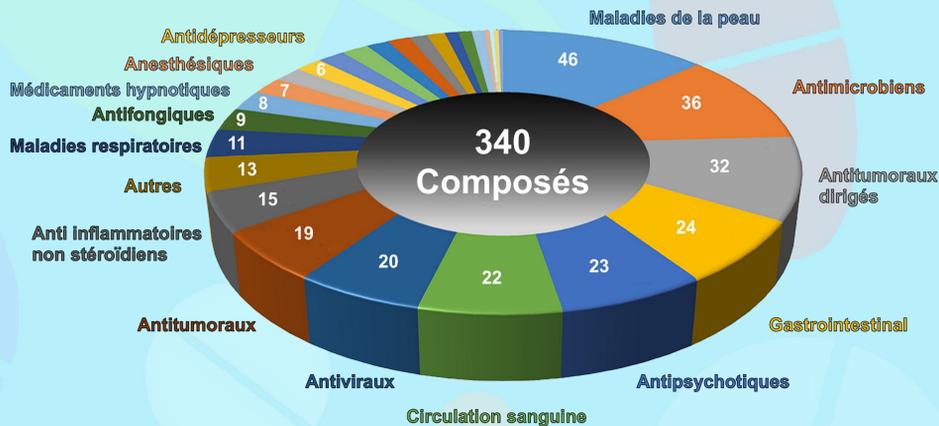




L'atome de fluor est très présent dans les médicaments ... et pas que dans le dentifrice

- ✓ 340 composés pharmaceutiques avec au moins un atome de fluor
- ✓ Environ 20% des médicaments
- ✓ Présent dans tous les domaines thérapeutiques
- ✓ Pourcentage en forte progression

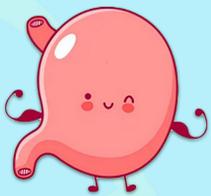


ACS Omega 2020, 5, 10633

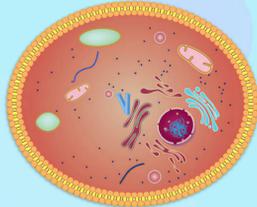


Pour quelles raisons ?

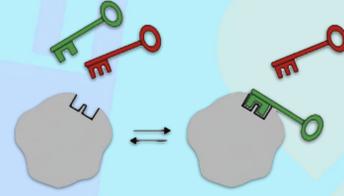
- ✓ Protection contre le métabolisme
- ✓ Amélioration du transport de la molécule vers la cible
- ✓ Forte modification de la reconnaissance avec la cible



→ En raison de la force de la liaison carbone-fluor très difficile à casser : plus longue durée de vie du médicament dans le corps

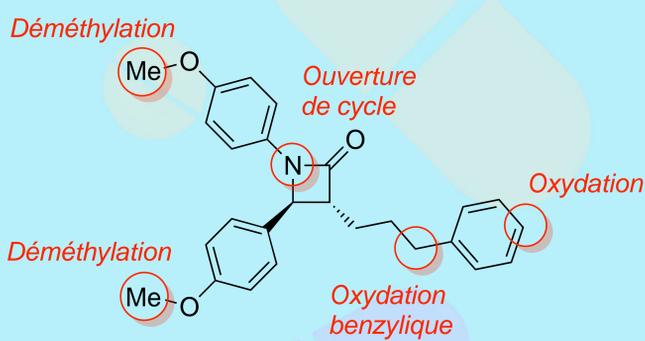


→ En raison de l'augmentation de la lipophilie (attirance pour les huiles) ce qui permet de franchir plus facilement la paroi cellulaire



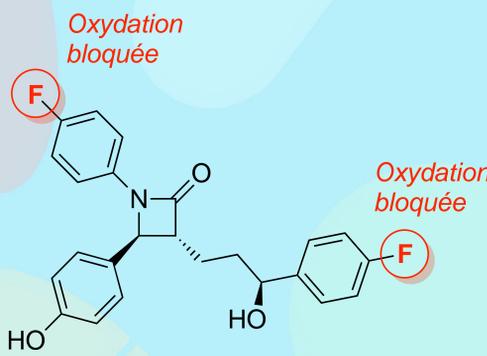
→ En raison de profonds changements de conformation (forme de la molécule), de propriétés physico-chimiques (acidité, basicité) entre la molécule fluorée et son analogue non fluoré

Un exemple



SCH 48461

Inhibiteur modéré de l'absorption du cholestérol (ED₅₀ = 2,2 mg/kg/jour)



Ezetimibe (SCH 58235)

50 fois plus efficace que SCH 48461 (ED₅₀ = 0,4 mg/kg/jour)

J. Med. Chem. 1998, 41, 973

Quelques médicaments fluorés parmi les plus vendus ou les plus importants

