

RECEPTORES FARMACOLÓGICOS

Dr. Adolfo Peña

RECEPTORES FARMACOLÓGICOS

Son sitios moleculares específicos situados en la membrana plasmática de las células efectoras a los que se unen las drogas para estimularlos o bloquearlos

RECEPTORES FARMACOLÓGICOS

droga



receptor

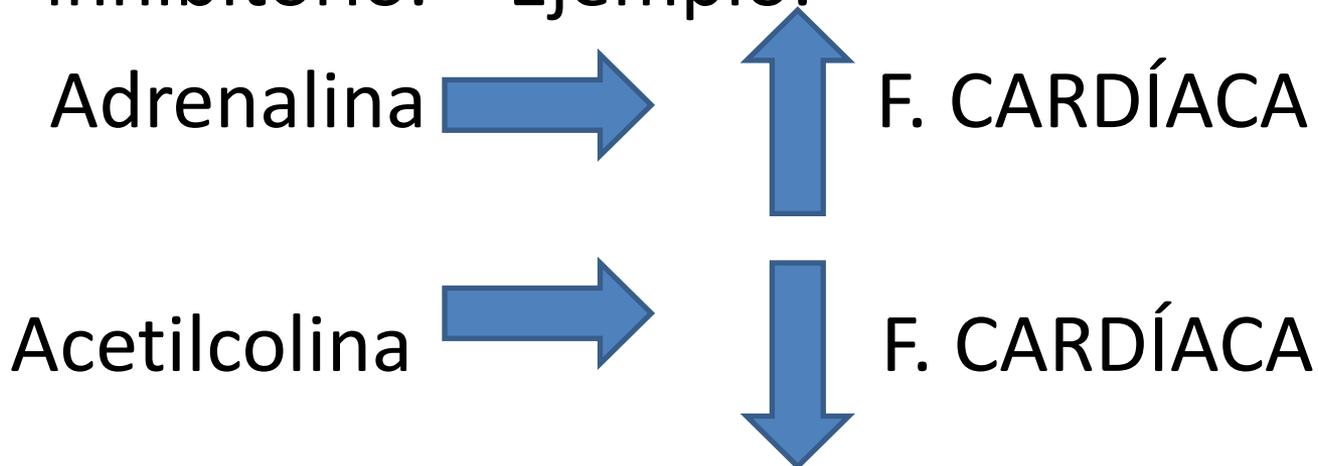


RECEPTORES FARMACOLÓGICOS



DROGA AGONISTA

Es la droga capaz de unirse al receptor e interactuar con él, produciendo una cadena de reacciones que lleven al efecto biológico deseado, que puede ser estimulante o inhibitorio. Ejemplo:

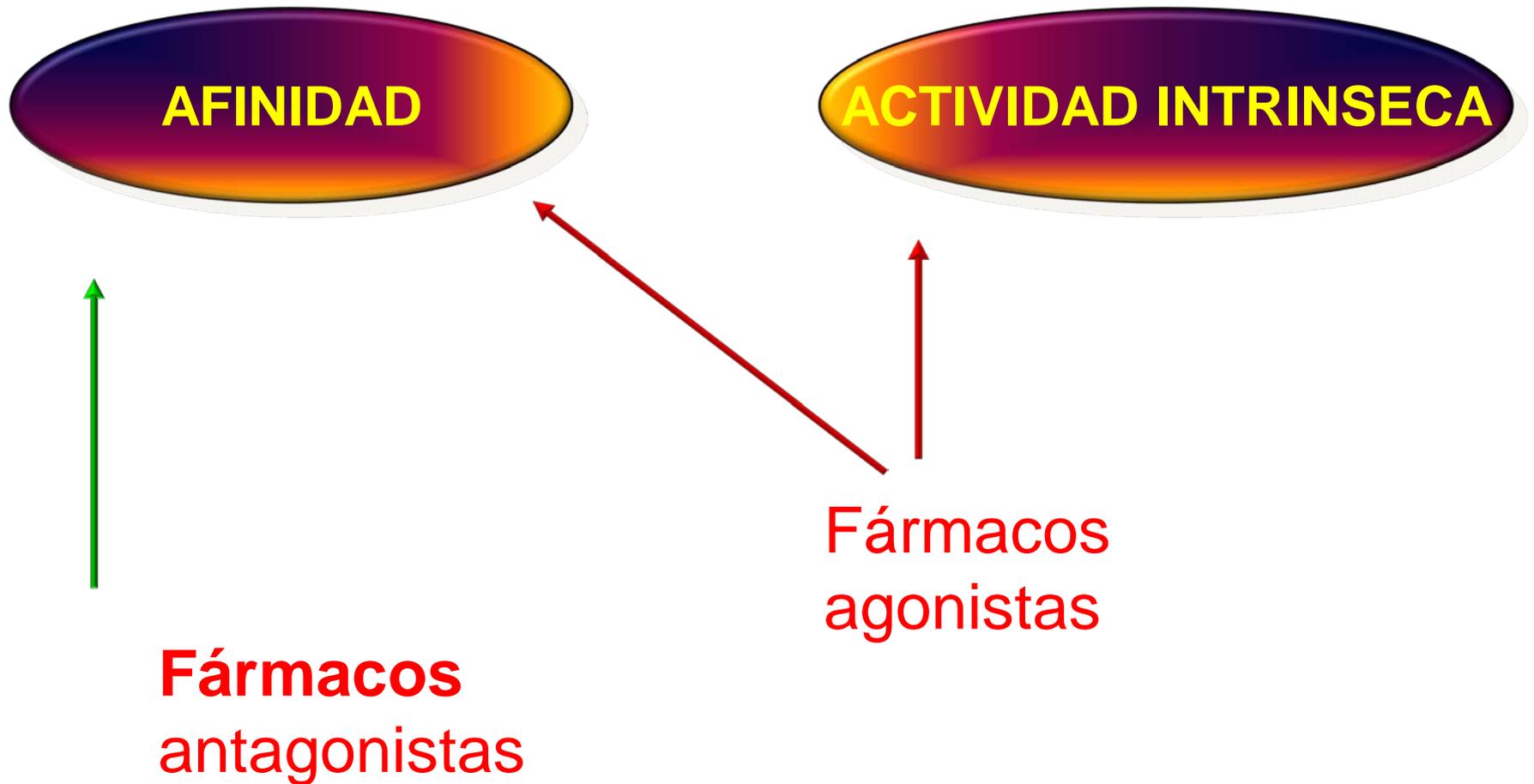


DROGA AGONISTA

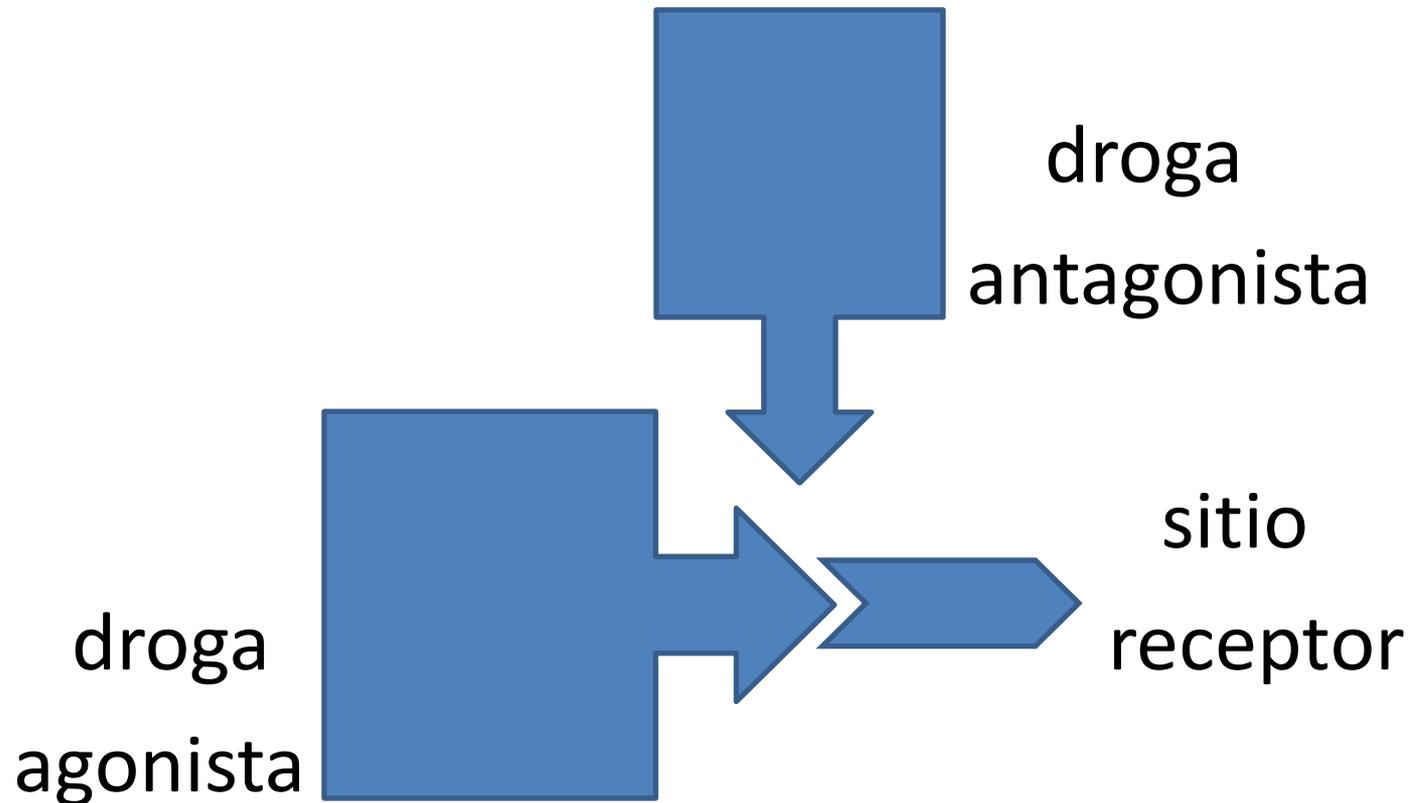
CARACTERÍSTICAS

1. **AFINIDAD:** Capacidad de la droga para formar el complejo con el receptor
2. **ACTIVIDAD INTRÍNSECA :** Efectividad de la droga para desencadenar las reacciones que lleven al efecto farmacológico

Propiedades fundamentales de los fármacos



RECEPTORES FARMACOLÓGICOS



DROGA ANTAGONISTA

Es aquella que a través de diferentes mecanismos es capaz de impedir la acción de una droga agonista.

Tiene afinidad pero carece de actividad intrínseca.

BLOQUEA la respuesta de la droga agonista

TIPOS DE ANTAGONISMOS

ANTAGONISMO QUÍMICO: Se produce por neutralización de cargas

ANTAGONISMO FISIOLÓGICO: Las drogas poseen acciones farmacológicamente opuestas actuando sobre diferentes sitios receptores

ANTAGONISMO FARMACOLÓGICO: Las drogas poseen acciones farmacológicamente opuestas actuando sobre el mismo sitio receptor

Diferentes tipos de Antagonismo

Antagonismo Químico

Neutralización de cargas
Ej. Heparina y
Sulfato de protamina

Antagonismo Fisiológico

Dos agonistas en
diferentes receptores
-Histamina y
Salbutamol

Antagonismo Farmacológico:

- Competitivo
- No competitivo

Agonista y antagonista en el
mismo receptor
Ej: Salbutamol y propranolol β_2

CLASIFICACIÓN DE RECEPTORES

RECEPTORES ADRENÉRGICOS

ALFA-----alfa 1, alfa 2

BETA-----beta 1, beta 2, beta 3

DOPAMINÉRBICOS----D1, D2, D3, D4, D5

CLASIFICACIÓN DE RECEPTORES

RECEPTORES COLINÉRGICOS

MUSCARÍNICOS-----M1, M2, M3

NICOTÍNICOS----- Ng, Nm

CLASIFICACIÓN DE RECEPTORES

RECEPTORES PARA AUTACOIDES

HISTAMINÉRGICOS----- H-1, H-2, H-3

SEROTONINÉRGICOS----- 5-HT (1 a 7)

PARA: Angiotensina, Kininas, Prostaglandinas, Leucotrienos, Endotelinas, Vasopresina

CLASIFICACIÓN DE RECEPTORES

RECEPTORES PARA OPIOIDES

Mu (μ) (1, 2)

Kappa (K) (1,2,3)

Delta (δ) (1,2)

CLASIFICACIÓN DE RECEPTORES

RECEPTORES PURINÉRGICOS

Adenosina (A1, A2, A3, A4)

ATP

UTP

ADP

CLASIFICACIÓN DE RECEPTORES

De Neurotransmisores centrales aminoacídicos

Glutamato y aspartato

Ácido gammaaminobutírico

Glicina

CLASIFICACIÓN DE RECEPTORES

RECEPTORES PARA HORMONAS

Hipotalámicas, Hipofisarias, Insulina, Glucagón,
Glucocorticoides, Mineralocorticoides,
Andrógenos, Estrógenos, Progesterona

RECEPTORES ADRENÉRGICOS (ALFA)

RECEPTOR	AGONISTA	ANTAGONISTA	ACCION
ALFA 1	Metoxamina Fenilefrina Nafazolina	Prazosina Doxazosina Terazosina	Contr. M.Liso Ino + Dism edema mucosa nasal
ALFA 2	Alfa metil NA Clonidina	Yohimbina	Inh. lib. de NA y Ach Inh. lib renina
ALFA1+ALFA2	Ad, NA,	Fentolamina Butirofenonas Fentolaminas	Contr esfínter Contr uréter Vasoconstr.

RECEPTORES ADRENÉRGICOS (BETA)

RECEPTOR	AGONISTA	ANTAGONISTA	ACCIONES
BETA 1	Dobutamina	Atenolol Metoprolol Practolol	Ino+, Crono+, Dromo+, Batmo+
BETA 2	Salbutamol Fenoterol Rimiterol Terbutalina	Butoxamina	Vasod MuscE Broncodilat. Relajac. Uter. Lib. Insulina
Beta1+Beta2	Adrenalina Isoproterenol	Propranolol Labetalol Timolol	Crono+ Broncodilat.

APLICACIONES TERAPÉUTICAS

Agonistas adrenérgicos

SUSTANCIA	PATOLOGÍA	ACCIÓN
Dobutamina(ag B1)	Shock cardiogénico	Inotropismo +
Fenoterol (ag B2)	Amenaza de aborto	Dism Contrac .Uter.
Adrenalina(ag alfa)	Shock anafiláctico	Vasoconstricción
Clonidina (ag alfa2)	H.T.A.	Est. Rec postsin inh
Fenilefrina(ag alfa1)	Examen fondo ojo	Contr. M. radial iris
Salbutamol (ag B2)	Asma Bronquial	Broncodilatación

APLICACIONES TERAPÉUTICAS

Antagonistas adrenérgicos

SUSTANCIA	PATOLOGÍA	ACCIÓN
Doxazosina(antag. Alfa 1)	Hiperplasia prostática benigna	Relajación m. liso en uretra
Labetalol (antag.alfa 1)	H.T.A.	Vasodilatación
Propranolol (antag.B)	H.T.A.	Crono –
Atenolol (Antag.B1)	Angina	Dism. consumo O2

RECEPTORES DOPAMINERGICOS

RECEPTOR	AGONISTAS	ANTAGONISTAS
D1, D2, D3, D4, D5	Dopamina Ergotamina	Fenotiacinas (Clorpromazina) Butirofenonas (Haloperidol, Droperidol) Bromocriptina

APLICACIONES TERAPÉUTICAS

RECEPTORES DOPAMINÉRGICOS

RECEPTOR	AGONISTAS	ANTAGONISTAS
D-2	Bromocriptina	Metoclopramida Domperidona Fenotiazinas Butirofenonas

APLICACIONES TERAPÉUTICAS

RECEPTORES DOPAMINERGICOS

Dopamina  ENFERMEDAD
DE PARKINSON

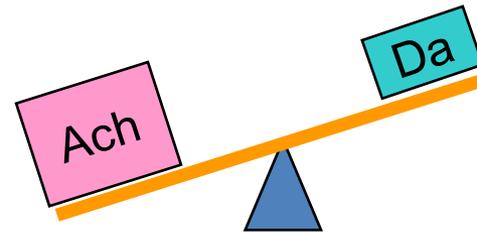
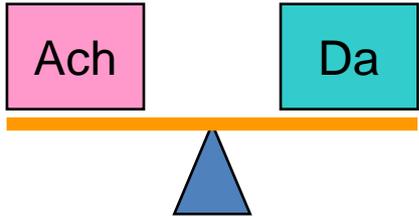
Dopamina  SHOCK E INSUF CARD(Vasod.
renal para aumentar diuresis)

Importancia clínica Rec. D₂

Normal

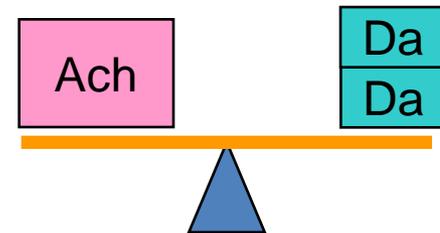
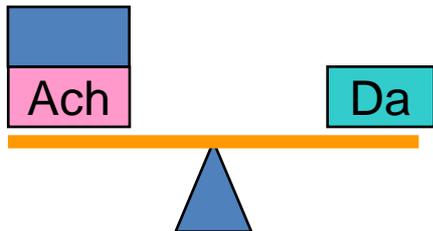
Enfermedad de Parkinson

Ganglios
basales



Anticolinérgicos

Agonistas



APLICACIONES TERAPÉUTICAS

RECEPTORES DOPAMINERGICOS

- Fenotiazinas  PSICOSIS (Est.D-2 en Sistema Límbico)
- Fenotiazinas  VOMITOS (Est. D-2 en ZQDEB)
- Fenotiazinas  **PUEDEN PROVOCAR PARKINSON**

RECEPTORES COLINÉRGICOS

RECEPTOR	AGONISTA	ANTAGONISTA	ACCIONES
Muscarínicos	Acetilcolina Carbacol	Atropina, Escopolamina Homatropina Propantelina Trihexifenidilo	Contr M.liso Dism. F.Card Dism. T.A. Aumenta las secreciones
M1	Pilocarpina Muscarina	Pirenzepina	idem
M2	Betanecol	-	idem
M3	-	-	Contr M.liso Aum. Secrec.
Nicotínicos	Acetilcolina Carbacol	D-tubocurarina Propantelina	-
G. Autónomo	-	Trimetafán Mecamilamina	Trans.Gangl.
PlacaN-Musc	Nicotina	Pancuronio Vecuronio	Contrac. Musc. Esq.

RECEPTORES COLINÉRGICOS

RECEPTOR	AGONISTA	ANTAGONISTA	ACCIONES
Nicotínicos	Acetilcolina Carbacol	D-tubocurarina Propantelina	-
G. Autónomo	-	Trimetafán Mecamilamina	Trans.Gangl.
PlacaN-Musc	Nicotina	Pancuronio Vecuronio	Contrac. Musc. Esq.

APLICACIONES TERAPÉUTICAS

RECEPTORES COLINÉRGICOS

SUSTANCIA	PATOLOGÍA	ACCIÓN
Propantelina(antag. inespecífico)	Úlcera péptica	Dism. secrec. gastr.
Trihexifenidilo (antag muscarínico)	Enfermedad de Parkinson	Anticolinérgica
Atropina (antag. muscarínico)	Diarreas	Dism. Contracción intestinal
Pilocarpina(ag. M3)	Glaucoma	Contrae esfínter pupilar
Trimetafán (antag. Nicotínico G.Aut.)	H.T.A	Interrumpe transm. ganglionar
Betanecol (ag. M1y3)	Ileo paralítico y Atonía vesical	Aumenta peristaltismo y Relaja Esfínteres tubo digestivo

APLICACIONES TERAPÉUTICAS

RECEPTORES COLINÉRGICOS

Pilocarpina(ag. M1)	Glaucoma	Contrae esfínter pupilar
Trimetafán (antag. Nicotínico G.Aut.)	H.T.A	Interrumpe transm. ganglionar
Betanecol (ag. M1 yM3)	Ileo paralítico y Atonía vesical	Aumenta peristaltismo y Relaja Esfínteres tubo digestivo
Pancuronio	ACTO QUIRÚRGICO	Relaja Musc. Esq.

RECEPTORES HISTAMINERGICOS

RECEPTOR	AGONISTA	ANTAGONISTA	ACCIONES
H-1	Histamina	Difenhidramina Dimenhidrinato Meclizina	Aum. perm. Capilar Aum. secrec Bronquiales Broncocons.
H-2	Histamina	Cimetidina Ranitidina Famotidina	Aumenta Secreciones gástricas