

**Baccalauréat en Chimie****BCM 400 – CHIMIE PHARMACEUTIQUE**

| Cours             |                       | Nom       | Horaire de disponibilité                             |
|-------------------|-----------------------|-----------|--|
| Titre             | Chimie Pharmaceutique | Yves Dory | À préciser avec chaque professeur en début de cours. |
| Sigle             | BCM 400               |           |  |
| Crédits           | 3                     |           |  |
| Travail personnel | 6 heures/semaine      |           |  |
| Session           | 5                     |           |  |

| Place du cours dans le programme                                    |                |                        |
|---|----------------|------------------------|
| <b>Type de cours</b>  | <b>OPTION</b>  | <b>Cours offert en</b> |
| <b>Cours préalable</b>  | <b>BCM 300</b> | <b>Session 5</b>       |
| <b>Cours concomitant</b>  |                |                        |
| <b>Horaire : lundi de 13h30 à 15h20 et vendredi de 8h30 à 10h20</b> |                |                        |

**Mise en contexte du cours**

Le comportement biologique des médicaments dépend de leurs propriétés physico-chimiques, de leur réactivité chimique et de leurs structures chimiques 2D et surtout 3D. Il faut donc bien connaître ces éléments pour comprendre la façon dont elles se comportent pour effectuer leur action sur les systèmes vivants.

**Objectifs du cours****Objectif général**

Connaître les propriétés et la réactivité des médicaments et autres substances biologiquement actives. Se familiariser avec leurs structures 2D et 3D pour être capable d'en comprendre le comportement chimique et les propriétés physicochimiques.

**Objectifs spécifiques**

Logique de conception des médicaments en fonction des cibles biologiques, c'est-à-dire leur localisation, leurs propriétés structurales, leur réactivité et leur position dans les chemins métaboliques.

## Plan de la matière

| <b>BCM 400 - Chimie Pharmaceutique</b>                                  |  |
|---|--|
| <b>lundi de 13h30 à 15h20 et vendredi de 8h30 à 10h20 local D1-2120</b> |  |
| <b>Périodes</b>   | <b>Contenu</b>   |
| 2 heures<br>Semaine 1<br>7 janvier                                      | Introduction et description du cours.<br>Chapitre 1 : La conception des médicaments<br>1.1 Les voies de la découverte des médicaments<br>1.1.1 Modification de molécules actives connues<br>Chapitre 1 : La conception des médicaments (suite)<br>1.1 Les voies de la découverte des médicaments (suite)<br>1.1.2 Tri systématique. (Screening)  |
| 4 heures<br>Semaine 2<br>10 - 14 janvier                                | Chapitre 1 : La conception des médicaments (suite)<br>1.1 Les voies de la découverte des médicaments (suite)<br>1.1.3 Valorisation d'informations biologiques<br>1.1.4 Approches rationnelles<br>Chapitre 1 : La conception des médicaments (suite)<br>1.2 La phase développement du prototype<br>1.1 Le pharmacophore   |
| 4 heures<br>Semaine 3<br>17 - 21 janvier                                | Chapitre 1 : La conception des médicaments (suite)<br>1.2 La phase développement du prototype (suite)<br>1.2 La relation structure activité (SAR)<br><b>EXERCICES du chapitre 1</b>  |
| 4 heures<br>Semaine 4<br>24 - 28 janvier                                | Chapitre 2 : Les récepteurs<br>2.1 Structures et propriétés des récepteurs<br>2.2 Les interactions médicament-récepteur<br>2.2.1 Les forces impliquées dans le complexe médicament-récepteur<br>2.2.2 Quantification des interactions médicament-récepteur<br>2.2.3 Les théories d'interaction médicament / récepteur<br>Chapitre 2 : Les récepteurs (suite)<br>2.2 Les interactions médicament-récepteur (suite)<br>2.2.4 Pluralité des récepteurs à un médiateur ou à une famille de médiateurs<br>2.2.5 Topologie des interactions médicament-récepteur |
| <b>3 - 14 février</b>   | <b>Semaine des entrevues de stage du 1<sup>er</sup> au 5 février</b>   |
| 4 heures<br>Semaine 5<br>7 - 11 février                                 | Chapitre 2 : Les récepteurs (suite)<br>2.3 Conceptions de ligands pour récepteurs<br>2.3.1 Les antihistaminiques H <sub>2</sub><br>2.3.1 Les récepteurs adrénergiques β<br>2.3.1 Les canaux calciques<br><b>EXERCICES du chapitre 2</b>  |
| 0 ou 4 heures<br>Semaine 6<br>14 - 18 février                           | Chapitre 3 : Les enzymes<br>3.1 Structures et propriétés des enzymes<br>3.1.1 La catalyse enzymatique<br>3.1.1 Le rôle des coenzymes<br>Chapitre 3 : Les enzymes (suite)<br>3.1 Structures et propriétés des enzymes (suite)<br>3.1.3 Les substrats d'enzymes comme médicaments  |

**BCM 400 - Chimie Pharmaceutique**  
**lundi de 13h30 à 15h20 et vendredi de 8h30 à 10h20 local D1-2120**

| <b>Périodes</b>                                | <b>Contenu</b>   |
|--|--|
| 0 ou 4 heures<br>Semaine 7<br>21 - 25 février  | <b>QUESTIONS et EXERCICES des chapitres 1 et 2</b><br><b>EXAMEN INTRA</b>  |
| 28 février - 4 mars                            | <b>SEMAINE de RELACHE</b>  |
| 4 heures<br>Semaine 8<br>7 - 11 mars           | Chapitre 3 : Les enzymes (suite)<br>3.2 Inhibition et désactivation des enzymes<br>3.2.1 Définitions<br>3.2.2 La résistance aux médicaments<br>3.2.3 Le synergisme<br>Chapitre 3 : Les enzymes (suite)<br>3.2 Inhibition et désactivation des enzymes (suite)<br>3.2.4 Classification des inhibiteurs d'enzymes<br>3.2.5 Inhibition non covalente  |
| 4 heures<br>Semaine 9<br>14 - 18 mars          | Chapitre 3 : Les enzymes (suite)<br>3.2 Inhibition et désactivation des enzymes (suite)<br>3.2.5 Inhibition non covalente (suite)<br>3.2.6 Inhibition covalente<br><b>EXERCICES du chapitre 3</b>  |
| 4 heures<br>Semaine 10<br>21 - 25 mars         | <ul style="list-style-type: none"> <li>• Chapitre 4 : L'ADN               <ul style="list-style-type: none"> <li>4.1 Structures et propriétés de l'ADN                   <ul style="list-style-type: none"> <li>4.1.1 La tautomérie des bases</li> <li>4.1.2 La structure tertiaire de l'ADN</li> </ul> </li> <li>4.2 Les médicaments qui interagissent avec l'ADN                   <ul style="list-style-type: none"> <li>4.2.1 Les intercalants</li> <li>4.2.2 Les alkylants</li> </ul> </li> </ul> </li> <li>• Chapitre 4 : L'ADN (suite)               <ul style="list-style-type: none"> <li>4.2 Les médicaments qui interagissent avec l'ADN (suite)</li> <li>4.2.3 Les agents de scission de l'ADN</li> <li>4.3 Les analogues de nucléosides (antiviraux)</li> <li>4.4 Les substances interagissant avec la tubuline                   <ul style="list-style-type: none"> <li>4.4.1 Le taxol et le cycle cellulaire</li> </ul> </li> </ul> </li> </ul> |
| 4 heures<br>Semaine 11<br>28 mars -<br>1 avril | <ul style="list-style-type: none"> <li>• EXERCICES du chapitre 4</li> <li>• Chapitre 5 : Le métabolisme et les prodrogues               <ul style="list-style-type: none"> <li>5.1 L'étude du métabolisme des médicaments                   <ul style="list-style-type: none"> <li>5.1.1 La synthèse de produits radioactifs</li> <li>5.1.2 Les méthodes analytiques</li> </ul> </li> <li>5.2 Les routes de désactivation et d'élimination des médicaments                   <ul style="list-style-type: none"> <li>5.2.1 Les transformations de phase I</li> </ul> </li> </ul> </li> </ul>  |

| <b>BCM 400 - Chimie Pharmaceutique</b>                                  |  |
|---|--|
| <b>lundi de 13h30 à 15h20 et vendredi de 8h30 à 10h20 local D1-2120</b> |  |
| <b>Périodes</b>   | <b>Contenu</b>   |
| 4 heures<br>Semaine 12<br>4 - 8 avril                                   | <ul style="list-style-type: none"> <li>• Chapitre 5 : Le métabolisme et les prodrogues (suite)               <ul style="list-style-type: none"> <li>5.2 Les routes de désactivation et d'élimination des médicaments (suite)                   <ul style="list-style-type: none"> <li>5.2.1 Les transformations de phase I (suite)</li> <li>5.2.2 Les transformations de phase II</li> </ul> </li> <li>5.3 Médicaments durs et mous</li> </ul> </li> <li>5.4 Les prodrogues               <ul style="list-style-type: none"> <li>5.4.1 Les prodrogues hydrolysables</li> <li>5.4.2 Les prodrogues bio-activables</li> </ul> </li> </ul> <p><b>EXERCICES du chapitre 5 - QUESTIONS et EXERCICES des chapitres 3 à 5</b><br/><b>QUESTIONS LIBRES</b></p> |
| <b>3 heures</b><br><b>15 - 29 avril</b>                                 | <b>EXAMEN FINAL - Date à confirmer</b>   |

**Consultez l'horaire officiel pour les dates des évaluations.**

---

### **Méthodes pédagogiques**

---

Cours magistraux (75%), exercices dirigés et résolution de problèmes (25%).

### **Évaluation**

---

1. Moyens d'évaluation : deux examens (intra et final)  
une étude de cas (présentation orale + rapport)
2. Types de questions : connaissance (50%), raisonnement (50%)
3. Pondération : examen intra (33%)  
examen final (33%) (non cumulatif)  
présentation orale (19%)  
rapport (15%)
4. Moments prévus  
Pour l'évaluation : fixés par la faculté  
Présentation + rapport pendant la semaine 11
5. Critères d'évaluation : connaissance de base (40%)  
raisonnement (40%)  
exactitude des réponses (20%)

---

### **Bibliographie**

---

Livres de référence (très fortement recommandé) :

Molecules and Medicine. E.J. Corey, B. Czako, L. Kurti, Wiley; ISBN: 978-0-470-22749.

(Le livre suivant est facultative)

The Organic Chemistry of Drug Design and Drug Action, Second Edition, Richard B. Silverman, Academic Press; 2 édition (2004) , ISBN: 0126437327