

Faculté de médecine



FARM1359 Drug design en chimie pharmaceutique

[15h] 2 crédits

Enseignant(s): Didier Lambert (coord.), Jacques Poupaert
Langue d'enseignement : français
Niveau : Premier cycle

Objectifs (en termes de compétences)

Le cours vise à initier l'étudiant à la conception rationnelle de médicaments (" drug design ") au moyen d'exemples choisis tant dans les modulations pharmaco-chimiques classiques que dans l'approche rationnelle basée sur la structure tridimensionnelle de la cible. Il propose en outre une introduction à la modélisation moléculaire (mécanique moléculaire, dynamique moléculaire, et méthodes semi-quantiques) et aux méthodes de drug discovery moderne utilisant le recours à des banques de produits (chimie combinatoire, high trough-put screening, ...).

Objet de l'activité (principaux thèmes à aborder)

Ce cours à options se propose d'approfondir les notions présentées au cours de chimie pharmaceutique.

Les notions de drug design sont abordés au travers d'exemples choisis. Elles comprendront:

- les concepts de pharmacomodulations (ligands des récepteurs opioïdes, GABA, glutamate, mélatonine, dopamine et sérotonine)

-Approche rationnelle basée sur la structure (de la cible biologique): inhibition enzymatique

Connaissance de la structure tridimensionnelle (rayons X, RMN, modélisation moléculaire, approche par pharmacophore) en intégrant les notions vues au cours de biophysique, interactions principe actif-cible (" docking ", mutagenèse dirigée, chimères, co-cristallisation#)