



Universidad Del Sureste
Campus Comitán
Lic. Medicina Humana



Farmacología.

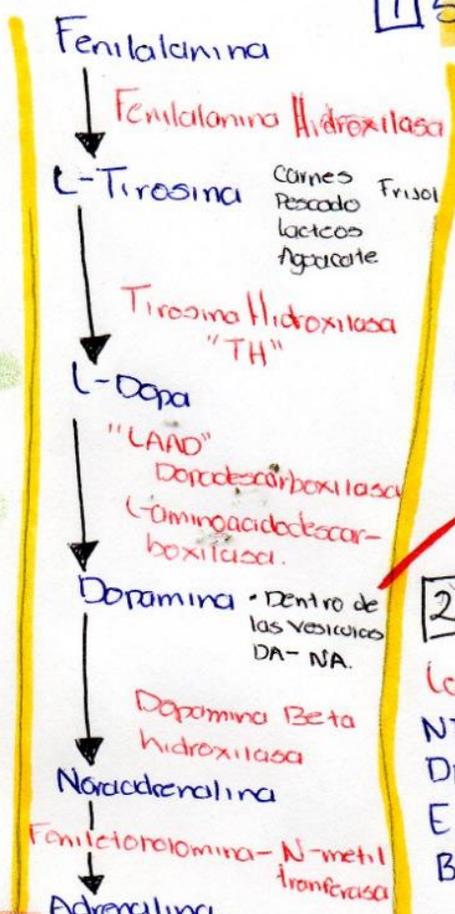
Dr. Dagoberto Silvestre Esteban

Neurotransmisores

Mauricio Antonio Pérez Hernández

3°A

1] Síntesis de catecolaminas



Fármacos

- Reserpina
 - Uso: Antihipertensivo
 - M. de acción: Inhibe el transporte de aminas.
- Anfetaminas } Liberación + vesículas
- Efedrina } Efedrina: Broncodilatador
- Cocaína
- Antidepresivos tricíclicos } Bloquean la recaptación
- Amitriptilina
- Entacopone } Inhibe COMT
- Setegilina } Inhibe MAO

La Reserpina Inhibe el transporte hacia el interior de las Vesículas

- Usos: Antihipertensivo.
- Inhibe: El transportador de aminas

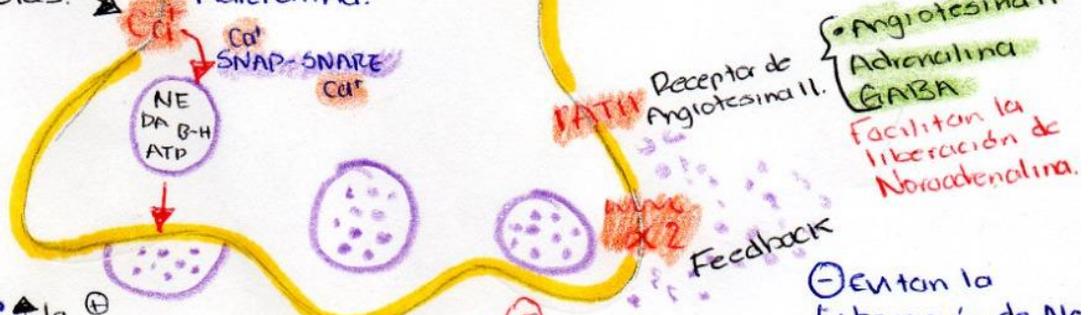
2] Almacenamiento en Vesículas.

Las vesículas contienen

- NE: Noradrenalina / Noradrenalina
- DA: Dopamina
- E: Epinefrina - Adrenalina
- B-H: B-Hidroxilasa

3] Liberación de Vesículas

Se da gracias a la entrada de Ca^{2+} que activa el sistema Snap-Snare y libera las vesículas.



Receptor de Angiotensina II

- Angiotensina II
- Adrenalina
- GABA

Facilitan la liberación de Noradrenalina.

5] Eliminación y metabolismo del Neurotransmisor.

Recaptación

Metabolismo

- Anfetaminas
- Efedrina
- ↑ la Ca^{2+} liberación de vesículas
- Cocaina
- Antidepresivos
- Amitriptilina
- Inhiben la recaptación de vesículas
- Forman como desecho ácido mendelico
- Dx de Feocromocitoma
- Se elimina a la circulación

COMT (Catecol-O-metiltransferasa)

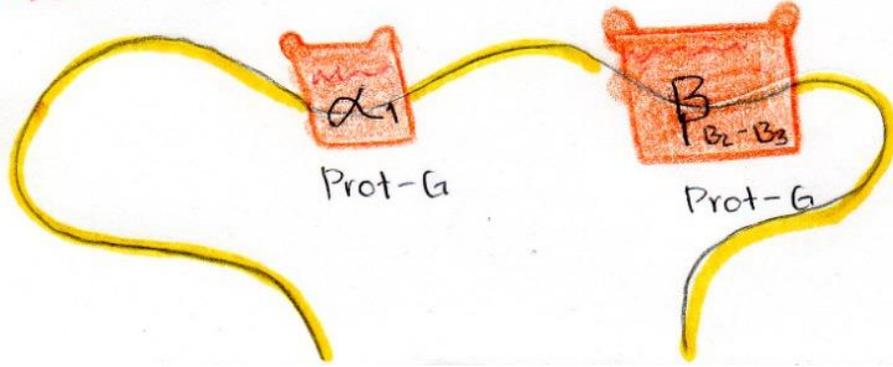
MAO ayb (Monoaminooxidasa)

Setegilina Inhibe la acción de la MAO.

Evitan la liberación de NE

Prostaglandinas
ACh
DA
Adenosina

4] Unión al Receptor Postsináptico α o β



SÍNTESIS DE ACETILCOLINA

Para la síntesis de acetilcolina (ACh), es necesaria la presencia de colina, la cual a través de un proceso de acetilación con Acetil-CoA es transformada en ACh. Este proceso es catalizado por la enzima acetilcolina transferasa o colinoacetil transferasa.

1

Síntesis de la acetilcolina

Dos reacciones proveen las cantidades necesarias de colina.

La primera utiliza la degradación de un lípido de membrana, la fosfatidilcolina

La segunda reacción es la recaptación de la colina.

La colina luego entra a la terminal de la fibra nerviosa por un mecanismo de transporte activo.

2

Almacenamiento de la Acetilcolina

luego de la síntesis de ACh, está se almacena en las vesículas sinápticas.

En cada vesícula existen aproximadamente entre

1000 a 50000 moléculas de acetilcolina.

En cada terminación nerviosa, puede haber unas 300000 vesículas de almacenamiento

3

Liberación de acetilcolina

Para que se produzca la liberación de ACh es necesario que el potencial de acción que corre a lo largo del nervio llegue a la terminal nerviosa.

Cuando esto se produce, existiría un influjo masivo de Ca^{++} a nivel del terminal nervioso que modificaría la carga eléctrica a ese nivel, facilitando de alguna manera el adosamiento de las vesículas a la membrana presináptica y por medio de complejos mecanismos vaciarían su contenido en el espacio sináptico.

La Acetil-CoA para esta reacción deriva de la oxidación del piruvato, reacción catalizada por la enzima piruvato deshidrogenasa.

La colinoacetil transferasa como otros constituyentes proteicos de la neurona, se sintetiza en el soma neuronal

Luego se transporta a lo largo del axón hasta su terminal.

El mecanismo más importante con que se puede inhibir la síntesis de ACh por medio farmacológico es mediante

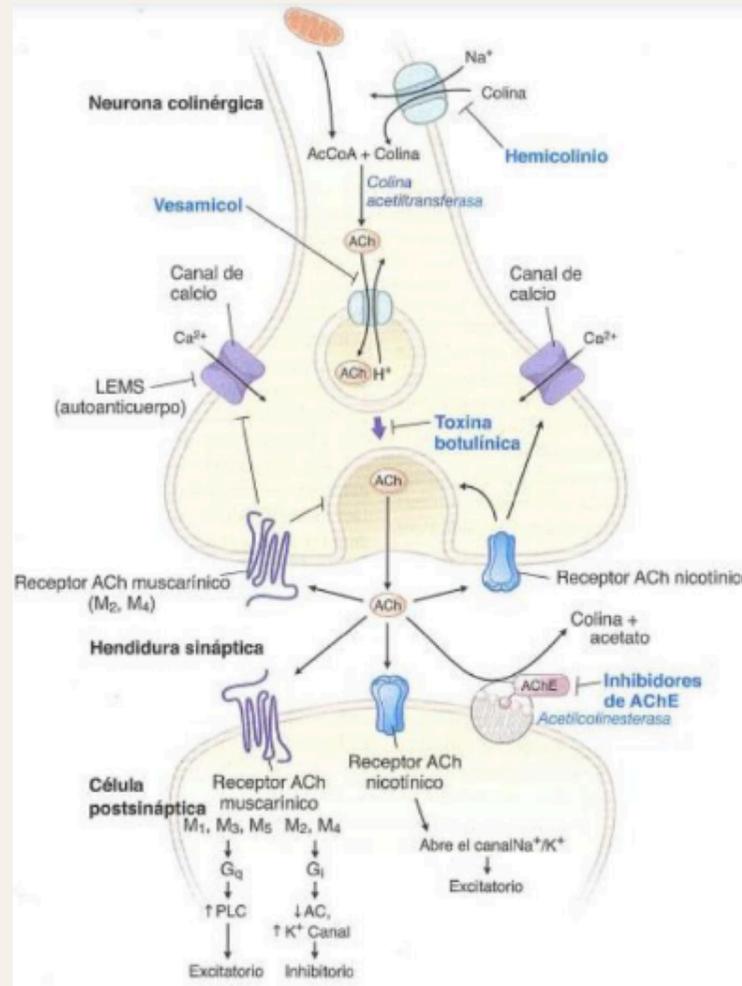
Hemicolinio 3 que altera el ingreso de la colina a la terminal por competir con la misma a nivel del sitio de transporte activo.

El Vesamicol es un fármaco que interfiere en la incorporación de la acetilcolina sintetizada a las vesículas de forma que ésta no se encuentra disponible para la liberación.

También existe una liberación espontánea de ACh en la terminal de los nervios colinérgicos, estas descargas mínimas se pueden también registrar a nivel de la placa motora y son los llamados potenciales de placa.

el ion Ca^{++} facilita la liberación de acetilcolina; en determinados estudios se demostró que la ausencia de este ion, inhibe la liberación de la misma.

La liberación de acetilcolina, al ser un fenómeno que requiere energía, no se produce si no existe glucosa disponible para proveerla.



4

Acción sobre los receptores postsinápticos

Receptores Nicotínicos: se encuentran ubicados a nivel de la placa motora, en los ganglios simpáticos y parasimpáticos y en el soma de la neurona de Renshaw.

Receptores Muscarínicos:

M1, M4 y M5: ubicados en el SNC. Estos receptores están implicados en respuestas complejas tales como la memoria, atención y analgesia. Los receptores M1 se encuentran también en las células parietales gástricas y a nivel de los ganglios autonómicos

M2: a nivel cardíaco, la activación de los receptores M2 disminuye la velocidad de conducción a nivel de los nodos sinoauricular y auriculoventricular, reduciendo así la frecuencia cardíaca.

M3: se encuentran en músculo liso. La activación de los receptores M3 a nivel del músculo liso produce acciones en; bronquios (broncoconstricción), vejiga (se favorece la micción), glándulas exocrinas, entre otros tejidos.

5

Terminación del efecto y recuperación de la funcionalidad de la sinapsis:

Las enzimas que hidrolizan la acetilcolina y otros ésteres de la colina se llaman colinesterasas y son de dos clases:

la acetilcolinesterasa, colinesterasa verdadera, específica o de tipo «e» o eritrocitaria:

se encuentra exclusivamente en las neuronas, en las sinapsis ganglionares de la estructura neuromuscular y en los eritrocitos

la butirilcolinesterasa, seudocolinesterasa, colinesterasa inespecífica o de tipo «s», colinesterasa sérica o plasmática:

está presente en casi todos los tejidos (principalmente en el hígado) y en el plasma, pero en poca concentración en los sistemas nerviosos central y periférico.

Conclusión

Para terminar es muy importante conocer la transmisión colinérgica y adrenérgica porque ese dependen varios factores de los cuales dependerá que podamos salvar una vida como es en el caso de intoxicación por órganos fosforados los cuales son anti colinesteresicos que provocan la activación de los receptores muscarinicos y nicotínicos e diversos órganos, ganglios y SNC, en este caso se debe administrar un ante colinérgico, como atropina, hasta que desaparezcan los síntomas, es necesario saber igual es la transmisión colinérgica es parte fundamental del sistema nervioso parasimpático, ya que con sus distintas funciones siempre va a oponer al sistema simpático. A demás se ha investigado y comprobado que la farmacología de la transmisión colinérgica es muy importante, ya que existen diversas patologías relacionadas con el sistema parasimpático que pueden ser tratadas con fármacos que bloquean la actividad del mismo y a la vez ejerciendo una acción simpática,

Bibliografía

*GOODMAN & GILMAN LAS BASES FARMACOLÓGICAS DE LA TERAPÉUTICA 13ª EDICIÓN,
LAURANCE BRUNTON, McGraw-Hill Interamericana de España, 2019.*