UCLouvain

wfarm1302

2025

Chimie pharmaceutique

6.00 crédits	45.0 h + 30.0 h	Q1 et Q2

Cette unité d'enseignement n'est pas accessible aux étudiants d'échange !

Enseignants	Frédérick Raphaël (coordinateur(trice)) ;Lambert Didier ;Ravez Séverine (supplée Frédérick Raphaël) ;Spillier Quentin ;
Langue d'enseignement	Français > English-friendly
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	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. 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, '). 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).
Acquis d'apprentissage	**A la fin de cette unité d'enseignement, l'étudiant est capable de :** 1 Au terme de cette activité pédagogique, l'étudiant.e sera capable de : - 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 - 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	L'évaluation comporte plusieurs sections : **Section 1 (théorique):** Trois parties théoriques sont données par trois enseignants différents, deux en Q1 et l'autre en Q2. L'évaluation consiste en un **examen écrit en janvier** portant sur les deux premières parties de l'équipe d'enseignants. La troisième partie (propiétés lead-like) sera évaluée par un **examen écrit en juin** . L **'ensemble des trois parties** représente 70 % de la note globale. **Section 2 (présentation orale) :** L'évaluation des **présentations orales en groupe (** illustration des propriétés lead-like) intervient pour 10 % de la note finale de l'UE WFARM1302. **Section 3 (Travaux pratiques).** La note pour les travaux pratiques intervient pour 20% 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. La note finale de l'UE WFARM1302 attribuée en juin comprend les parties théoriques (70% obtenue), la partie 2 consiste en la présentaiton orale en groupe (10%) et la partie 3 des travaux pratiques (10%). **L'absence de participation à une des trois sections entraine automatiquement une note de 0/20 pour l'ensemble des sections.** **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 WFARM1302 < 10 sont dispensé.e.s de la section 2 si ils.elles ont obtenu une moyenne > ou égale à 10 pour cette partie. Les étudiant.e.s ayant une note finale pour l'UE WFARM1302 < 10 sont dispensé.e.s de la PARTIE 3 (TP) si ils.elles ont obtenu une moyenne > ou égale à 10 pour cette partie. 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 dispensé.e.s de la section 2 auront pour note finale de l'UE WFARM1302 la note de l'examen théorique PARTIE 1 (80%) + note de la partie 3 (20%). Les étudiant.e.s dispensé.e.s de lasection 3 auront pour note finale de l'UE WFARM1302 la note de l'examen théorique PARTIE 1 (90%) + note de la partie 2 (10%). Les étudiant.e.s dispensé.e.s des sections 2 et 3 auront pour note finale de l'UE WFARM1302 la note de l'examen théorique PARTIE 1 (100%). **Mesures pour les étudiant.e.s admis.e.s dans le programme Erasmus :** Les étudiant.e.s admis.e.s en Erasmus sont dipensés des activités données au Q2 à savoir la troisième partie de la section 1 théorique, la présentation orale (section 2) et les travaux pratiques (section 3). La note de l'activité d'enseignement représentera la moyenne des deux premières parties de la section théorique.
Méthodes d'enseignement	Le cours WFARM1302 est une activité qui se déroule durant toute l'année académique (Q1+Q2). Le dispositif pédagogique présente trois parties distinctes : **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. Deux parties sont données au Q1, la troisième au Q2. **Partie 2:** La troisième partie vise la compréhension des propriétés lead-like : 1 : Lipophilie, pKa et Solubilité 2 : Perméabilité et Prodrogues 3 : L'inhibition des cytochromes et le métabolisme 4 : La liaison aux protéines plasmatiques 5 : L'inhibition de hERG et toxicité L'enseignant abordera pour chaque point les bases et concepts théoriques. Pour chaque partie, trois groupes d'étudiants illustreront sur base d'un article donné par le titualire les propriétés lead-like envisagées. Le groupe d'étudiant présentera devant l'ensemble de l'auditoire les exemples trouvés. La présentation orale fera l'objet d'une partie de la note globale. **Partie 3:** des travaux pratiques qui sont organisés et évalués sous forme d'une évaluation unique au Q2. Les étudiantes et étudiants seront amenés à rassembler leurs résultats expériementaux sous forme d'une mini-publication scientifique. 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). Les propriétés « lead-like » sont 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 : les concepts présentéd par le titulaire et une présentation orale en groupe (auto-enseignement) d'exemples illustreront la mise en oeuvre de la propiété lead-like.
Contenu	Ce cours est une introduction générale à la chimie médicinale. 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.

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 (suppléants Prof. Séverine Ravez et Prof. Quentin Spillier) et Prof Didier Lambert; TP : 2 assistants + un membre du personnel technique pour les laboratoires. Coordonnées du coordinateur du cours pour l'année académique 24-25: Prof. Didier Lambert, Tél : 02 764 73 43, email : didier.lambert@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.La présentation orale en groupes est également obligatoire. 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	6	WFARM1231 ET WFARM1232 ET WFARM1219	