

Conception et développement de principes actifs médicamenteux

Présentation (10 lignes max)

Introduction, cibles, interactions de faible énergie, mesure de l'activité
Cibles thérapeutiques, interactions ligands-récepteurs/enzymes...
Identifications des hits, hits/leads (approches traditionnelles et nouvelles)
Paramètres physicochimiques dans la conception de principes actifs (PAs)
Etudes de relations structure-activité: optimisation des propriétés, pharmacomodulations (exemples)
Paramètres physicochimiques, règles de Lipinski
Hits/PAs multicibles, redécouverte d'anciens PAs, hit/ lead/ PA : études de relations structure-activité
Aspects ADMETox, biotransformations
Principales voies métaboliques, métabolites actifs/toxiques, élimination, détoxification
Aspects pharmacoéconomiques, contraintes réglementaires

Objectifs / compétences à acquérir (10 lignes max)

Objectifs/Compétences à acquérir
Connaître les notions fondamentales et indispensables dans la conception d'une molécule biologiquement active. Comprendre et illustrer par des exemples les différentes approches permettant d'identifier des molécules dites « touches » (leads) et leur développement vers un principe actif médicamenteux (PA).
Connaître les différents outils de pharmacomodulation en tenant compte des contraintes (physicochimiques, pharmacologiques, métaboliques...) rencontrées au cours de ce processus. Connaître les principales voies métaboliques et comprendre l'importance des propriétés physicochimiques des candidats PA sur leur devenir après l'administration.

Structure et organisation pédagogiques

Volume Horaire (CM, TD, TP) : 22,5h CM, 4,5h TD
Pour les projets tutorés et les stages : durée pour l'étudiant (en heures ou semaines ou mois) : néant

ECTS : 3