

Complejo fármaco – receptor

Introducción

Definiciones

La farmacología puede ser definida como el estudio de las sustancias que obra recíprocamente con los sistemas vivos completamente

Procesos de químico, especialmente atando a las moléculas reguladoras y activando o inhibiendo el cuerpo normal procesa.

Estas sustancias pueden ser los productos químicos administre para lograr un beneficioso el efecto terapéutico en cierto proceso dentro del paciente o para sus efectos tóxicos en regulador procesos en parásitos infectando el paciente.

Farmacodinamia:

Estudia:

* El efecto fisiológico que tiene un fármaco sobre el organismo, además de la respuesta bioquímica que conlleva la respuesta fisiológica.

*El mecanismo por el cual produce su efecto dicho fármaco.

*La relación que existe entre la cantidad de fármaco que se administra (dosis) y la respuesta que se obtiene.

Los fármacos al ser administrados producen efectos, los cuales se clasifican en efectos deseados y efectos indeseados o reacciones adversas.

Los efectos deseados se pueden obtener a través de:

* Alteraciones en la membrana celular: dado el carácter lipo-proteico de la membrana celular, hay una serie de efectos que se producen por la naturaleza del fármaco que se administra. Si es liposoluble, o hidrosoluble, va a producir distintos efectos.

Efecto farmacológico: es una respuesta fisiológica con cambios en la función celular, que puede ser aumento o disminución.

Los fármacos no crean ninguna función nueva, lo único que hacen es cambiar el carácter de la función fisiológica.

Receptores farmacológicos: sitio donde actúan los fármacos. Son estructuras proteicas macromoleculares de diversa ubicación celular que interactúan con los fármacos modificando de forma constante y específica la función celular. Un

receptor se considera tal solamente si modifica la función celular en forma constante mientras se esté administrando el fármaco y esa modificación sea específica.

Existen algunos fármacos o agentes, que inducen un efecto sin unirse a receptores como son:

- Alcohol: por sus propiedades fisico-químicas, produce alteraciones, tanto de iones como de neurotransmisores, en la membrana celular, que se traducen en estados alcohólicos. Estos son primero de estimulación, y posteriormente de depresión. Actualmente, se piensa que existen receptores para el alcohol.

-Manitol: es un expandor del plasma

Clases de receptores farmacológicos:

1- A nivel celular:

- De superficie: Están a nivel de la membrana.

Los fármacos hidrofílicos, por sus características no entran a la célula por lo que se unen a estos receptores.

- Intracelulares: En el citoplasma y en el núcleo.

Los fármacos hidrofóbicos entran a la célula y se unen a receptores intracelulares tanto a nivel de citoplasma como a nivel de núcleo.

2- A nivel sináptico

- Pre sinápticos: su función principal es regular la liberación del neurotransmisor.

- Pos sinápticos: su efecto se produce al momento de captar el neurotransmisor.

Tipos de receptores farmacológicos:

Tipo 1: receptores ionotrópicos o de canales iónicos controlados por ligandos.

Tienen entre 4 y 5 dominios tras membrana, los cuales son asociaciones de aminoácidos unidos mediante uniones peptídicas y conectados entre sí por asas.

Localización:	Membrana.
Efactor	Canal iónico.

Acoplamiento	Directo, no necesitan un intermediario para ejercer su efecto
Velocidad de efecto	Inmediato, milisegundos. Se abre el canal, pasan los iones y se produce su efecto.

Tipo 2: receptores metabotrópicos o acoplados a proteínas G.

Localización:	Membrana.
Efactor	Canal iónico u enzima
Acoplamiento	Proteína G
Velocidad de efecto	Segundos, más lentos porque tienen que acoplarse a la proteína G para producir el efecto

Tipo 3: receptores ligados a enzimas (generalmente quinasas)

Tienen un solo dominio transmembranoso al fármaco se une directamente, y en la porción intracelular este se une a la enzima.

Localización:	Membrana.
Efactor	Tirosincinasa
Acoplamiento	Directo
Velocidad de efecto	Minutos

Tipo 4: receptores nucleares.

Una vez que el fármaco está dentro de la célula, su efecto es promover la transcripción del ADN.

Localización:	Tanto en el cito sol como en el núcleo
Efactor	Transcripción genética
Acoplamiento	Vía ADN
Velocidad de efecto	Horas

Consecuencia unión fármaco- Receptor.

Cuando se une un fármaco a un receptor, se forma un complejo fármaco–receptor, el cual al desdoblarse produce un efecto y queda el receptor libre.

Fármaco + Receptor \rightleftharpoons [Complejo Fármaco-Receptor] \rightarrow Receptor + Efecto.

El agonista se une al receptor, forma el complejo, activa segundos mensajeros que finalmente producen el efecto, porque el fármaco no produce su efecto solamente uniéndose al receptor, sino que debe producir cambios, normalmente enzimáticos, dentro de la célula para lograrlos.

En cambio el antagonista se une al receptor porque tiene afinidad a este incluso mayor que la afinidad del agonista (10 mil veces más afinidad), pero no produce ningún cambio en la célula.

Relación dosis- efecto. Cuando se administra un fármaco, se produce un efecto, el cual es proporcional a la dosis que se administra: a mayor la dosis, más efecto.