

# **UNIDAD N° 4**

## **Farmacología General.**

Dra. Biancciotti M. Eugenia.

Instituto Superior Agentes de Propaganda Medica.

# COMO ACTUAN LOS FARMACOS?

---

LA MAYORIA DE LOS FARMACOS ACTUAN MEDIANTE SU FIJACION/ UNION A MACROMOLECULAS ESPECIFICAS QUE SE ENCUENTRAN EN LA SUPERFICIE O EN EL INTERIOR DE LAS CELULAS DANDO LUGAR A CAMBIOS EN SU ACTIVIDAD BIOFISICA O BIOQUIMICA. LAS MOLECULAS CON LAS QUE INTERACCIONAN LOS FARMACOS PARA PODER PARA POSER EJERCER SU ACCION SE DENOMINAN “DIANAS FARMACOLOGICAS”.

LOS TIPOS DE PROTEINAS REGULADORAS QUE ACTUAN COMO DIANAS PRIMARIAS DE LOS FARMACOS SON 4:

“RECEPTORES / ENZIMAS / MOLECULAS TRANSPORTADORAS / CANALES IONICOS.”

# INTERACCION FARMACO – RECEPTOR

---

SON MACROMOLECULAS CELULARES ENCARGADAS DIRECTA Y ESPECIFICAMENTE DE LA “SEÑALIZACION QUIMICA” ENTRE CELULAS Y DENTRO DE LAS CELULAS. POR LO QUE PODEMOS DECIR QUE SON DIANAS MACROMOLECULARES CON LA CAPACIDAD DE UNIRSE A UN FARMACO. LOS RECEPTORES PUEDEN ENCONTRARSE EN:

- a)- MEMBRANA CELULAR.
- b)-MEMBRANA DE ORGANELAS.
- c)- CITOPLASMA.

**LA ESPECIFICIDAD ES RECIPROCA:** cada tipo de fármaco se une solo a determinadas moléculas Dianas y cada tipo de molécula Diana reconoce a determinados tipos de fármacos.

**La respuesta farmacológica comienza tras la formación de un complejo entre la molécula del fármaco y su sitio de acción.**

# AGONISTAS - ANTAGONISTAS

---

TENIENDO EN CUENTA LA CAPACIDAD DE PROVOCAR UNA RESPUESTA BIOLÓGICA TRAS FORMAR EL COMPLEJO FARMACO- RECEPTOR SE PUEDEN CLASIFICAR EN:

**#AGONISTAS:** SON LOS QUE DAN LUGAR AL INICIO DE UNA RESPUESTA BIOLÓGICA. CUANDO UNA MOLECULA DEL FARMACO OCUPA A UN RECEPTOR PUDE ACTIVARLO O NO A DICHO RECEPTOR. POR ACTIVACION SE ENTIENDE QUE LA MOLECULA UNIDA ALTERA EL RECEPTOR DE TAL MODO QUE INDUCE A UNA RESPUESTA BIOLÓGICA.

**#ANTAGONISTAS:** SE DENOMINA ANTAGONISTA DE UN RECEPTOR, AL FARMACO QUE SE UNE SIN ACTIVARLO. ESTOS SIMPLEMENTE OCUPAN EL RECEPTOR Y AL BLOQUEARLO IMPIDEN QUE EL AGONISTA EJERZA SU ACCION.

## **TENIENDO EN CUENTA ESTOS CONCEPTOS PODEMOS CLASIFICAR A LOS AGONISTAS EN 2 GRUPOS:**

---

-AGONISTAS PARCIALES: TIENEN UNA EFICACIA INTERMEDIA DE MODO QUE INCLUSO OCUPANDO EL 100% DE LOS RECEPTORES PRODUCEN UNA RESPUESTA SUBMAXIMA.

-AGONISTAS PUROS O COMPLETOS: TIENEN UNA EFICACIA SUFICIENTE PARA DESENCADENAR UNA RESPUESTA BIOLOGICA MAXIMA.

-ANTAGONISTA COMPETITIVO - EL ANTAGONISTA COMPETITIVO REPRESENTA UNA SITUACION MUY FRECUENTE, EN LA QUE UN FARMACO SE UNE SELECTIVAMENTE A UN TIPO DETERMINADO DE RECEPTOR SIN ACTIVARLO, IMPIDIENDO ASI QUE SE UNA UN ANTAGONISTA. LOS DOS FARMACOS COMPITEN ENTRE SI, YA QUE EL RECEPTOR SOLO PUEDE CAPTAR UNA MOLECULA POR VEZ.

# AFINIDAD - EFICACIA

---

\*LA CAPACIDAD O TENDENCIA QUE TIENE UN FARMACO DE “UNIRSE” A UN RECEPTOR SE DENOMINA **AFINIDAD**.

\*LA CAPACIDAD O TENDENCIA DE UN FARMACO DE “ACTIVAR” UN RECEPTOR UNA VEZ QUE SE UNIO DEPENDE DE SU “EFICACIA”.



POR LO QUE PODEMOS AFIRMAR QUE LOS ATAGONISTAS TIENEN EFICACIA NULA POR NO PODER

GENERAR UNA RESPUESTA BIOLOGICA.

NINGUN FARMACO TIENE UNA ACCION  
TOTALMENTE ESPECIFICA, EN MUCHOS  
CASOS AL AUMENTAR LAS DOSIS DE UN  
FARMACO, ESTE INFLUYE EN OTRAS  
MOLECULAS DIANA ADEMAS DE LA  
PRINCIPAL Y ESTO PUEDE DAR LUGAR  
**EFFECTOS ADVERSOS**

# CANALES IONICOS

---

LOS IONES NO PUEDEN ATRAVESAR LA BICAPA LIPIDICA DE LA MEMBRANA CELULAR, SOLO LO PUEDEN HACER CON LA AYUDA DE PROTEINAS TRANS-MEMBRANALES EN FORMA DE CANALES O TRANSPORTADORES .

POR LO TANTO LOS CANALES IONICOS SON “**POROS SELECTIVOS**” QUE SE ENCUENTRAN EN LA MEMBRANA CELULAR. PERMITEN EL FLUJO DE IONES A FAVOR DE SU GRADIENTE ELECTROQUIMICO, EXISTEN:

- CANALES OPERADOS POR VOLTAJE.

- CANALES OPERADOS POR LIGANDOS.

# LOS CANALES IONICOS PUEDEN ESTAR EN 3 ESTADOS:

---

*CERRADOS Y DISPONIBLES PARA SER ACTIVADOS ( EN REPOSO).*

*-ABIERTOS ( ACTIVOS).*

*-INACTIVO O REFRACTARIO ( SIN PODER SER ACTIVADOS).*

LOS CANALES PUDEN SER DE SODIO (Na), POTASIO (K), CALCIO (Ca<sup>++</sup>), CLORO (CL), ETC.

---

**ENZIMAS: SON PROTEINAS SOLUBLES UNIDAS A LAS MEMBRANAS QUE POSEEN ACTIVIDAD CATALICA EJ. CICLOOXIGENASA, ACETILCOLINESTERASA, Co A REDUCTASA (LA MAYORIA DE LAS ENZIMAS TERMINAN EN ASA).**

**LOS FARMACOS PUEDEN PROVOCAR:**

**\*INHIBICION ENZIMATICA { REVERSIBLE O IRREVERSIBLE**

**\*ACTIVACION ENZIMATICA.**

**MOLECULAS TRANSPORTADORAS: LAS MEMBRANAS CELULARES SEPARAN DOS COMPARTIMIENTOS, EL INTRACELULAR Y EXTRACELULAR DE DIFERENTE COMPOSICION. PARA QUE ESTO SEA POSIBLE SE NECESITAN LAS MOLECULAS TRANSPORTADORAS, LAS CUALES PERMITEN EL PASO DE CIERTOS SOLUTOS EN CONTRA DE SU GRADIENTE DE CONCENTRACION.**

# SEGUNDOS MENSAJEROS:

---

SON SUSTANCIAS QUIMICAS CUYA CONCENTRACION AUMENTA O DISMINUYEN LA ACTIVACION DEL RECEPTOR POR LOS AGONISTAS, LO QUE PONE EN MARCHA EL PROCESO QUE CONDUCE A LA RESPUESTA CELULAR. SON EJEMPLOS:

Ca<sup>++</sup> (CALCIO)

AMPc (ADENOSIN-MONOFOSFATO-CICLICO)

IP3 (INOSITOL-TRI-FOSFATO)

DG (DIACIL-GLICEROL)

# PROTEINA G

---

SON PROTEINAS CELULARES QUE DESEMPEÑAN MULTIPLES FUNCIONES ,  
SU NOMBRE SE DEBE A QUE ELLAS SE FIJAN A NUCLEOTIDOS DE GUANINA (GDP Y GTP) Y  
POSEEN ACTIVIDAD INTRINSECA GTP.

TIENEN UN PAPEL CENTRAL EN LA TRANSDUCCION Y TRAFICO DE SEÑALES  
INTRACELULARES EN RESPUESTA S LA ACTIVACION GPCR.

# DESENSIBILIZACION Y TAQUIFILAXIA

---

**DESENSIBILIZACION Y TAQUIFILAXIA:** A MENUDO EL EFECTO DE UN FARMACO DISMINUYE GRADUALMENTE CUANDO SE ADMINISTRA DE FORMA CONTINUA O REPETIDA. ES UN FENOMENO QUE APARECE EN CUESTION DE SEGUNDOS.

**TOLERANCIA:** SE UTILIZA PARA DEFINIR A UNA REDUCCION MAS GRADUAL DE LA RESPUESTA DE UN FARMACO, QUE TARDA DIAS, SEMANAS O MESES EN APARECER.

**RESISTENCIA FARMACOLOGICA:** SE REFIERE A LA PERDIDA DE EFICACIA DE LOS ANTIBIOTICOS O ANTITUMORALES.

ESTOS TIPOS DE FENOMENOS PUEDEN DEBERSE A DISTINTOS MECANISMOS:

- \* ALTERACION DE LOS RECEPTORES.
- \* PERDIDA DE RECEPTORES.
- \* AGOTAMIENTO DE LOS MEDIADORES.
- \* AUMENTO DE LA DEGRADACION METABOLICA
- \* ADAPTACION FISIOLÓGICA.