

1.4- MEC. ACCIÓN / EFEC. FARMACOLÓGICOS

CONCEPTOS IMPORTANTES

¿QUÉ ES UN MECANISMO DE ACCIÓN?

Es el conjunto de procesos bioquímicos que transcurren en el organismo para dar lugar a una respuesta farmacológica y terapéutica o tóxica en el paciente

→ Efecto farmacológico: -Efecto tóxico
-Efecto terapéutico
-Efecto adverso

¿QUÉ TIPOS DE MECANISMOS DE ACCIÓN HAY?

Existen muchos tipos de mecanismos de acción:

- Unión fármaco-proteínas diana (mayoría de los casos)
- Reacción físico-química directa
- Modificación de gen o interacción con ADN
- Otros: algunos fármacos novedosos como terapias celulares

¿QUÉ ES UNA DIANA FARMACOLÓGICA?

Una diana farmacológica es una molécula o una estructura del organismo con la que el fármaco tiene que interaccionar para producir un efecto en el organismo

Las dianas farmacológicas pueden ser químicamente **proteínas, lípidos, ADN** u **otro** tipo de **moléculas**

La mayoría de fármacos actúan a través de dianas que llamamos **RECEPTORES**, pero no son las únicas

Los fármacos que no actúan a través de dianas se llaman **FÁRMACOS DE ACCIÓN INESPECÍFICA**. Ej: bicarbonato

MOLÉCULAS DIANA PARA LA ACCIÓN DE FÁRMACOS

RECEPTORES

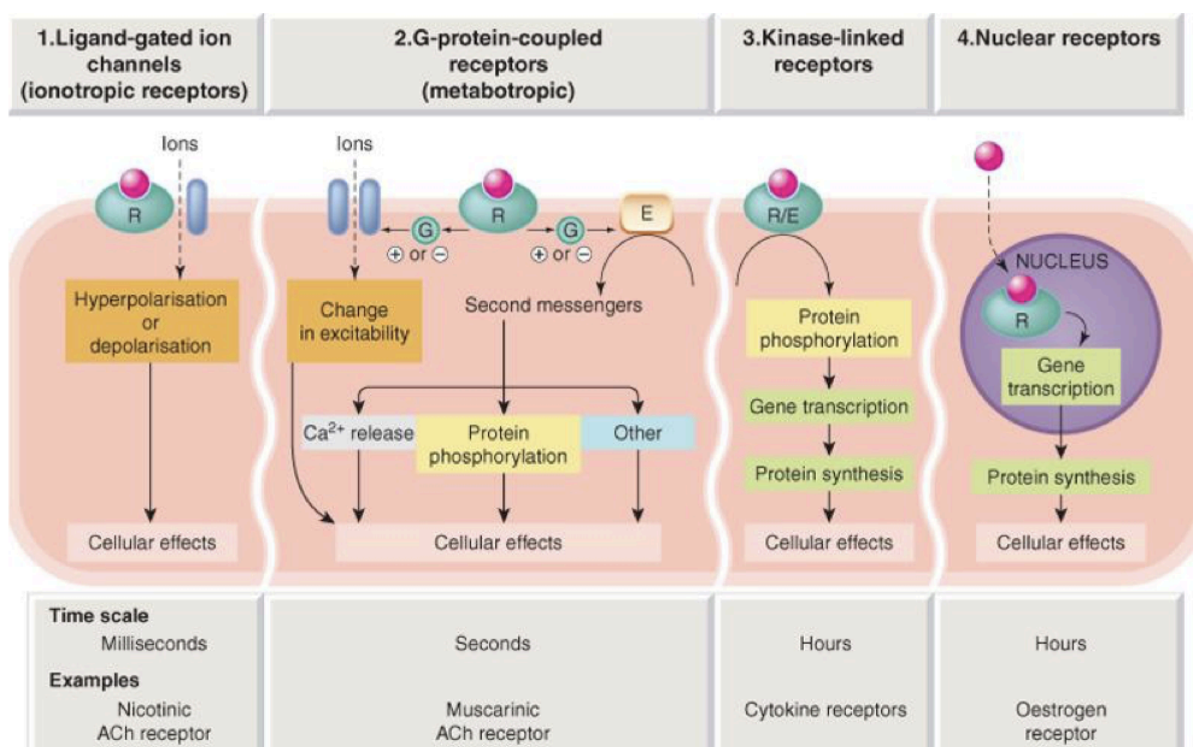
Macromoléculas celulares de origen proteico encargadas de la señalización química

Pueden estar en:

- La membrana plasmática
- Intracelulares (ej: receptores nucleares)

Hay muchos tipos de receptores: asociados a canales iónicos asociados a proteína G, receptores dependientes de kinasas, receptores nucleares

Ej: **Receptor nicotínico de acetilcolina**



CANALES IÓNICOS DEPENDIENTES DE VOLTAJE

Estructuras proteicas que atraviesan la membrana plasmática a modo de poros permitiendo el flujo selectivo y rápido de iones a favor de gradiente químico y eléctrico

Tipos de iones: Na⁺, Ca²⁺, K⁺, Cl⁻

Se abren en respuesta a cambios en potencial de membrana

Ej: mecanismos de fármacos en **canales de Na⁺**

ENZIMAS

Son proteínas que intervienen en la transformación de productos endógenos del cuerpo o de agentes patógenos pero también:

- Ayudan a transportar sustancias químicas vitales
- Regulan la velocidad de las reacciones químicas

Una de las enzimas clave en los procesos fisiológicos de la inflamación es la Ciclooxygenasa (COX)

MOLÉCULAS TRANSPORTADORAS

Estructuras macromoleculares fundamentalmente proteicas que permiten el paso de solutos en contra de gradiente entre los compartimentos celulares

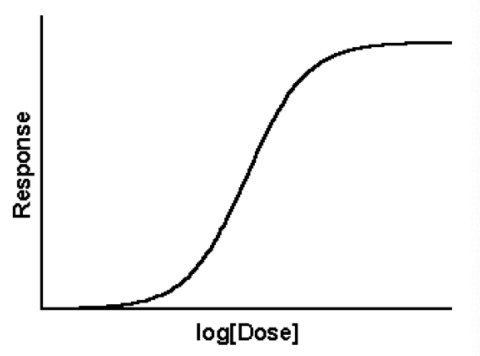
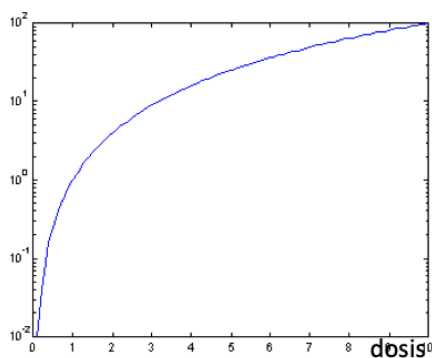
Ej: bomba de protones de las células parietales del estómago

ACCIÓN DEL EFECTO FARMACOLÓGICO

¿CÓMO ES LA REPRESENTACIÓN GRÁFICA?

Las **curva dosis-respuesta** representan el incremento del efecto al incrementar la dosis

efecto



Las representaciones semilogarítmicas permiten obtener más definición

Estas representaciones permiten obtener la DE_{50} que es la dosis de fármaco que produce el 50% del efecto farmacológico

CONCEPTOS QUE DESCRIBEN EL EFECTO FARMACOLÓGICO

Eficacia: hace referencia a obtener resultados beneficiosos en condiciones ideales

Potencial: hace referencia al efecto conseguido con la menor dosis. Para saber qué fármaco es más potente se emplea como referencia la DE_{50}

Margen terapéutico: intervalo de dosis comprendido entre la más baja y la más alta con efecto terapéutico

Afinidad y actividad intrínseca: definen el comportamiento del fármaco con su receptor

TIPO FÁRMACO	AFINIDAD	ACT. INTRÍNSECA	EFFECTO FARMACOLÓGICO
Agonista	+	Máxima	Sí
Antagonista	+	Nula	“SI” (el efecto es contrario a la activación del receptor)
Agonista parcial	+	Parcial	Una fracción del máximo