

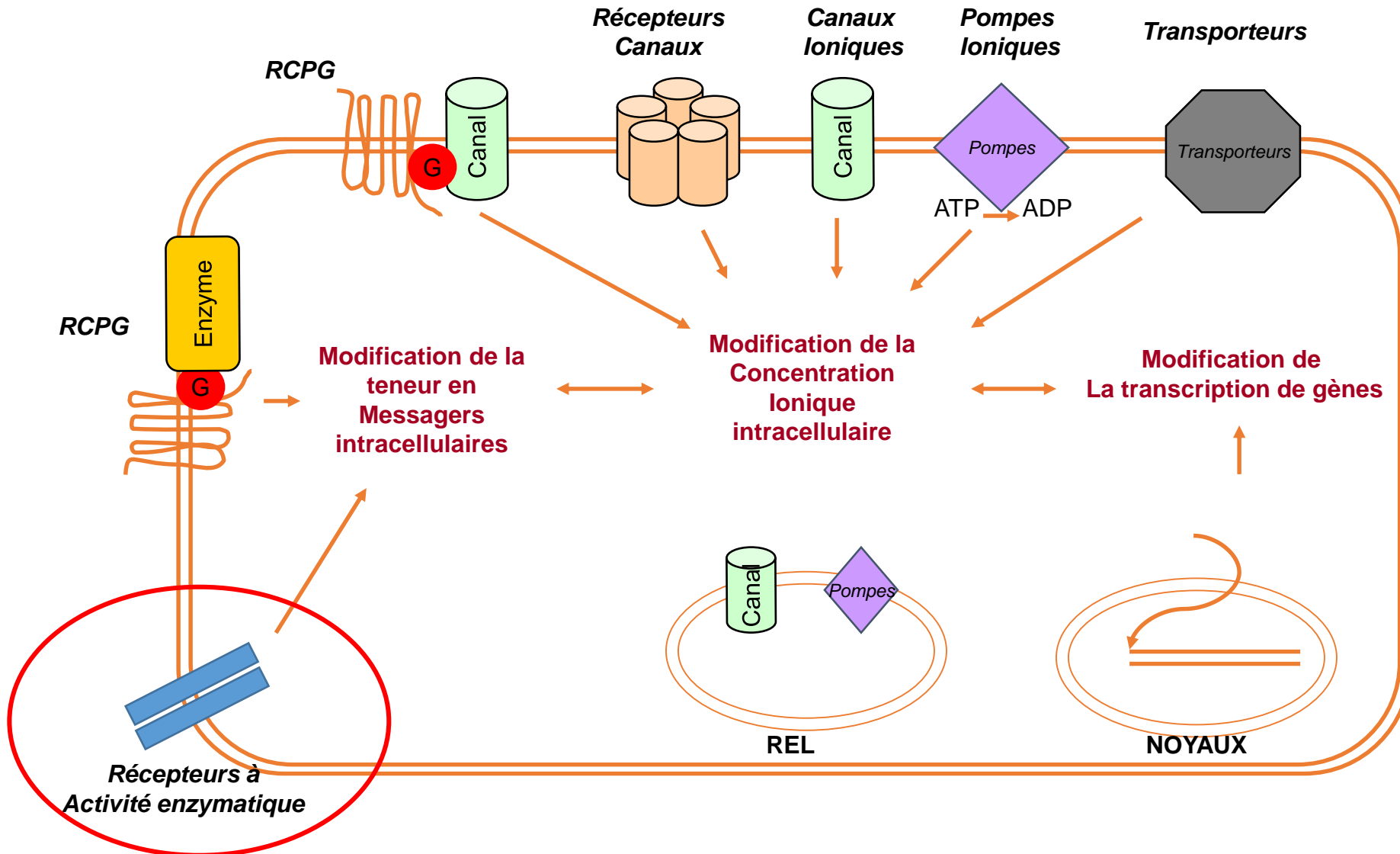
# Les récepteurs à activité enzymatique

Pr JM Senard

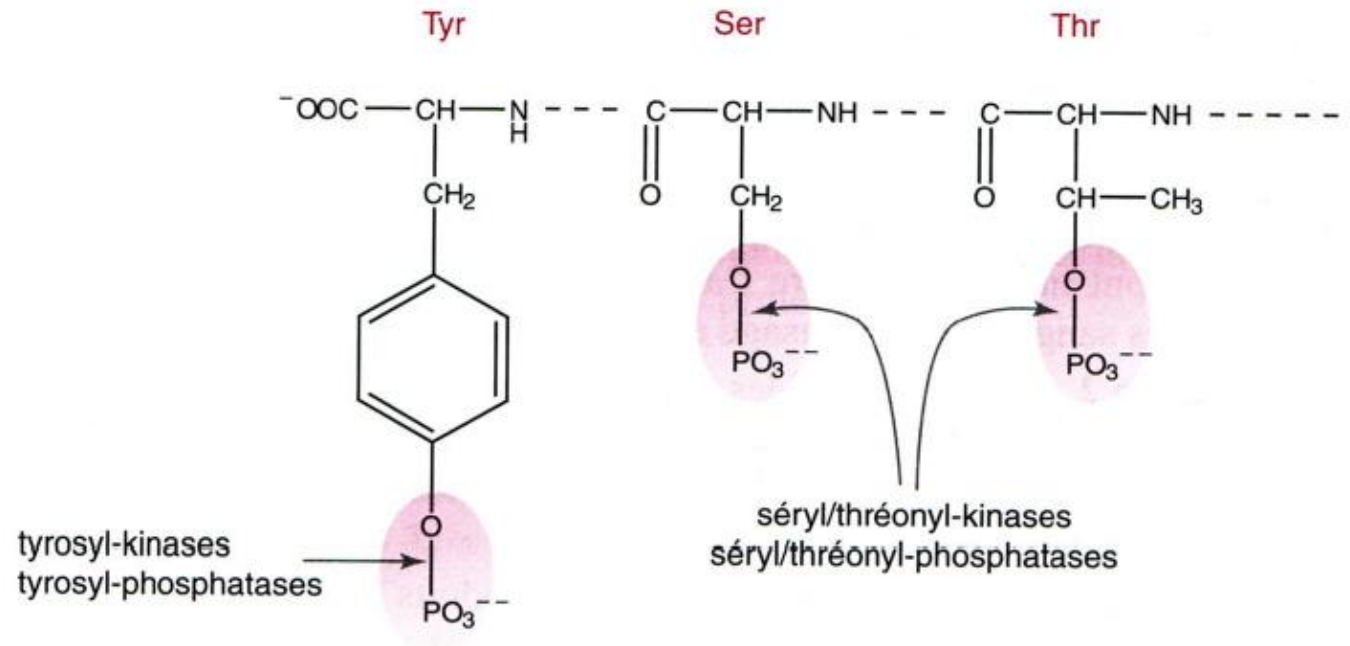
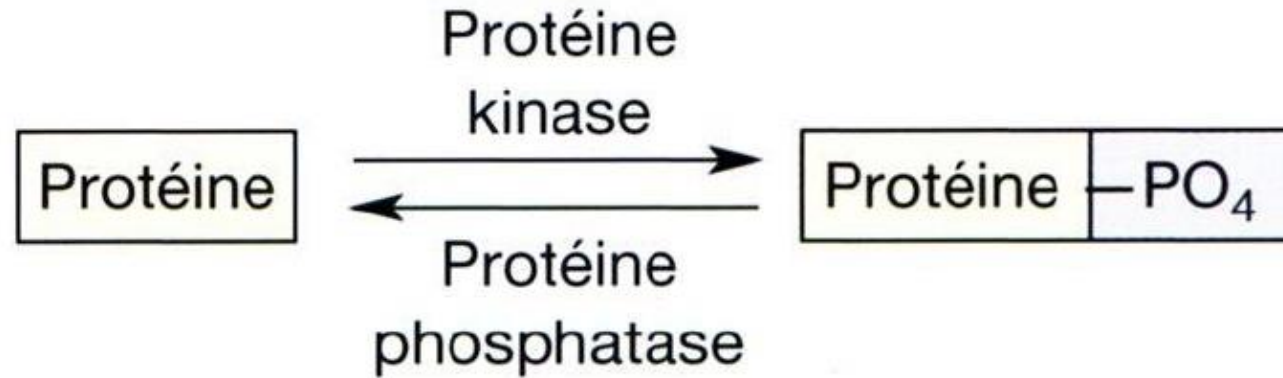


# Les cibles spécifiques des médicaments

## Cibles membranaires



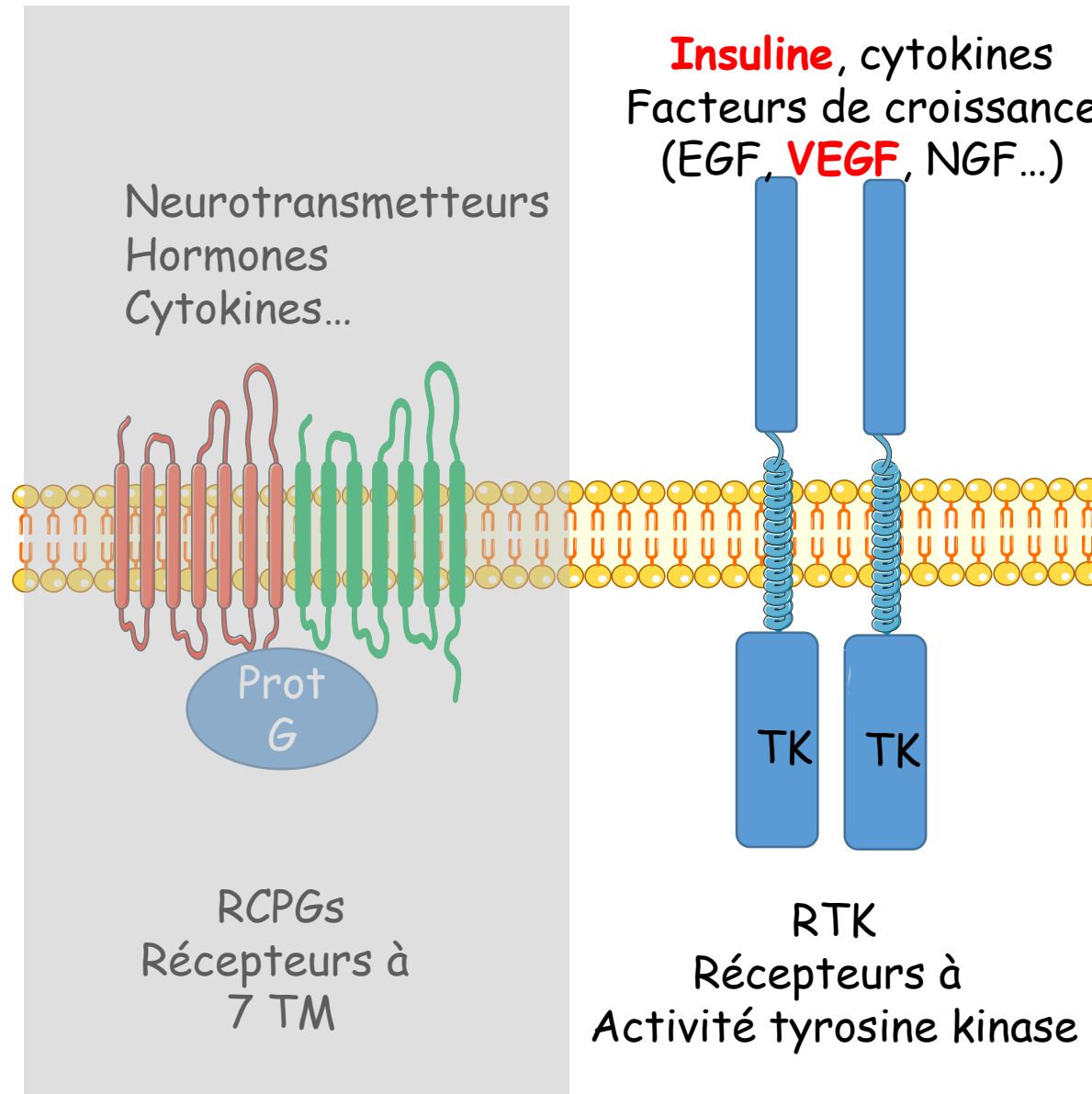
# Les récepteurs à activité enzymatique



# Les récepteurs à activité enzymatique

- **Les récepteurs à activité tyrosine kinase**
  - Structure générale
  - Le récepteur de l'insuline
  - Le récepteur du VEGF
  - Le récepteur Erb2
  - Les récepteurs à activité tyrosine kinase cytosolique
- Les récepteurs à activité séryl-thréonine kinase
- Les récepteurs à activité guanylyl cyclase

# Les récepteurs à activité tyrosine kinase



De nombreuses fonctions

Développement,

Prolifération,

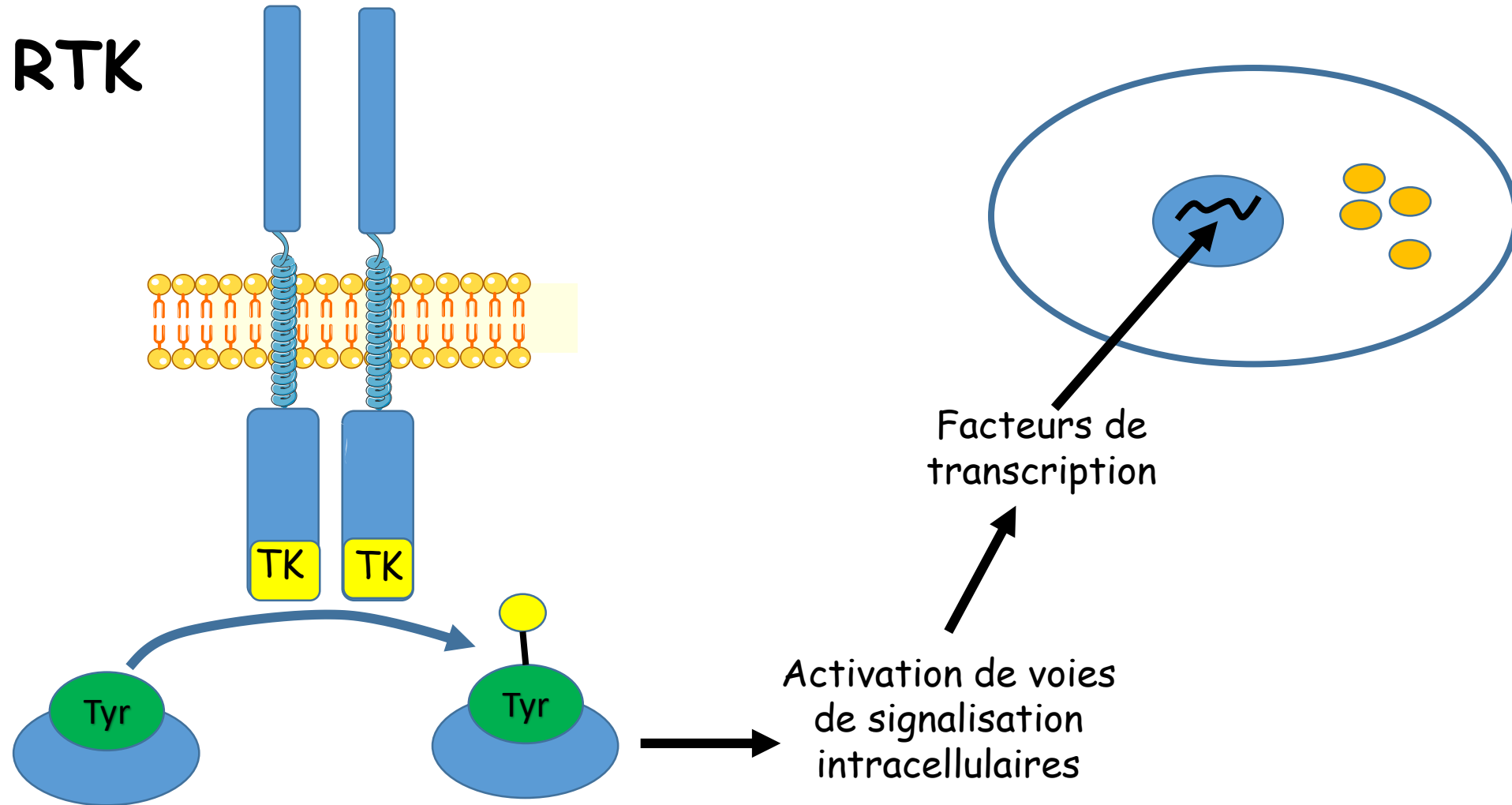
Différenciation cellulaire

Cycle cellulaire

Métabolisme

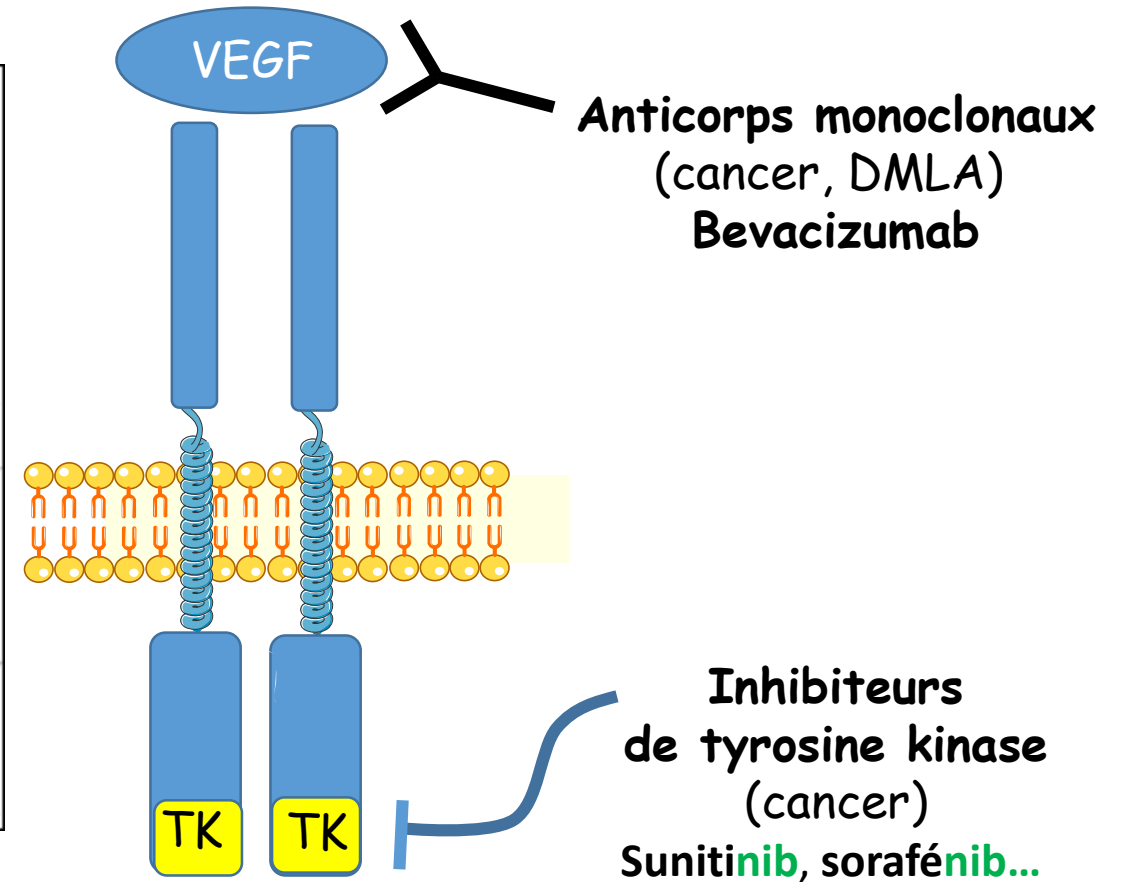
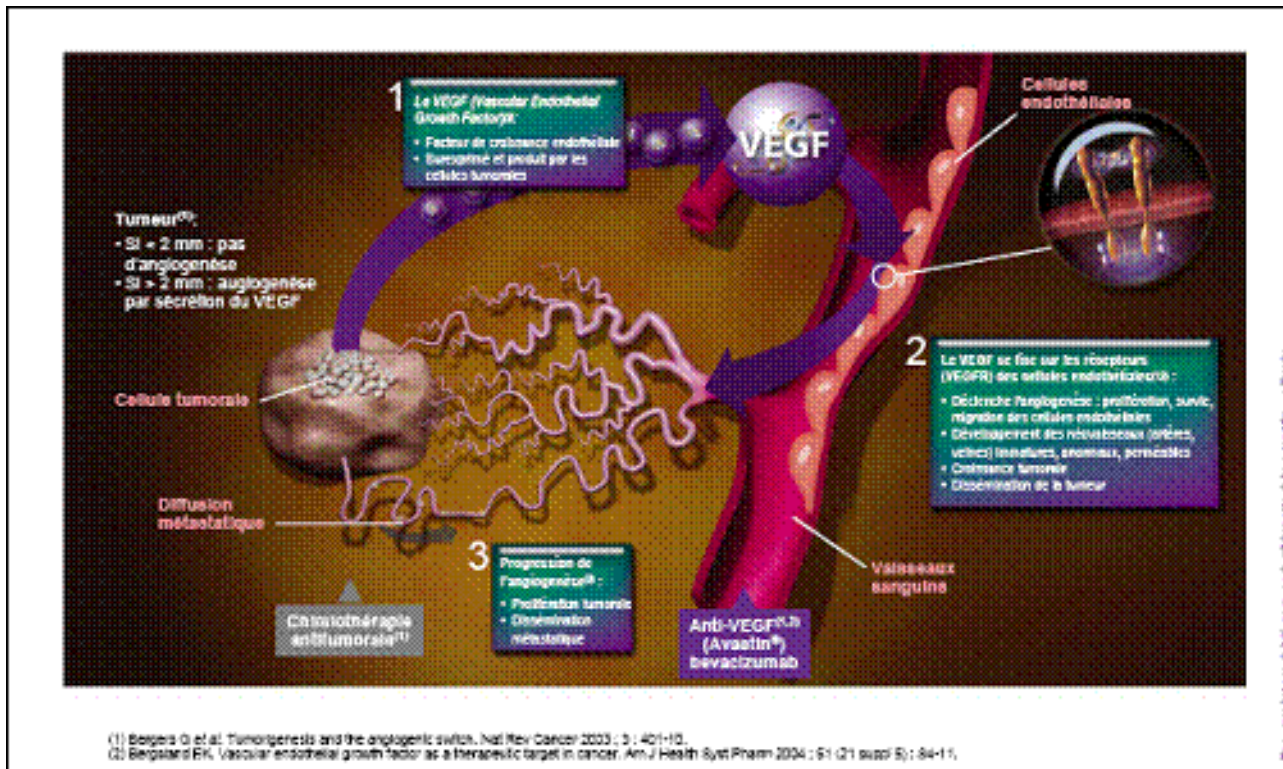
...

# Les récepteurs à activité tyrosine kinase



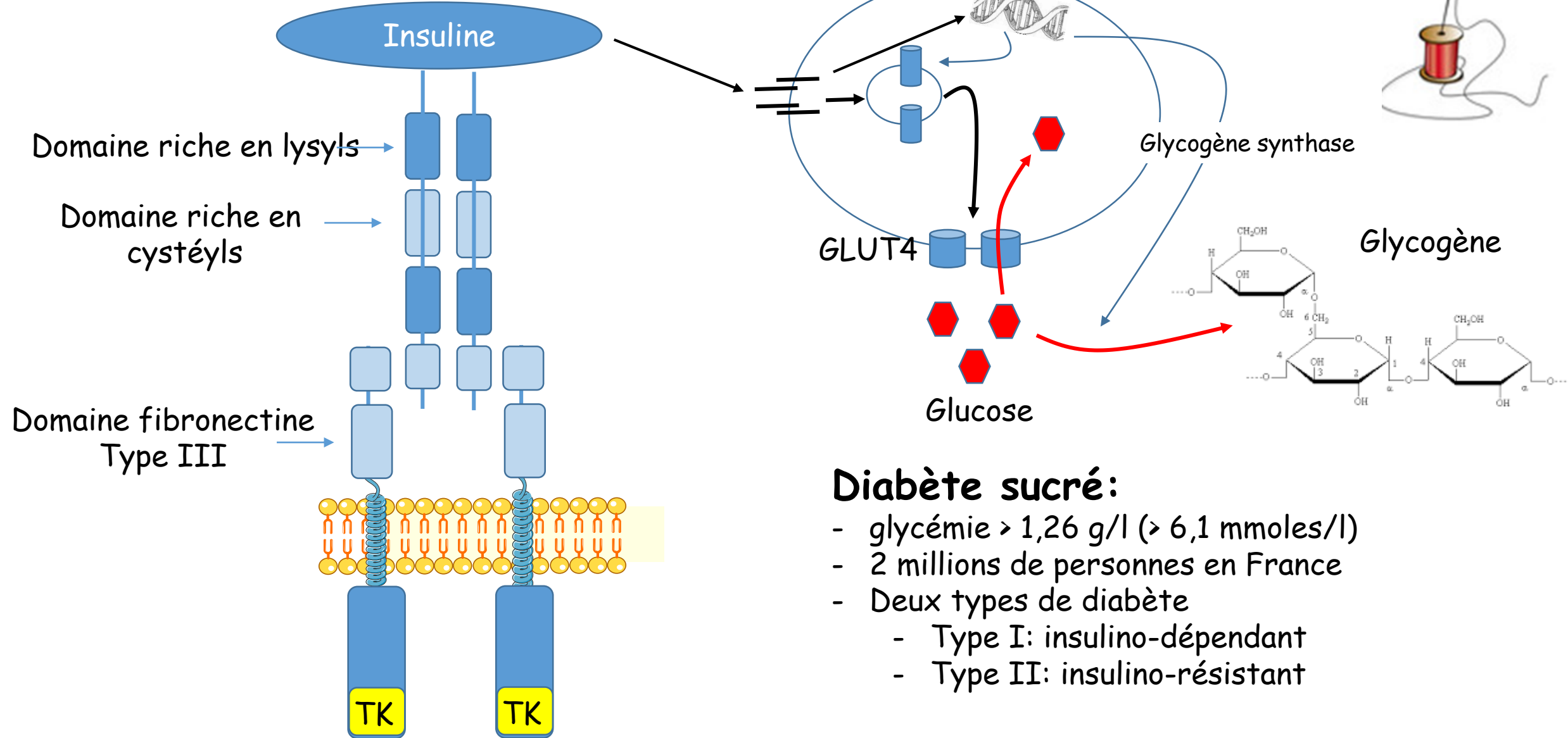
# Les récepteurs à activité tyrosine kinase

## → Le récepteur du « vascular endothelial growth factor » (VEGF)



# Les récepteurs à activité tyrosine kinase

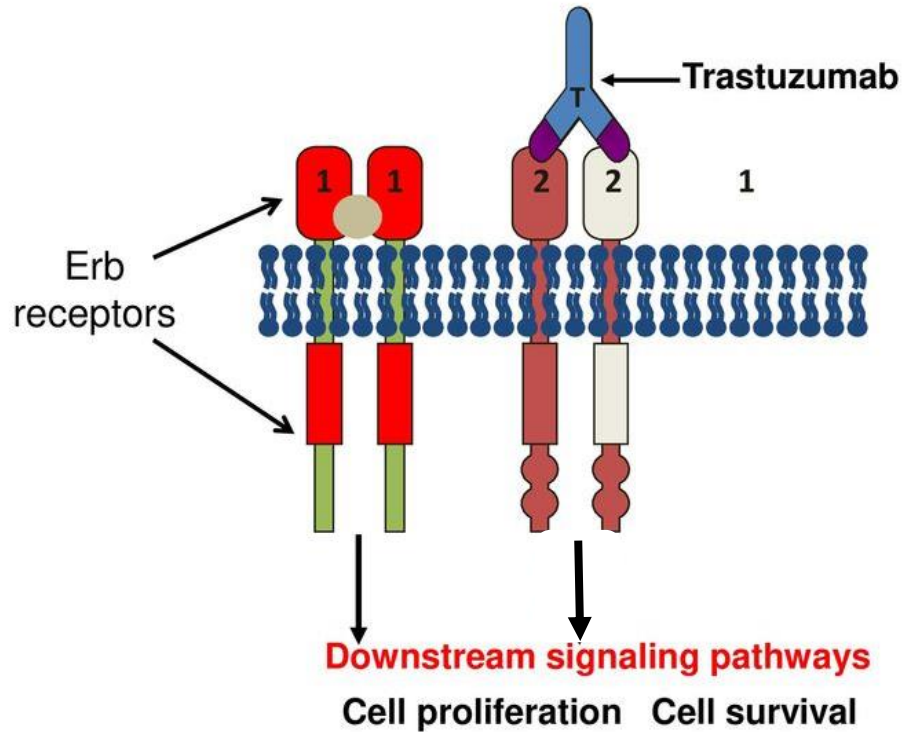
## ➔ Le récepteur de l'insuline





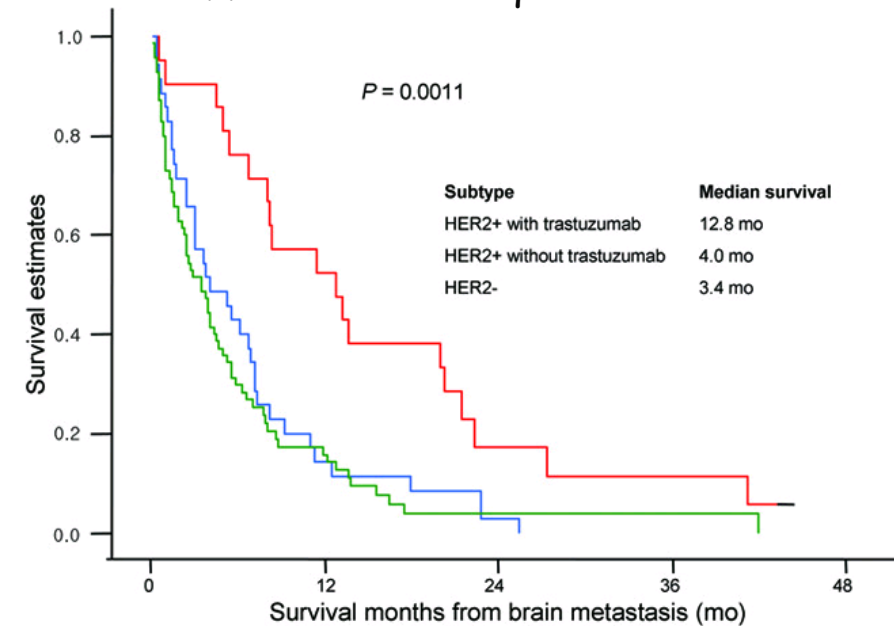
# Les récepteurs à activité tyrosine kinase

## ➡ Le récepteur de l'EGF (EGFR: Erb)



### Trastuzumab (Herceptin®)

- Anticorps monoclonal humanisé anti-HER2
- 20% des cancers du sein: surexpression de HER2
- Les cancers HER2+ ont un mauvais pronostic
- EI: insuffisance cardiaque !!!!



# Les récepteurs à activité tyrosine kinase

## ➡ Les récepteurs à activité tyrosine kinase cytosolique

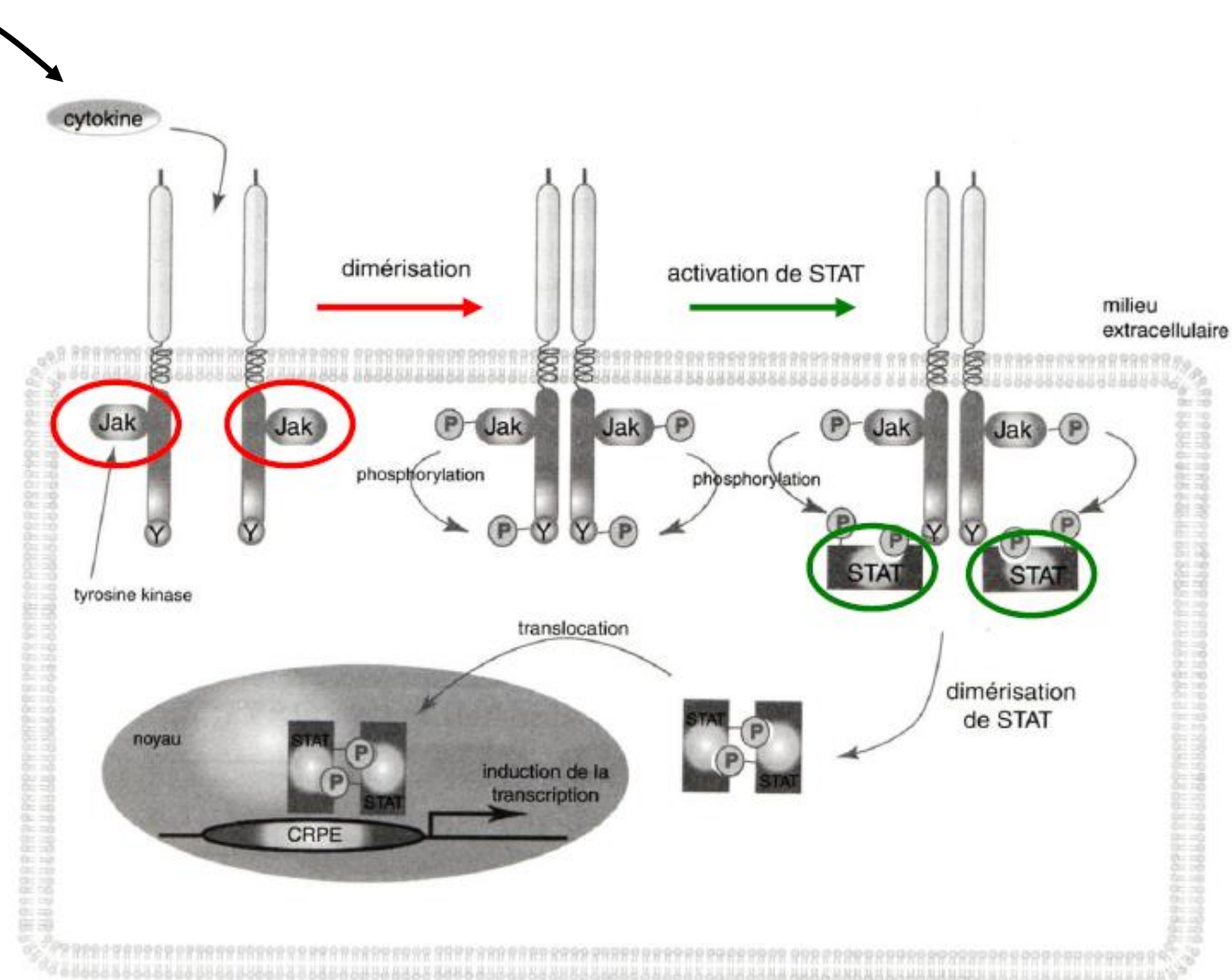
Hormone de croissance

Erythropoïétine

Interleukines

Interférons

...

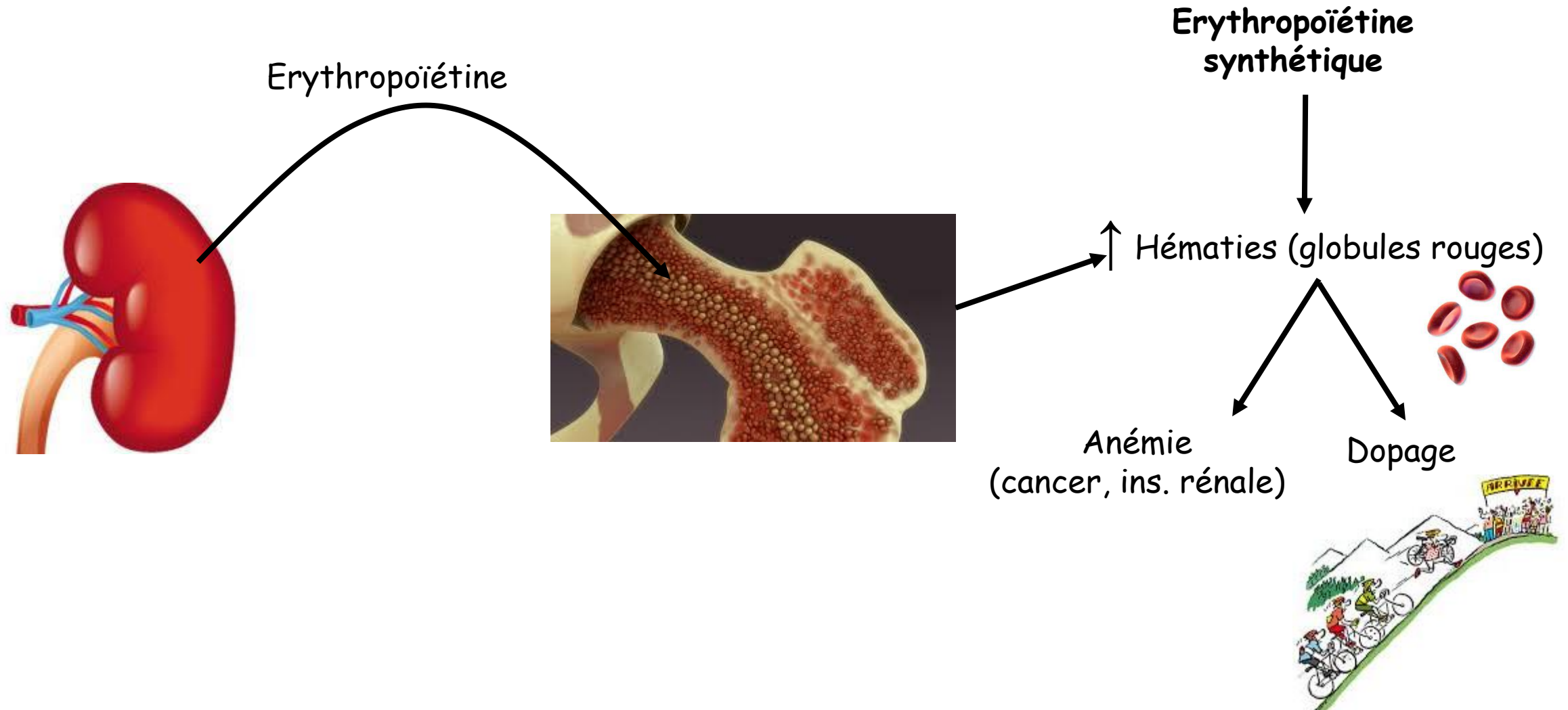


JAK: Janus kinase

STAT: Signal Transducers and Activators of Transcription

# Les récepteurs à activité tyrosine kinase

## ➔ Les récepteurs à activité tyrosine kinase cytosolique

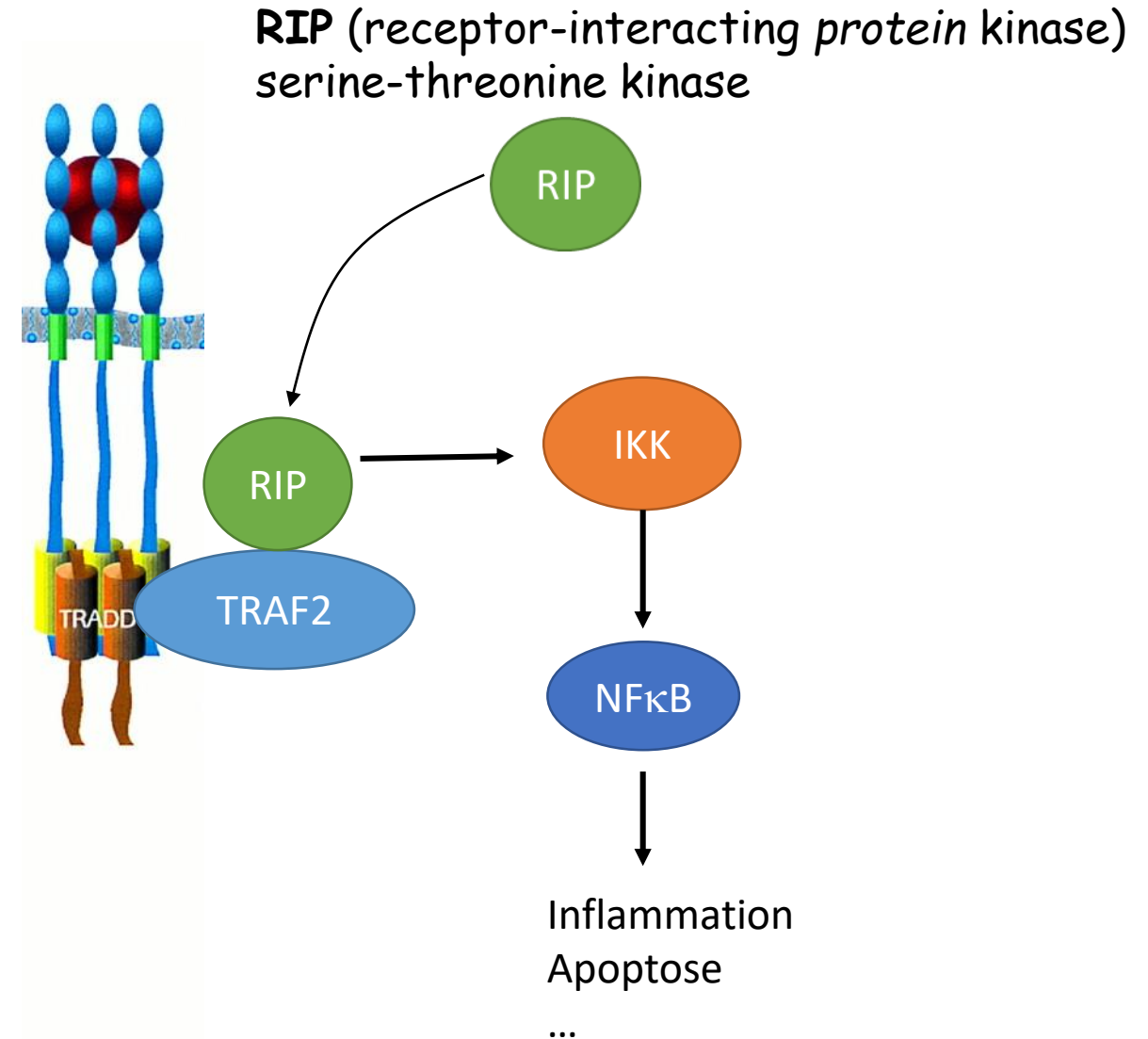
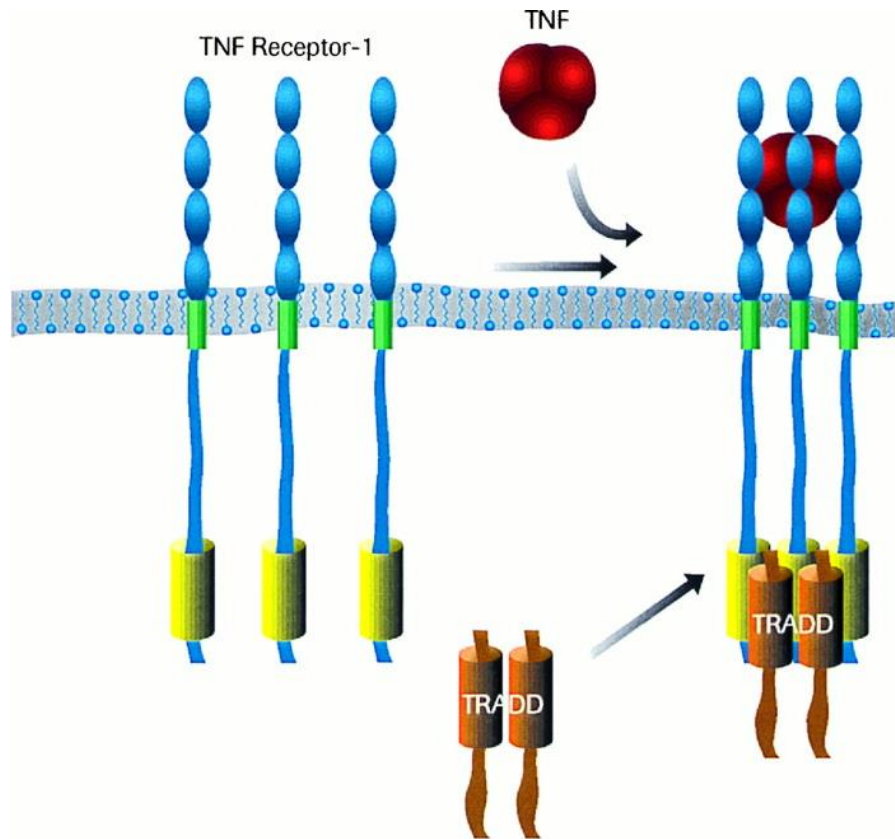


# Les récepteurs à activité enzymatique

- Les récepteurs à activité tyrosine kinase
  - Structure générale
  - Le récepteur de l'insuline
  - Le récepteur du VEGF
  - Le récepteur Erb2
  - Les récepteurs à activité tyrosine kinase cytosolique
- Les récepteurs à activité séryl-thréonine kinase
- Les récepteurs à activité guanylyl cyclase

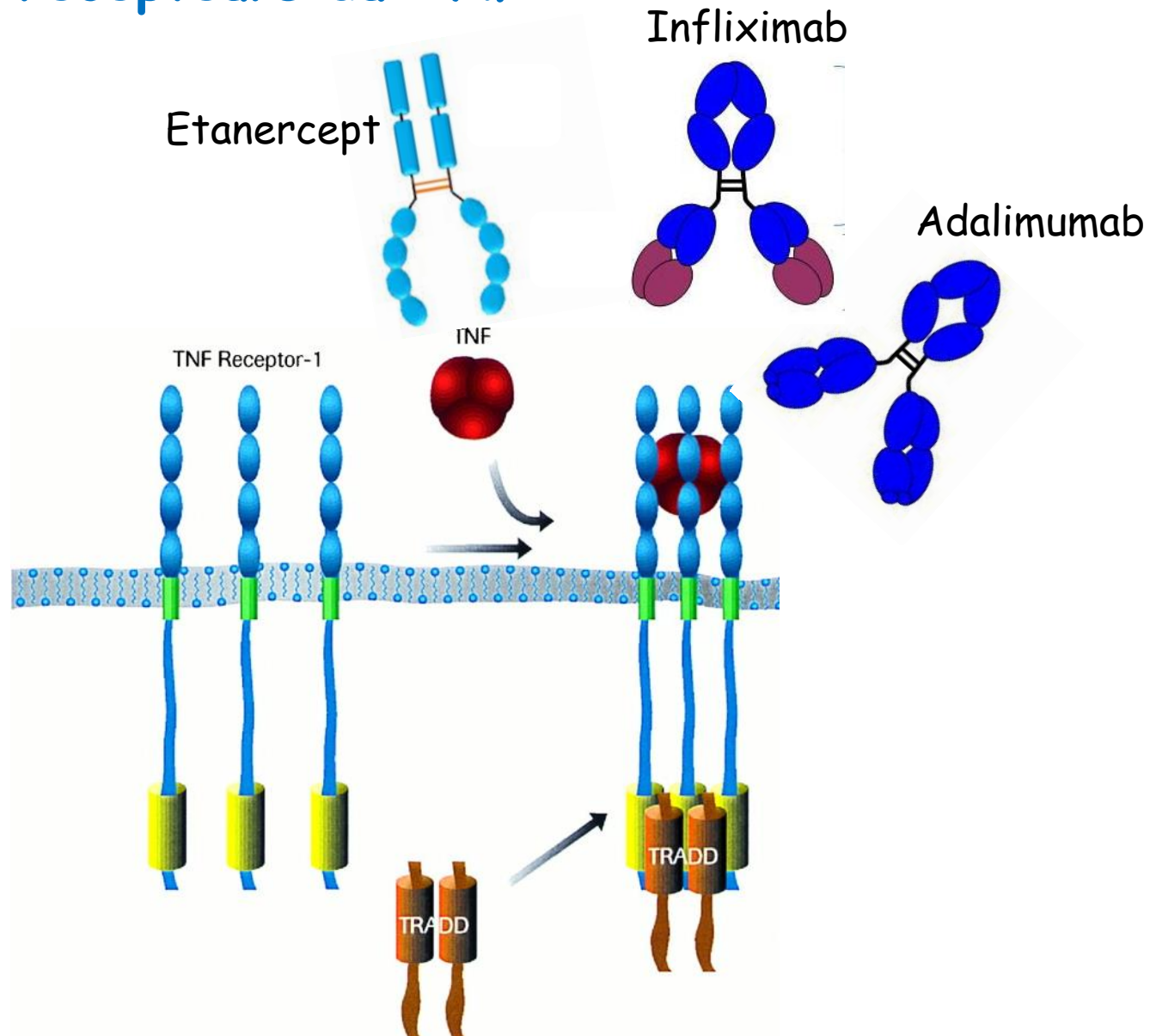
# Les récepteurs à activité séryl-thréonine kinase

## ➔ Les récepteurs du TNF



# Les récepteurs à activité séryl-thréonine kinase

## ➔ Les récepteurs du TNF



## Indications variées

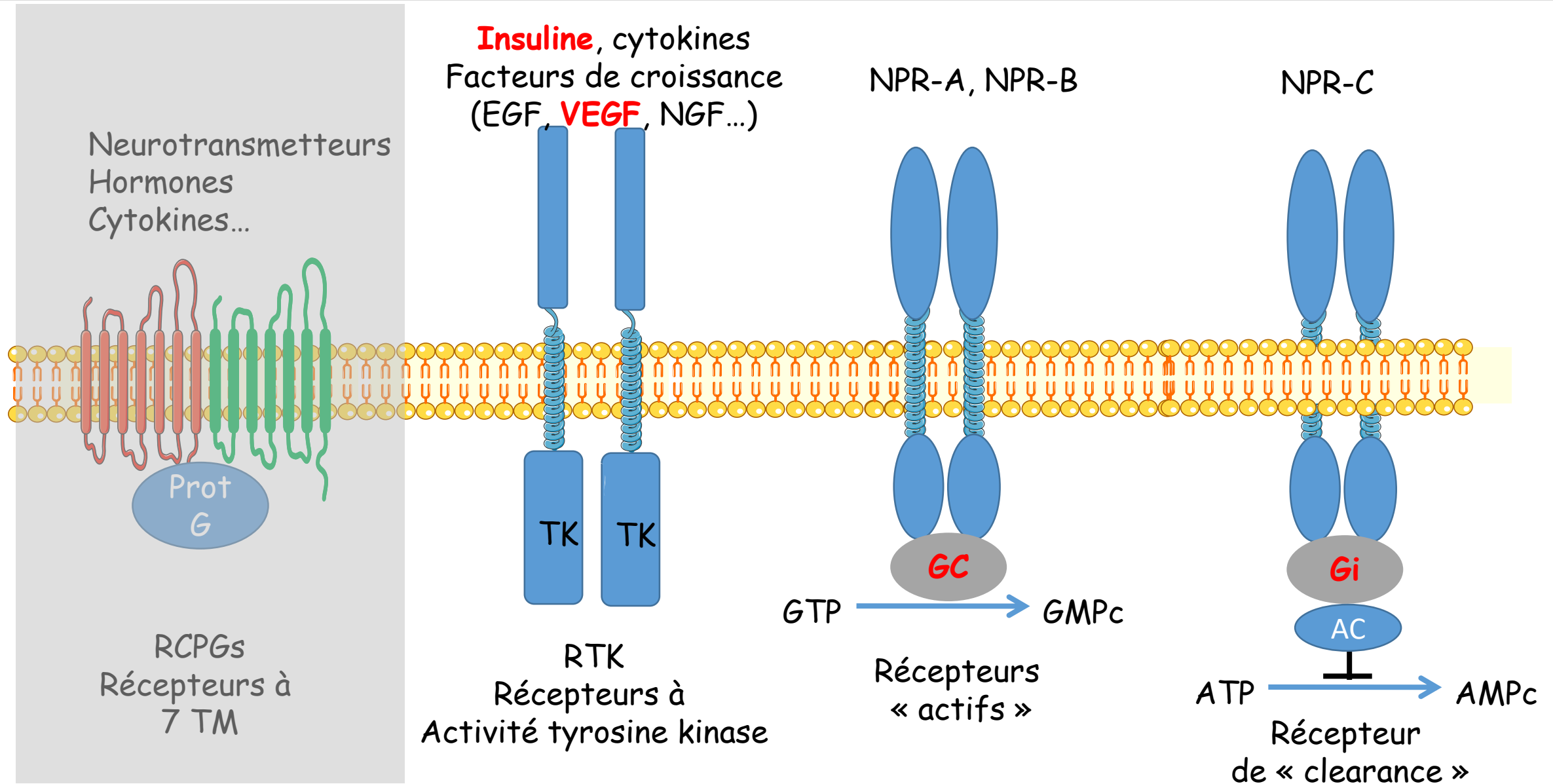
- Maladie de Crohn
- Rectocolite hémorragique
- Polyarthrite rhumatoïde
- ...



# Les récepteurs à activité enzymatique

- Les récepteurs à activité tyrosine kinase
  - Structure générale
  - Le récepteur de l'insuline
  - Le récepteur du VEGF
  - Le récepteur Erb2
  - Les récepteurs à activité tyrosine kinase cytosolique
- Les récepteurs à activité séryl-thréonine kinase
- Les récepteurs à activité guanylyl cyclase

# Les récepteurs à activité guanylyl cyclase: peptides natriurétiques





# Les récepteurs à activité guanylyl cyclase

