



UDS

Mi Universidad

Royer Obed Ramírez López

Farmacodinamia

Segundo Parcial

Farmacología

Dr. Alan de Jesús Morales Domínguez

Licenciatura en Medicina Humana

Tercer Semestre

Farmacodinámica

Laboratoria de los receptores

- Es el estudio del mecanismo de acción detallado por el que los fármacos interactúan con moléculas celulares específicas producen sus efectos farmacológicos
- Comienza con la unión del fármaco a su receptor, enzimas u otra proteína diana celular, el fármaco se une a un receptor por la formación de enlaces de hidrógeno, iónicos o hidrófobos.
- La unión del fármaco presenta estereoespecificidad con un centro quiral de aminoácidos. Se unirá al receptor y actuará su señalización

Tipos de receptores

- Proteínas G (GPCR) - Activación
- En la unión de su especificidad por el fármaco, su localización en los tejidos y por su secuencia primaria de aminoácidos.
- Proteínas transportadoras de membrana
- Los receptores adrenérgicos se dividen en dos tipos (α y β) en función a su afinidad por la noradrenalina, la adrenalina y otras sustancias por la unión del ligando y que originan cambios conformacionales en el receptor.
- Canales iónicos dependientes de ligando
- Comparten una estructura de 7 subunidades conocidas como $\alpha_1, \alpha_2, \alpha_3, \beta_1, \beta_2, \beta_3$ y γ . Las subunidades α y β se ensamblan formando el canal iónico y con otras moléculas activan o inhiben canales celulares en clulas tetraméricas o pentámeras y con otras moléculas de la célula diana.
- Alteran la conductancia de los iones a través de la proteína del canal iónico.

Receptores acoplados a proteínas G - Canales iónicos dependientes de ligando

- Segundos mensajeros: Interacción del receptor con una molécula del receptor con una molécula activa o inhiben canales celulares en clulas tetraméricas o pentámeras y con otras moléculas de la célula diana.
- Alteran la conductancia de los iones a través de la proteína del canal iónico.

Clasificación de los receptores

- Receptores de membrana con actividad enzimática
- Receptores nucleares
- Actúan como receptores para diversas sustancias endógenas y fármacos

Receptores nucleares

- Receptores nucleares tipo I (hormonas sexuales y tipo II (vitaminas liposolubles))
- Receptores guanilato ciclasa, receptor tirosina cinasa, receptor asociado a tirosina cinasa, receptor tirosina fosfatasa y receptor serina/treonina cinasa
- También envía señales a local para que internalice el receptor de membrana.

Recepción de los receptores y tolerancia farmacológica

- Los agonistas pueden desensibilizar los receptores por la liberación de los residuos de serina o treonina del dominio C-terminal de los GPCR, para que internalice el receptor de membrana.
- La tolerancia se observa cuando la administración es repetida y

Agonistas

- Existen 3 tipos de agonistas
- Complejos, Parciales e Inversos
- Los antagonistas impiden la acción de la unión del receptor

	D	M	A	Scribe®
--	---	---	---	---------

Relaciones Dosis-Respuesta — Eficacia

- Existe entre la concentración de un fármaco en la localización del receptor y la magnitud de la respuesta.
- Se describe en términos de respuesta escalonada o sigmoidea.
- Se describe en términos de porcentaje de la respuesta máxima.
- Para un fármaco determinado, la respuesta máxima se produce cuando todos los receptores se encuentran ocupados, y la respuesta semimáxima se produce cuando el 50% de los receptores se encuentran ocupados.
- La potencia es una característica de la acción de un fármaco que es útil para comparar diferentes medicamentos.
- La respuesta máxima producida por un fármaco se conoce como eficacia.
- Cuando se administra un agonista parcial junto con un agonista, el agonista parcial puede actuar como un antagonista al impedir que el agonista no tiene eficacia.
- La respuesta suscitada por cada dosis de un fármaco se describe en términos del porcentaje acumulado de sujetos que muestran un efecto de todo o nada definido y se representa frente al logaritmo de la dosis del fármaco.
- Pueden definirse para los efectos tóxicos como terapéuticos del fármaco con el fin de calcular su índice terapéutico (IT) y su factor de seguridad (FS).
- IT y FS se basan en la diferencia entre la dosis tóxica y la dosis terapéutica en una población de sujetos.

