

# pharmachine

Chimie thérapeutique partie 1

# I- Définitions

Chimie thérapeutique :

= pharmacochimie. La chimie thérapeutique est une discipline qui étudie la conception et la synthèse de molécules avec pour objectif final un moyen thérapeutique.

La chimie thérapeutique est un domaine **pluridisciplinaire**



Maladie:

Altération de l'équilibre biologique interne d'un être vivant

Médicaments:

Substance ou composition qui a des propriétés préventives ou curatives. Les médicaments servent à la fois pour les humains et pour les animaux.





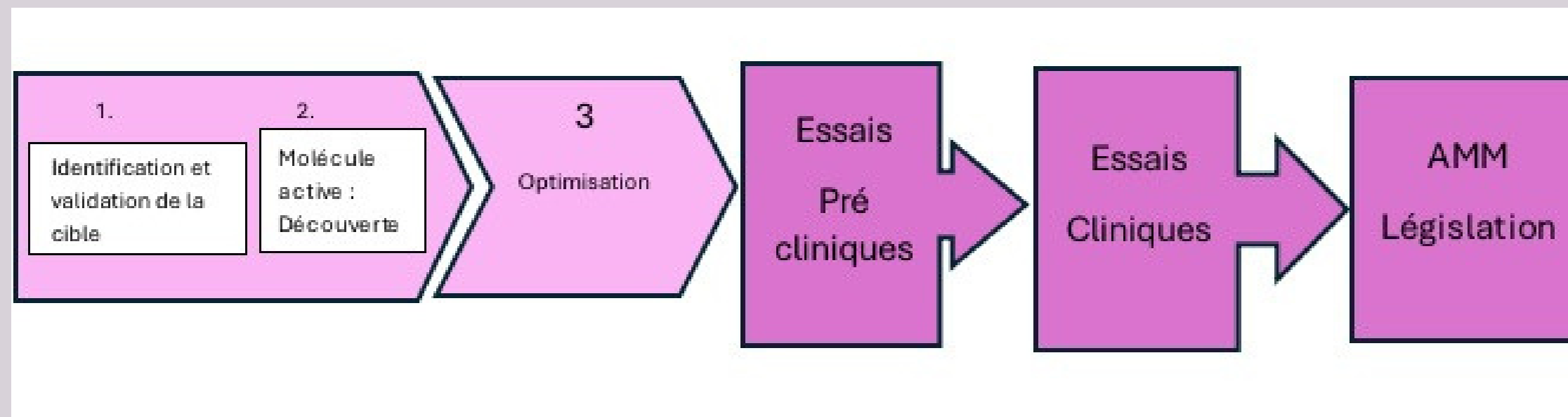
## II- conception du médicament: aspects chimiques

### 1) identification de la cible

cette étapes englobe un large éventail d'activités scientifiques axées sur l'identification de nouvelles cibles, qu'elles soient cellulaire ou moléculaires et la confirmation et leur rôles dans la maladie.'

Pour l'identification et la validation de la cible il faut:

- quantifier la modulation de l'activité de la cible
- capaciter de se lier à une petite molécule
- capacité de moduler l'activité de la cible "druggable"
- cible doit être clonable



- Les étapes 1 et 2 sont concomitantes
- les étapes 1,2,3 font partie de la conception du mdc

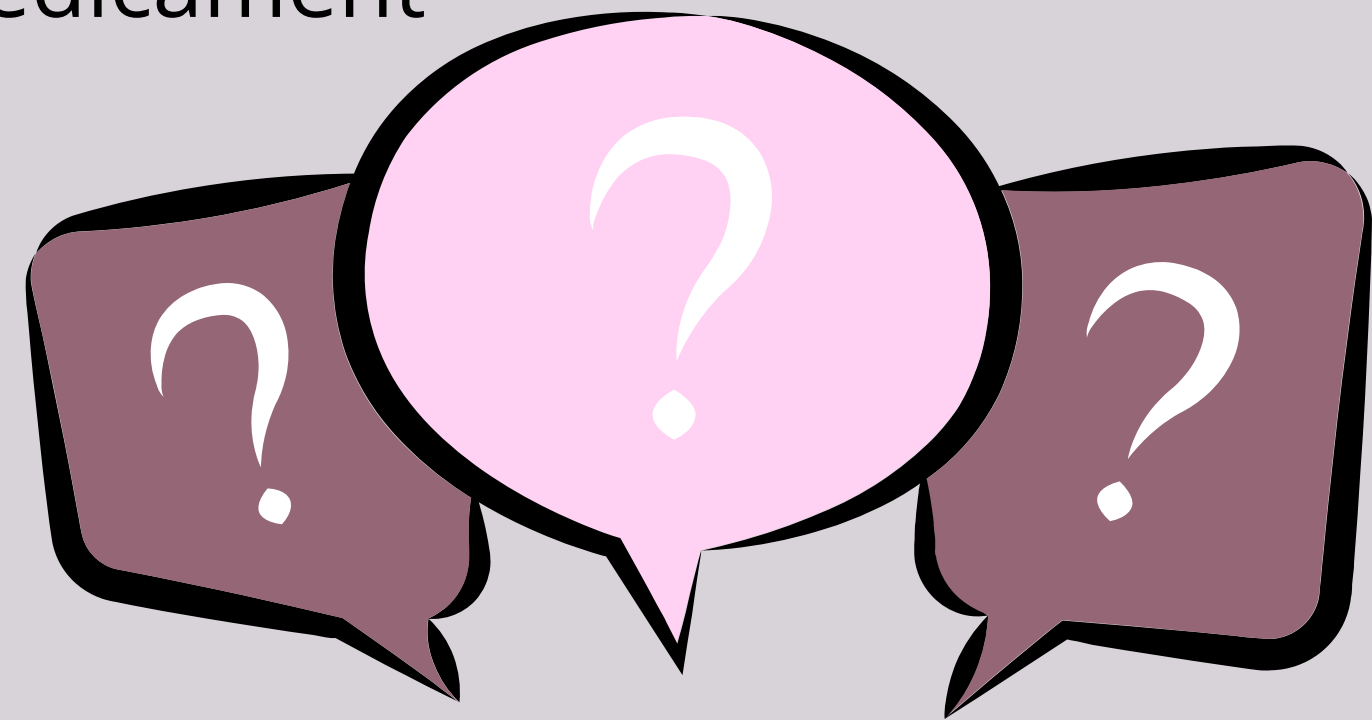
恭賀財





# QCM-1)

- A) lors de la conception du médicaments les étapes 2 et 3 sont concomitantes
- B) La chimie analytique est un domaine pluridisciplinaire
- C) Une cible thérapeutique peut être une structure cellulaire ou moléculaire
- D) la demande d'AMM fait partie de la conception du médicament
- E) chimie thérapeutique = pharmacochimie



# QCM-1)

A) lors de la conception du médicaments les étapes 2 et 3 sont concomitantes  
*1 et 2*

B) La chimie analytique est un domaine pluridisciplinaire  
*thérapeutique*

C) Une cible thérapeutique peut être une structure cellulaire ou moléculaire

D) la demande d'AMM fait partie de la conception du médicament  
*NON*

E) chimie thérapeutique = pharmacochimie



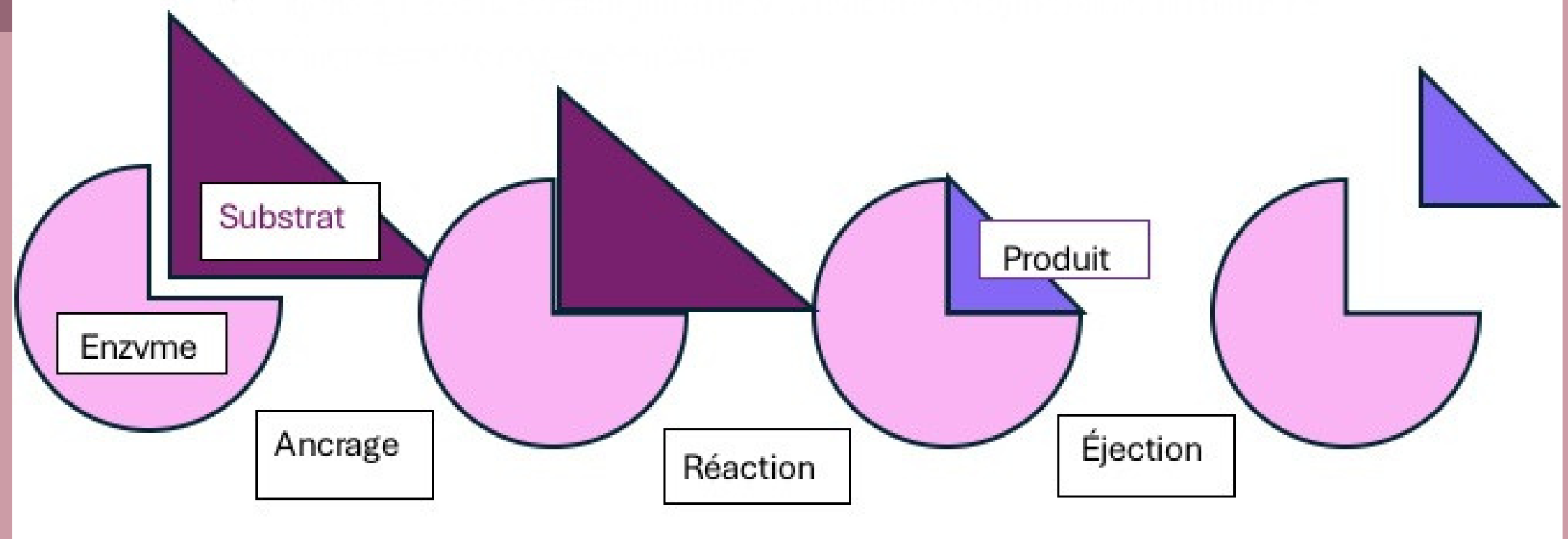
## 2) interactions entre un médicament et sa cible

### Objectif de l'étude

- création d'interactions plus sélectives
- augmentation de l'activité pharmacologiques
- diminution des effets secondaires

Les ENZYMES  
= catalyseur de la vie  
sans enzymes on n'a pas de réactions chimiques dans l'organismes

- augmentation de la vitesse des réactions chimiques
- régénération
- affaiblissement des liaisons chimiques réversible
- complémentarité enzyme - substrat



# Les récepteurs

Def : macromolécules protéique qui interagissent avec la partie chimique du ligand . Ils permettent aux systèmes de communiquer entre eux

Caractéristiques des récepteurs:

- membranaires ou endoplasmiques
- isolement difficile
- étude in vivo, ex vivo, in vitro
- structure tridimensionnelle dépend de leur environnement cellulaire



Au niveau moléculaire les interactions ligand-récepteur se divisent en 3 étapes:

- 1- reconnaissance
- 2- transduction
- 3- amplification



# QCM-2)

- A) les enzymes sont des catalyseur de la vie
- B) le processus enzymatique est irréversible, c'est pour cela qu'on a beaucoup d'enzyme dans l'organisme
- C) les récepteurs sont membranaires ou nucléaires
- D) les interactions ligand-récepteurs se divisent en 3 étapes: reconnaissance , transduction et amplification
- E) pas du tout !!! c'est reconnaissance, transduction et recombinaison

# QCM-2)

A) les enzymes sont des catalyseur de la vie

B) le processus enzymatique est irréversible, c'est pour cela qu'on a beaucoup d'enzyme dans  
Faux l'organisme

C) les récepteurs sont membranaires ou nucléaires  
endoplasmique

D) les interactions ligand-récepteurs se divisent en 3 étapes: reconnaissance ,  
transduction et amplification

E) pas du tout !!! c'est reconnaissance, transduction et recombinaison  
amplification

# Les ligands

Les caractéristiques d'un ligand :

| Affinité du ligand   | Activité intrinsèque   | Activité thérapeutique  |
|--|--|---|
| Aptitude du ligand à se fixer à sa cible   | Correspond aux agonistes, antagonistes ou mixtes   | Elle est différente de l'activité intrinsèque   |
| Elle est due aux propriétés géométriques et électroniques du ligand  | C'est l'activité pharmacologique mesurée directement sur la cible                                      | C'est l'activité qu'on mesure in vivo sur l'ensemble de l'organisme                         |
| Lorsqu'on va vouloir développer la substance médicamenteuse, c'est sur ces propriétés qu'on se focalisera pour comprendre la relation structure-affinité | Elle dépend des propriétés physico-chimiques du ligand. Stimule ou inhibe les processus physiologiques | Elle est la résultante de toutes les infractions avec les différentes cibles de l'organisme |

Les cibles protéiques sont les cibles thérapeutiques les plus étudiées. L'interaction ligand-cible est un phénomène dynamique.

**complémentarité et modification confirmationnelle**

Les cibles biologiques (comme les protéines) sont des édifices polyatomiques complexes qui prennent forme grâce aux :

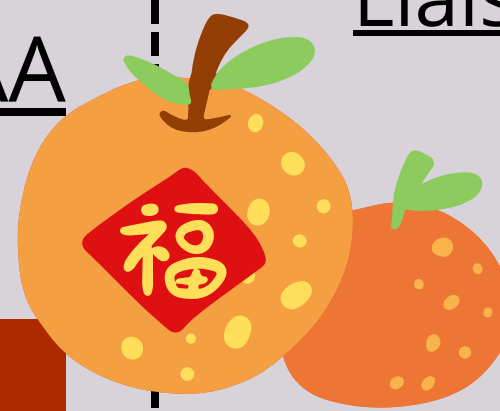
- Liaisons covalentes interatomiques
- Liaisons faibles (interactions électrostatiques)





## Les liaisons covalentes et AA

## Liaisons peptidiques et structures primaire des protéines



**AA synthétisés par l'organisme:** Alanine, Arginine, Asparagine, Acide aspartique, Acide glutamique, Glutamine, Cystéine, Glycine, Proline, Sérine, Tyrosine

**AA essentiels:** Leucine, Isoleucine, Thréonine, Lysine, Tryptophane, Phénylalanine, Valine, Méthionine, Histidine

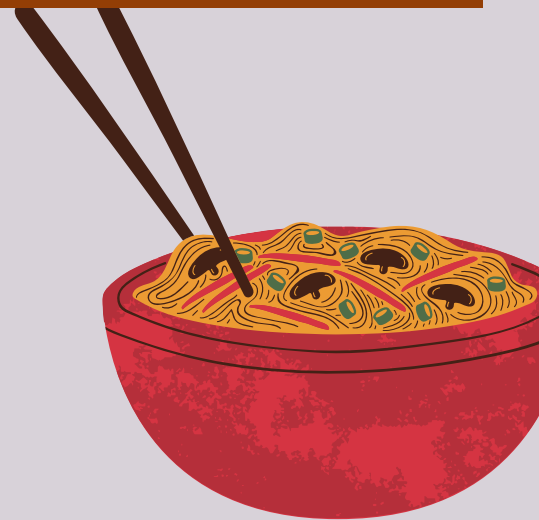
Avec l'enchaînement des AA grâce aux liaisons peptidiques, on obtient la structure primaire de la protéine. Elle est constituée d'une épine dorsale peptidique, avec de part et d'autre de cette dernière des chaînes latérales R. La liaison peptidique constitue l'épine dorsale avec les AA, avec autour les résidus, ou chaînes latérales de ces même AA.

La liaison peptidique se met en place entre 2 AA au niveau de :

- la fonction carboxylique d'un AA
- la fonction amine d'un autre AA

On aura alors un enchaînement d'AAs qui sera la résultante de cette réaction. **Une liaison peptidique est une fonction AMIDE PRIMAIRE, c'est elle qui structure toute la protéine.**

Attention je vous rappelle AMIDE  $\neq$  AMINE



# Structure secondaire des protéines et liaisons faible

Les liaisons faibles électrostatiques permettent à la protéine d'acquérir sa structure secondaire. Ce sont des liaisons hydrogènes entre les fonctions peptidique. On en retrouve deux types, les hélices alpha et les feuillet bêta



## Structure tertiaire: liaison entre les chaînes latérales

Elle résulte de l'interaction par des liaisons hydrogène entre les chaînes latérales des AA, en différents points de la structure secondaire.

- La structure tertiaire est la structure fonctionnelle, finale. Il faut connaître la structure tertiaire pour agir la plus efficacement sur la cible.



八月十五

## Structure quaternaire

Association de deux ou plusieurs structures tertiaires pour former la structure quaternaire de la cible.

# QCM-3)

- A) l'affinité du ligand c'est l'aptitude du ligand à se fixer à sa cible
- B) l'activité intrinsèque dépend des propriétés physico-chimiques du ligand
- C) Une liaison peptidique est une fonction amine primaire , c'est elle qui structure toute la protéine.
- D) Il n'est pas nécessaire de connaître la structure tertiaire d'une protéine pour agir plus efficacement sur la cible car on peut directement le voir avec la modulation.
- E) On retrouve deux types de structures tertiaires, les hélices alpha et les feuillet bêta



# QCM-3)



- A) l'affinité du ligand c'est l'aptitude du ligand à se fixer à sa cible
- B) l'activité intrinsèque dépend des propriétés physico-chimiques du ligand
- C) Une liaison peptidique est une fonction amine primaire , c'est elle qui structure toute la protéine.
- D) Il n'est pas nécessaire de connaître la structure tertiaire d'une protéine pour agir plus efficacement sur la cible car on peut directement le voir avec la modulation.
- E) On retrouve deux types de structures tertiaires, les hélices alpha et les feuillet bêta

# QCM-4)

A propos de l'identification et la validation de la cible, indiquez la ou les réponses exactes:

- A) l'identification et la validation de la cible n'est pas concomitante à la découverte de la molécule active
- B) le caractère "druggable" d'une cible correspond à la quantification de la modulation de son activité
- C) la cible peut s'analyser sans être nécessairement clonable
- D) la cible doit avoir la capacité de se fixer à la petite molécule
- E) les propositions A,B,C et D sont fausses

# QCM-4)

A propos de l'identification et la validation de la cible, indiquez la ou les réponses exactes:

- A) l'identification et la validation de la cible n'est pas concomitante à la découverte de la molécule active
- B) le caractère "druggable" d'une cible correspond à la quantification de la modulation de son activité
- C) la cible peut s'analyser sans être nécessairement clonable
- D) la cible doit avoir la capacité de se fixer à la petite molécule
- E) les propositions A,B,C et D sont fausses

# QCM-5)



- A) Il existe le métabolisme primaire, secondaire et tertiaire
- B) le métabolisme primaire intervient uniquement dans la croissance et la reproduction
- C) le métabolisme secondaire est plus général, il est présent à la fois qu'en les végétaux mais aussi les animaux
- D) le métabolisme tertiaire est dit non essentiels
- E) les propositions A, B, C et D sont fausses

# QCM-5)

A propos des métabolismes des végétaux:

- A) Il existe le métabolisme primaire, secondaire et tertiaire
- B) le métabolisme primaire intervient uniquement dans la croissance et la reproduction
- C) le métabolisme secondaire est plus général, il est présent à la fois qu'en les végétaux mais aussi les animaux
- D) le métabolisme tertiaire est dit non essentiels
- E) les propositions A, B, C et D sont fausses

# QCM-6)

A propos de l'aromathérapie:

- A) principe basée sur l'usage d'huile essentielles
- B) l'aromathérapie est utilisée dans divers domaines et à été inventé par René Gatefossé
- C) les huile essentielles sont toxiques à forte dose
- D) les terpènes sont les principaux constituant des huiles essentielles
- E) les propositions A, B, C et D sont fausses

# QCM-6)

A propos de l'aromathérapie:

- A) principe basée sur l'usage d'huile essentielles
- B) l'aromathérapie est utilisée dans divers domaines et à été inventé par René Gatefossé
- C) les huile essentielles sont toxiques à forte dose
- D) les terpènes sont les principaux constituant des huiles essentielles
- E) les propositions A, B, C et D sont fausses

# Fin

**P1 EN DÉTRESSE APRÈS LE S1**

**LA PHARMA QUI MÉLANGE  
LA BIOCH ET LA CHIMIE**

**MAIS C'EST OK ON VA VOUS AIDER**

**NOUS QUI ESSAYONS DE  
TROUVER PLEINS DE MÉMOS ...**

**VOUS QUI FAITES PAS LA DIFFÉRENCE ENTRE  
AROMATHÉRAPIE, PHYTOTHÉRAPIE, HOMÉOPATHIE ET ALLOPATHIE**

