
Faculté ou entité en charge:	FARM

Programmes / formations proposant cette unité d'enseignement (UE)							
Intitulé du programme	Sigle	Crédits	Prérequis	Acquis d'apprentissage			
Bachelier en sciences pharmaceutiques	FARM1BA	10	WMD1105 ET WMD1106 ET WFARM1003 ET WFARM1004	Q			