

1. Informations

Cours**Sigle** SBP1010**Titre** Éléments de chimie pour sciences biopharmaceutiques 1**Nombre de crédits** 3 crédits**Trimestre/Année** Automne 2015**Concomitant :** SBP1020**Responsable / Coordonnateur du cours****Nom** Anne-Marie Faucher**Titre** Chargée de cours**Courriel** anne-marie.faucher.2@umontreal.ca**Disponibilités** Avant et après les cours et sur rendez-vous**Coreponsable / Auxiliaire d'enseignement / autre personne ressource****Nom** Henri Piras**Titre** Auxiliaire d'enseignement**Courriel** henri.piras@umontreal.ca**Disponibilités** Sur rendez-vous

2. Description du cours

Ce cours comporte deux volets. Le premier vise à montrer comment la structure des molécules influence les propriétés des médicaments. À cette fin, plusieurs notions de chimie générale et organique seront révisées. Le deuxième volet vise à étudier plusieurs notions de chimie médicinale de sorte qu'à la fin du cours, les étudiants seront en mesure de comprendre un article de la littérature scientifique décrivant la découverte et le profil préclinique d'un médicament (ou d'un médicament en développement).

3. Objectifs généraux

Ce cours vise à l'introduction des étudiants à la chimie organique, bio organique et médicinale. Nous réviserons différentes notions de chimie organique appliquées plus spécifiquement aux molécules de médicament. Ensuite nous étudierons spécifiquement les molécules de médicament, leur origine, leur nomenclature spécifique, leurs cibles biologiques, leur activité biologique, leur métabolisme, leur découverte et optimisation, ainsi que les critères de sélection des médicaments.

4. Objectifs spécifiques

À la fin du cours l'étudiant sera capable de:

- Reconnaître les principales fonctions organiques.
- Connaître les types principaux d'interactions entre les molécules.
- Comprendre et d'anticiper les propriétés des molécules organiques (solubilité, réactivité, acides, bases, nucléophiles et électrophiles).
- Représenter les molécules organiques selon plusieurs méthodes (Structures de Lewis, structures abrégées 2D et 3D)
- Connaître les différents types d'isomérisie et d'être en mesure de classer les molécules organiques selon leurs types d'isomères. Connaître les concepts de configuration relative et absolue et les règles de Cahn-Ingold-Prélog pour leur détermination.
- Connaître les notions de pureté optique et de pouvoir rotatoire et les équations qui lient la pureté optique à la composition des mélanges d'énantiomères.
- Connaître les notions d'eutomères et de distomères et leur importance pharmaceutique.
- Connaître les réactions chimiques au niveau des déplacements électroniques et au niveau des fluctuations d'énergie qui les caractérisent. Connaître les mécanismes des réactions par classe et d'être en mesure de décrire le mouvement des électrons dans une réaction. Reconnaître les réactions importantes en milieu biologique et d'être en mesure de les décrire.
- Connaître les réactions de dégradation métabolique des médicaments en fonction de leur structure chimique. Comprendre les phénomènes d'interactions médicamenteuses.
- Connaître la composition des médicaments, leurs classes, leur nomenclature, leurs cibles potentielles la mesure de leur activité et de leur sélectivité biologique.
- Connaître les notions propres à la chimie médicinale comme la relation structure-activité, les pharmacophores, les bioisostères, et plusieurs aspects liés à la découverte des médicaments.
- Connaître les différentes origines des médicaments.
- Être en mesure de trouver les informations relatives aux médicaments dans la littérature scientifique.

5. Méthodes pédagogiques

Ce cours comprend trois volets :

Cours magistraux sous forme de diaporama et d'exercices

Séances de travaux dirigés de trois heures chacune supervisées par un(e) auxiliaire d'enseignement durant lesquelles les étudiants sont guidés dans la résolution de problèmes. La présence à ces séances est optionnelle.

Un atelier de recherche bibliographique de 2 heures en compagnie de Patrice Dupont (Bibliothécaire de référence, Bibliothèque de la santé). La présence à cet atelier est obligatoire puisque qu'elle constitue un pré requis pour la correction du Quiz 2 et du travail de recherche Bibliographique (chimie médicinale).

- **Diaporamas PDF de chaque chapitre disponibles en ligne sur StudiUM**

- **Lien:**

<https://studium.umontreal.ca>

6. Calendrier des activités d'apprentissage (Cours, labos et évaluation)

MDY : Pav. Marguerite D'Youville

Date	De	À	Sujet	Local	Responsable
01-09-2015	8h30	11:30	Chapitre 1	S1-111	Anne-Marie Faucher
08-09-2015	8h30	11:30	Chapitre 1	S1-111	Anne-Marie Faucher
10-09-2015	13:00	16:00	Travaux dirigés - Ch 1	S1-111	Henri Piras
14-09-2015	13:00	16:00	Chapitre 2	S1-111	Anne-Marie Faucher
21-09-2015	13:00	16:00	Chapitre 2	S1-111	Anne-Marie Faucher
28-09-2015	13:00	16:00	Chapitre 3	S1-111	Anne-Marie Faucher
01-10-2015	13:00	16:00	Travaux dirigés - Ch 2-3	S1-111	Henri Piras
05-10-2015	13:00	16:00	Chapitre 3 et 4	S1-111	Anne-Marie Faucher
13-10-2015	13:00	16:00	Chapitre 4	S1-111	Anne-Marie Faucher
15-10-2015	13:00	16:00	Travaux dirigés - Ch 4	S1-111	Henri Piras
26-10-2015	13:00	16:00	Examen intra (1-4)	2010 (MDY)	Anne-Marie Faucher
02-11-2015	13:00	16:00	Chapitre 5 et présentation recherche	S1-111	Anne-Marie Faucher
05-11-2015	13:00	15:00	Atelier – Recherche Bibliographique – Groupe A	Bibliothèque santé – salle L-868	Patrice Dupont Frédéric Séguin
05-11-2015	15:30	17:30	Atelier – Recherche Bibliographique – Groupe B	Bibliothèque santé – salle L-868	Patrice Dupont Nancy Primeau
09-11-2015	13:00	16:00	Chapitre 5 et 6	S1-111	Anne-Marie Faucher
16-11-2015	13:00	16:00	Chapitre 6 et 7	S1-111	Anne-Marie Faucher
19-11-2015	13:00	16:00	Travaux dirigés – Ch 5-6	S1-111	Henri Piras
23-11-2015	13:00	16:00	Chapitre 7	S1-111	Anne-Marie Faucher
30-11-2015	13:00	16:00	Chapitre 8	S1-111	Anne-Marie Faucher
03-12-2015	13:00	16:00	Travaux dirigés – Ch 7-8	S1-111	Henri Piras
07-12-2015	13:00	16:00	Chapitre 8 Révision	S1-111	Anne-Marie Faucher
14-12-2015	13:00	16:00	Examen final (1-8)	S1-151	Anne-Marie Faucher

7. Contenu des cours

Chapitre 1 : Propriétés des molécules

- Liaisons chimiques et polarité
- Résonnance et aromaticité
- Interactions non-covalentes
- Fonctions chimiques et leurs propriétés
- Les acides et les bases

Chapitre 2 : Isomérisation et stéréochimie

- Isomérisation
- Stéréoisomérisation
- Configuration absolue
- Relation entre les stéréoisomères
- Pouvoir rotatoire et pureté optique
- Mélanges racémiques et leur résolution
- Stéréoisomérisation et médicaments

Chapitre 3 : Acides carboxyliques, amines et hétérocycles

- Acides carboxyliques - noms, structures et propriétés
- Acides carboxyliques - comportement en milieu physiologique
- Amines et hétérocycles - noms, structures et propriétés
- Amines et hétérocycles - comportement en milieu physiologique
- Hétérocycles d'importance en biologie

Chapitre 4 : Les réactions

- Représentation des mécanismes réactionnels
- Types de réactions
- Énergie des réactions
- Diagrammes d'énergie
- Intermédiaires réactionnels
- Réactions en laboratoire vs en milieu biologique
- Réactions chimiques importantes en milieu biologique

Chapitre 5 : Biotransformations des médicaments

- Pharmacocinétique - ADME
- Biotransformations
 - Phase 1
 - Phase 2
- Prodrogues
- Interactions médicamenteuses

Chapitre 6 : Les médicaments

- Définition
- Composition des médicaments
- Nomenclature des médicaments (OMS -DCI)
- Cibles et modes d'action
- Activité des ingrédients actifs
- Sélectivité des ingrédients actifs

Chapitre 7 : Découverte du médicament et chimie médicinale

- Phases de R&D
- Indication thérapeutique et profil clinique
- Identification de la cible moléculaire
- Identification et optimisation des chimiotypes têtes de série
 - Relation structure-activité, pharmacophore et bioisostérie
 - Propriétés physicochimiques
 - Propriétés biopharmaceutiques
- Identification des candidats au développement

Chapitre 8 : Autres origines des médicaments

- Sources de la découverte du médicament
 - Métabolites secondaires et produits naturels
 - Classes structurales et exemples
 - Approche rationnelle
-

8. Ressources

Ouvrage de référence

- **McMurry, J.** (2015). *Organic chemistry with biological Applications* 3e. Belmont, CA: Thomson Brooks/Cole. (ISBN 128584291-X).
- **Zanders, Edward D.** (2011). *The Science and Business of Drug Discovery, Demystifying the Jargon*, Springer, ISBN: 978-1-4419-9901-6 (Print) 978-1-4419-9902-3 (Online) <http://link.springer.com/book/10.1007/978-1-4419-9902-3/page/1>

Matériel complémentaire

- **Modèles moléculaires (ceux-ci sont permis aux examens)**
- **Girouard, Lapierre, Marrano**, Chimie organique 1, 2013, Chenelière Éducation. (ISBN 978-2-7650-3356-1) (pour la révision des notions de chimie organique 1 niveau collégial)
- **Hart, Craine, Hart, Hadad**, Chimie organique 1, 2008, Chenelière Éducation. (ISBN 978-2-7650-1519-2) (pour la révision des notions de chimie organique 1 niveau collégial)

Matériel en réserve à la bibliothèque de santé

- **Foye, Lemke, Williams**, Foye's Principle of Medicinal Chemistry, 2013, 7^e ed., Wolters Kluwer Health/Lippincott Williams & Wilkins . (ISBN 1451175728)

9. Évaluation

Seuil acceptable de performance (SAP) : 50 %

Objets d'évaluation	Technique (s) d'évaluation *	Ouvrage de référence	Pondération	Date d'évaluation jj/mm/aa	Durée de l'évaluation
Chap. 1 à 4	1 – 2 – 3	Interdits	35%	26-10-2015	3 Hre(s)
Chap. 1 à 8	1 – 2 – 3	Interdits	35%	14-12-2015	3 Hre(s)
Chap. 1 à 3	Quiz maison 1- StudiUM	Permis	5%	05-10-2015 (19- 23h59)	45 min
Présence à l'atelier Recherche Bibliographique	4	S.O.	Prérequis pour correction Quiz 2 et Travail	05-11-2015	2 Hre(s)
Recherche Bibliographique (bibliographie)	Quiz maison 2- StudiUM	Permis	5%	19-11-2015 (19- 23h59)	45 min
Travail de recherche Bibliographique (chimie médicinale)	18	Permis	20%	14-12-2015	S.O.

*

1. QCM (Questions à choix multiple)	10. Examen oral
2. QROC (Questions à réponse ouverte courte)	11. Jeu de rôles
3. QDC (Question à développement court)	12. Journal de bord
4. Observation directe	13. Mises en situation
5. Autoévaluation	14. Présentation express (3 min.)
6. Cartographie des connaissances	15. Présentation faite par l'apprenant
7. Débat/Panel	16. Question à développement
8. ÉCOS	17. Séance d'affichage
9. Évaluation par les pairs	18. Travail écrit

10. Particularités de l'évaluation

Absence non motivée : La note F* (échec par absence) est attribuée à l'étudiant qui ne se présente pas à une évaluation, à moins qu'il ne justifie valablement son absence auprès du doyen ou de l'autorité compétente.

Absence prévisible à une activité d'évaluation :

L'étudiant doit motiver une absence prévisible à une activité d'évaluation dès qu'il est en mesure de constater qu'il ne pourra être présent; il appartiendra à l'autorité compétente de déterminer si le motif est acceptable.

Remise en retard de travaux :

Lorsque l'étudiant omet de remettre un travail dans les délais prescrits, le doyen ou l'autorité compétente peut fixer un nouveau délai et requérir que la correction du travail soit alors faite en tenant compte du retard.

Évaluation continue des compétences transversales

Les compétences transversales sont évaluées à plusieurs moments tout au long du programme.

11. Règlement disciplinaire sur le plagiat ou la fraude concernant les étudiants

(Extrait de l'Annuaire général, Tome 1, Études de premier cycle. Université de Montréal, p. XXVI)

« Tout plagiat, copiage ou fraude, ou toute tentative de commettre ces actes, ou toute participation à ces actes, à l'occasion d'un examen ou d'un travail faisant l'objet d'une évaluation, d'un mémoire ou d'une thèse, constitue une infraction au sens du présent règlement et est passible de sanctions disciplinaires ». L'étudiant doit prendre connaissance de l'ensemble du règlement disciplinaire sur le plagiat ou la fraude

À noter : Tout enregistrement (audio ou vidéo) d'un cours ainsi que sa diffusion sont strictement interdits sans l'approbation du professeur.