

6.00 crédits	45.0 h + 30.0 h	Q1 et Q2
--------------	-----------------	----------

Enseignants	Frédéric Raphaël (coordinateur(trice)) ; Lambert Didier ;
Langue d'enseignement	Français
Lieu du cours	Bruxelles Woluwe
Préalables	<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>A la fin de cette unité d'enseignement, l'étudiant est capable de :</p> <p>Au terme de cette activité pédagogique, l'étudiant.e sera capable de :</p> <ul style="list-style-type: none"> - Comprendre, interpréter, discuter les relations structure-activités et structure-propriétés physicochimiques importantes pour le développement d'un nouveau médicament - Proposer des modifications structurales en vue d'améliorer l'affinité et/ou les propriétés pharmacocinétiques d'un hit ¹ - Effectuer une recherche bibliographique, analyser les résultats de cette recherche et en extraire les éléments importants - Présenter les résultats d'une recherche de façon structurée - Expliquer oralement une problématique importante de conception de médicaments. - Travailler en équipe
Modes d'évaluation des acquis des étudiants	<p>L'évaluation comporte plusieurs parties :</p> <p>Partie 1: consiste en un examen écrit en janvier portant sur les différentes parties de l'équipe d'enseignants. La note obtenue (35% Frédéric et 35% Lambert) est conservée et intervient pour 70% de la note finale de l'UE WFARM1302 attribuée en juin.</p> <p>Partie 2: intervient pour 20% de la note finale de l'UE WFARM1302 et consiste en :</p> <p>a) l'évaluation des travaux écrits individuels (approche par projet Q1 + Q2) qui intervient pour 15% de la note finale de l'UE WFARM1302</p> <p>b) l'évaluation des présentations orales (auto-enseignement) qui intervient pour 5% de la note finale de l'UE WFARM1302.</p> <p>Partie 3. intervient pour 10% de la note finale de l'UE WFARM1302 et consiste en l'évaluation d'un rapport de TP présenté sous la forme d'une mini-publication.</p> <p>La note finale de l'UE WFARM1302 attribuée en juin comprend la partie 1 (70% obtenue en janvier), la partie 2 (20%) et la partie 3 (10%).</p>

<p>Méthodes d'enseignement</p>	<p>Le cours WFARM1302 est une activité qui se déroule au Q1+Q2. Le dispositif pédagogique présente trois parties distinctes :</p> <p>Partie 1: 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. Ces cours théoriques ne se déroulent qu'au premier quadrimestre. L'évaluation finale de cette partie a donc lieu en janvier pour la première session et en septembre pour la seconde.</p> <p>Partie 2: des activités d'auto-apprentissage/enseignement selon une approche par projet qui vise la compréhension des propriétés lead-like. cette activité se déroule sur les deux quadrimestres et est évaluée en juin pour la première session et en septembre pour la seconde.</p> <p>Partie 3: des travaux pratiques qui sont organisés et évalués sous forme d'une évaluation unique au Q2.</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>
<p>Contenu</p>	<p>Ce cours est une introduction générale à la chimie médicinale.</p> <p>Les principales notions vues au cours sont : des rappels 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.</p>
<p>Bibliographie</p>	<p>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</p>
<p>Autres infos</p>	<p>Encadrement : Cours théorique : Prof. Raphaël Frédéric et Prof Didier Lambert; TP : 2 assistants + un membre du personnel technique pour les laboratoires.</p> <p>Coordonnées du coordinateur du cours : Prof. Raphaël Frédéric, 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</p> <p>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</p>
<p>Faculté ou entité en charge:</p>	<p>FARM</p>

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