MOLECULES BIOACTIVES ET CHIMIE MEDICINALE

B2MC / EA 4446

UNE EQUIPE DEDIEE AU « DRUG DESIGN » ET OPTIMISATION D'AGENTS BIOACTIFS

L'objectif du Laboratoire Molécules Bioactives et Chimie Médicinale (B2MC) est le développement de projets de recherche dédiés aux agents anti-infectieux, molécules antitumorales et sondes moléculaires / composés pour lutter contre la chimiorésistance (conception de médicaments basée sur un ligand ; synthèse et optimisation structurale).

> *Exemple 1 :* Inhibiteurs de la protéine kinase CK2. Différentes stratégies de design (e.g. ATP-compétitif, modulation allostérique, interaction protéine-protéine) sont développées avec différents châssis moléculaires (e.g. indenoindoles, aminothiazoles).

> *Exemple 2 :* Inhibiteurs de pompes d'efflux. Utilisation de la diversité structurale pour explorer Pg-p, BCRP et MRP-1.

> *Exemple 3 :* Exploration de la résistance multi-drogues chez les bactéries. Dérivés de cinnamide et agents chélateurs du zinc sont conçus et synthétisés afin de les combiner à des antibiotiques.

CONTACT

Marc LE BORGNE

Faculté de Pharmacie - ISPB Escalier D
2ème étage
8, Avenue Rockefeller
69373 Lyon Cedex 08
+33 (0)4 78 77 75 42
marc.le-borgne@univ-lyon1.fr
http://b2mc.univ-lyon1.fr

LE B2MC EN UN COUP D'OEIL

THEMATIQUES

> Agents anticancéreux
> Agents anti-infectieux
> Inhibiteurs de kinases
> Inhibiteurs de pompes d'efflux
> Études de stabilité d'IPAs

MOTS CLES

> Conception de médicaments basée sur un ligand
> Synthèse chimique
> Méthodologie de synthèse
> Synthèse hétérocyclique
> Châssis moléculaire stéroïdien
> Analyse des relations structure-activité
> Optimisation structurale (PD, PC)
> Stabilité d'IPAs
> Séparation chirale par CLHP

DOMAINES D'APPLICATION

> Découverte d'agents bioactifs
> « Drug Design »
> Chimie thérapeutique / médicinale
> Chimie bioorganique
> Chiralité des molécules bioactives
> Petites molécules

BIOACTIVE MOLECULES AND MEDICINAL CHEMISTRY

B2MC / EA 4446

A TEAM DEDICATED TO DRUG DESIGN AND HITS OPTIMIZATION

The B2MC laboratory studies development of research projects (ligand-based drug design, synthesis and structural optimization projects) dedicated to anti-infectious agents, anticancer drugs and molecular probes/compounds to fight chemoresistances.

> *Example 1:* Protein Kinase CK2 inhibitors. Different design strategies (e.g. ATP-competitive, allosteric modulation, protein-protein interaction) are developing with different scaffolds (e.g. indenoindoles, aminothiazoles).

> *Example 2:* Inhibitors of efflux pumps. Using structural diversity to explore Pg-p, BCRP and MRP-1.

> *Example 3:* Exploring MDR in bacteria. Cinnamide derivatives and zinc-chelating agents are designed and synthesized to be combined with antibiotics

THE B2MC LAB AT A GLANCE

TOPICS

> Anticancer drugs
> Anti-infectious agents
> Kinase inhibitors
> Efflux pump inhibitors
> Stability studies of APIs

KEYWORDS

> Ligand-Based Drug Design (LBDD)
> Chemical synthesis
> Synthetic methodology
> Heterocyclic synthesis
> Steroidal scaffold
> SAR analysis
> Structural optimization (PD, PK)
> Stability of APIs
> Chiral separation by HPLC

SPECIFIC FIELDS OF APPLICATION

> Drug Discovery
> Drug Design
> Medicinal chemistry
> Bioorganic chemistry
> Chirality of bioactive molecules
> Small molecules

CONTACT

Marc LE BORGNE

Faculté de Pharmacie - ISPB Escalier D
2ème étage
8, Avenue Rockefeller
69373 Lyon Cedex 08
+33 (0)4 78 77 75 42
marc.le-borgne@univ-lyon1.fr
http://b2mc.univ-lyon1.fr