Victoria Montserrat Díaz Pérez.

Mapa conceptual.

Segundo parcial.

Farmacología.

Dr. Alan de Jesús Morales Domínguez.

Licenciatura en Medicina Humana.

Semestre 3° A.

Comitán de Domínguez Chiapas a 04 de abril de 2025.

Farmacodinamica.

¿Qué es?

Es el estudio del mecanismo de acción detallado por el que los fármacos ejercen sus efectos farmacológicas.

Este estudio del mecanismo de acción de un fármaco comienza con la unión del fármaco a su receptor o su receptor puede que esta sola acción y proteína diana.

Naturaleza de los receptores farmacológicos.

Los fármacos ejercen sus efectos al interactuar con moléculas celulares específicas llamadas receptores.

La inmensa mayoría de ligandos se unen a moléculas proteicas aunque algunas sustancias actúan directamente sobre el ADN o los lípidos de membrana.

Tipos de receptores farmacológicos.

La familia más extensa de receptores de fármacos es la de los receptores acoplados a proteínas G. (GPCR).

se trata de

Proteínas que atraviesan la membra y que constan de:

- 4 dominios extracelulares
- 7 dominios transmembrana.
- 4 dominios intracelulares.

Ligando

Moléculas que se unen al receptor se denominan ligandos.

Canales iónicos

Los fármacos puedan unirse al mismo sitio que el ligand endóge no.

Farmacodinamica.

Clasificación de los receptores.

Se clasifican en función de su especificidad por el fármaco, su localización en los tejidos y más recientemente, de su secuencia primaria de aminoácidos.

Se dividen en

Inicialmente 2 tipos α y β

Interacciones entre fármaco y receptor.

Unión al receptor y afinidad.

Para iniciar una respuesta celular el fármaco debe en primer lugar unirse a un receptor.

Los fármacos se unen a su receptor mediante la formación de enlaces de hidrógeno, iónicos o hidrófobos con el sitio de receptor.

La unión de los fármacos receptores muchas veces presenta estereoespecificidad, de forma que solo uno de los estereoisómetos.

Transducción de señales.

Describe la vía que empieza por la unión de ligando y que origina cambios conformacionales en el receptor.

Esta cascada de acontecimientos bioquímicos medidos por el receptor acaba dando lugar a uno o varios efectos farmacológicos.

Receptores acoplados a proteína G.
- Receptor adrenérgico α_1 α_2 β
- Receptor muscarínico.

Canales iónicos.
- Receptores $GABA_A$
- Receptores nicotínicos.

Receptores de membrana con actividad enzimática
- Receptores del péptido natriurético auricular
- Receptor de insulina

Farmacodinamica.

Receptores acoplados a proteinas G.

Las proteinas G heterotriméricas constan de 3 subunidades conocidas como

Gα, Gβ y Gγ.

La subunidad Gα es el lugar de hidrolisis de la guanosina trifosfato

Las subunidades Gβ y Gγ se encuentran tan estrechamente unidades entre si que no se disocian, por lo que expresan en conjunto como Gβγ.

Canales iónicos dependientes de ligando

Son una extensa clase de proteinas de membrana que comparten una estructura de subunidades similar y que se ensamblan formando

Estructuras tetrametricas o pentaméricas.

Los fármacos que se unen a los canales iónicos dependientes de ligando alteran la conductancia de los iones a través de la porción del canal.

Ningun segundo mensajero resulta directamente activado por el fármaco que se une al canal iónico dependiente del ligando.

Canales iónicos dependientes de ligando
c. iónico de voltaje

Receptores de membrana con act enzimatica

Los receptores de membrana con actividad enzimática, actuan como receptores para diversas sustancias endógenas y fármacos.

Se clasifican en 5 tipos

- Receptor guanilato ciclasa.
- Receptor tirosina cinasa.
- Receptor asociado a tirosina cinasa.
- Receptor tirosina fosfatasa.
- Receptor serina/treonina cinasa.

Existe una enorme cantidad de ligandos que activan estos receptores, entre ellos el factor de crecimiento epidermico, el factor de crecimiento nervios y la insulina.

Farmacodinámica.

Receptores nucleares.

Consta de 2 tipos de receptores con una estructura proteica similar.

Receptores nucleares tipo I objetivo de hormonas sexuales, así como de glucocorticoides y mineralocorticoides.

Receptores nucleares tipo II

Tienen ligandos no esteroideos, como la hormona tiroidea los vitaminas A y D y los retinoides.

Eficacia de los fármacos.

La capacidad de un fármaco para iniciar un efecto celular se denomina eficacia.

La eficacia no está estrechamente relacionada con la afinidad por el receptor.

Los fármacos que presentan por afinidad por el receptor y eficacia se llaman agonistas

Hemos que los fármacos que se presentan afinidad por el receptor, pero carecen de eficacia se denominan antagonistas.

Regulación de los receptores y tolerancia farmacológica.

Los receptores pueden experimentar cambios dinámicas con respecto a su densidad y a su afinidad por los fármacos y otras ligando

La fosforilación del receptor produce la eficacia del acoplamiento con la proteína G y altera la afinidad de la unión.

Este efecto a corto plazo de la exposición a los agonistas se llama desensibilización o taquifilaxia.