

 UNIVERSIDADE  
FEDERAL DE JUIZ DE FORA

# Farmacodinâmica

Prof. Herval de Lacerda Bonfante

 Roteiro da aula

- Definição de Farmacodinâmica
- Conhecimento dos aspectos relacionados aos efeitos dos fármacos
- Estudo da interação fármaco e receptores
- Mensagem final – pontos importantes

 Farmacodinâmica

**LOCAL DE AÇÃO**

**MECANISMO DE AÇÃO**

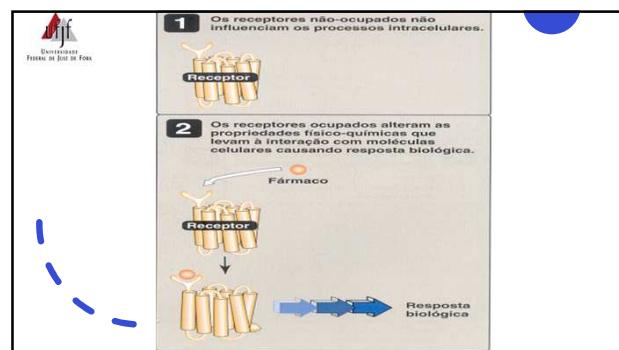
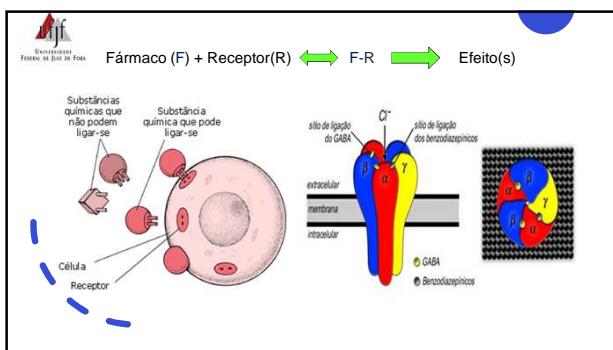
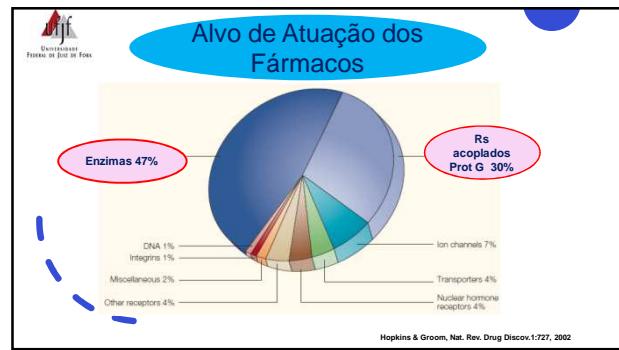
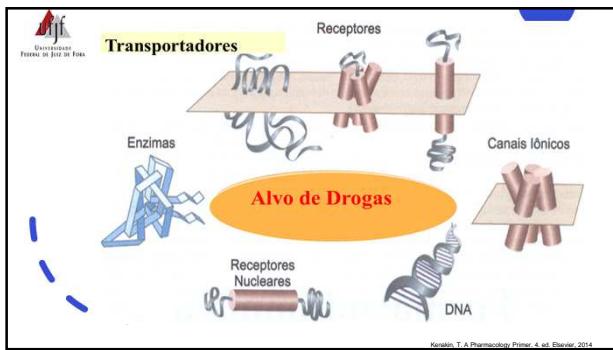
**EFEITOS**

 Farmacodinâmica

**Fármaco** → Princípio Ativo

**Receptor:** componente de uma célula  
interação com um fármaco  
início de uma cadeia de eventos bioquímicos  
efeitos observados do fármaco

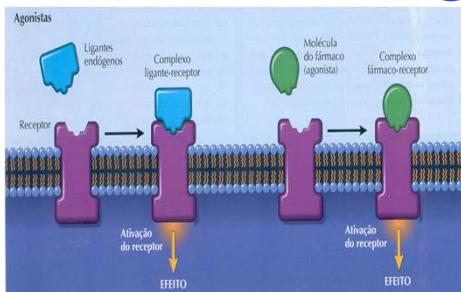
Droga (D) + Receptor (R)  $\longleftrightarrow$  D-R  $\longrightarrow$  Efeito(s)



## Agonistas e Antagonistas

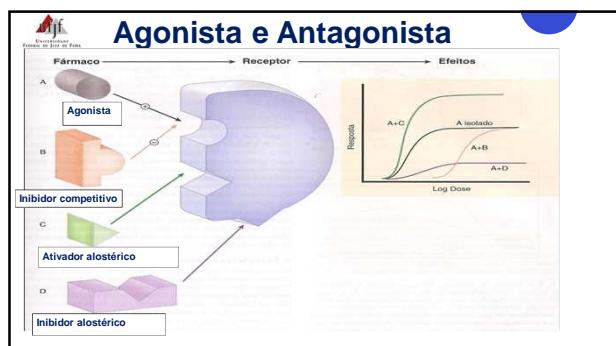
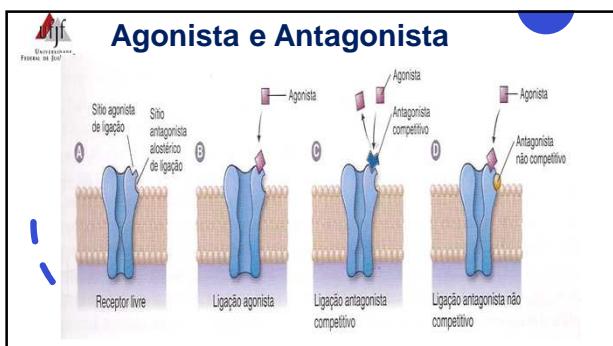
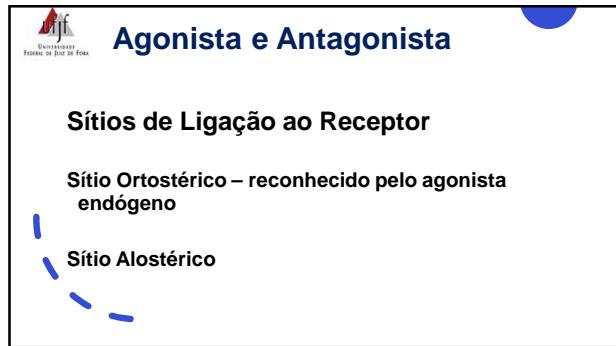
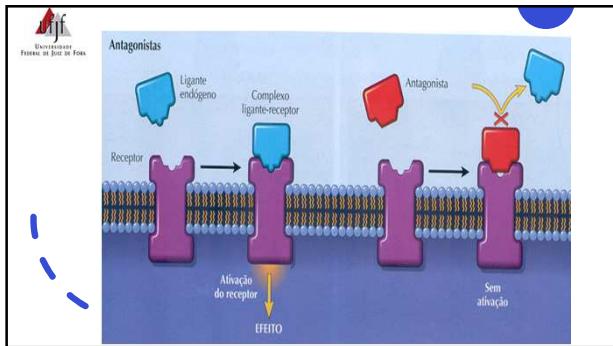
### Agonistas

Fármacos que se ligam aos receptores fisiológicos e simulam os efeitos reguladores dos compostos sinalizadores endógenos.



### Antagonistas

Fármacos que bloqueiam ou reduzem a ação de um agonista





## Fármaco Agonista e Antagonista

**Afinidade:** Favorabilidade de interação

**Atividade Intrínseca:** Resposta



## Fármaco Agonista e Antagonista

**Atividade Intrínseca (0 a 1)**

1 - Agonista total ou pleno

0,1 a 0,9 - Agonista parcial



## Fármaco Agonista e Antagonista

**Zero - Antagonista**



## Receptores – Modelo dos dois Estados

**Receptores forma ativa:  $R_a (R^*)$**

**Receptores forma inativa:  $R_i (R)$**

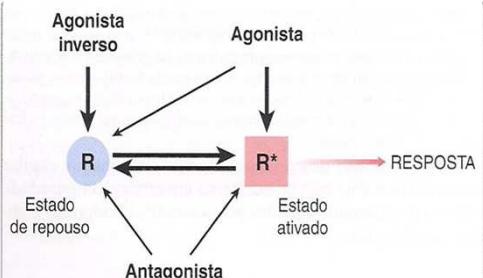


## Agonistas e Receptores

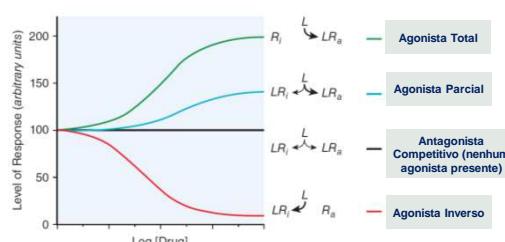
### Receptores constitutivamente ativos

### Conformação $R^*$ na ausência de ligantes

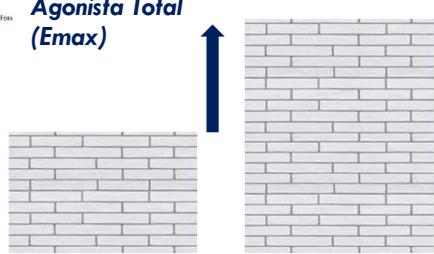
## Agonistas e Antagonistas



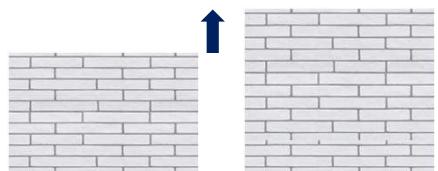
## Agonistas e Antagonista – Curvas LOG Concentração - Efeito



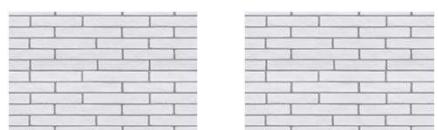
### Agonista Total (Emax)



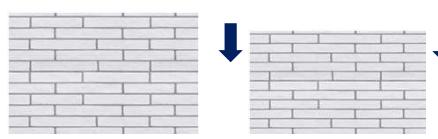
### Agonista Parcial



### Antagonista



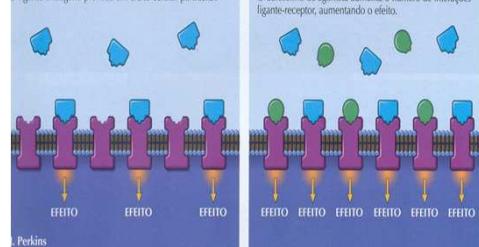
### Agonista Inverso

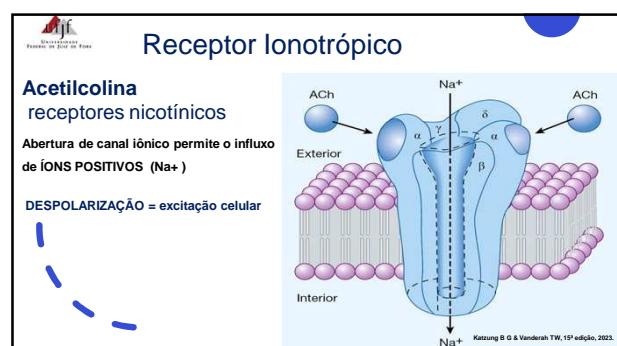
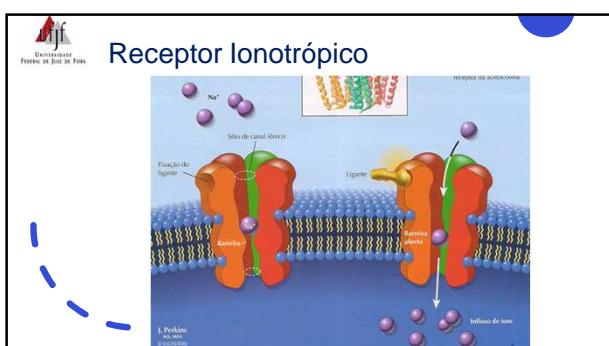
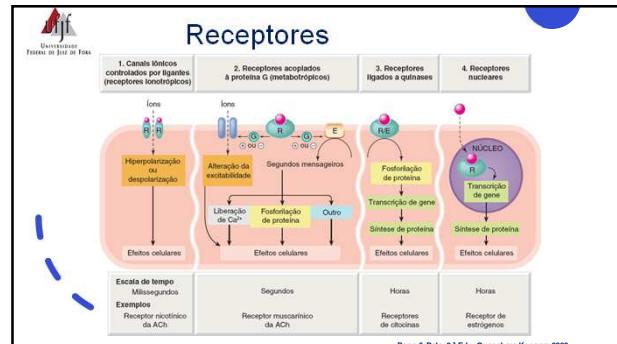
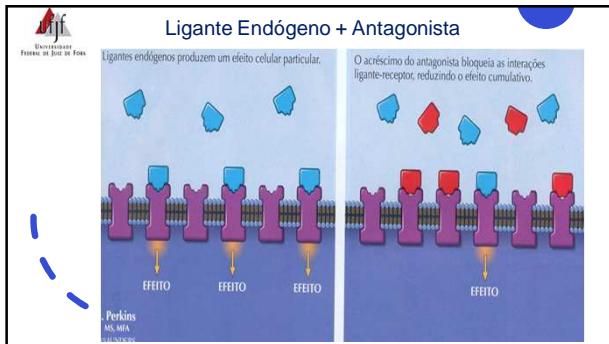


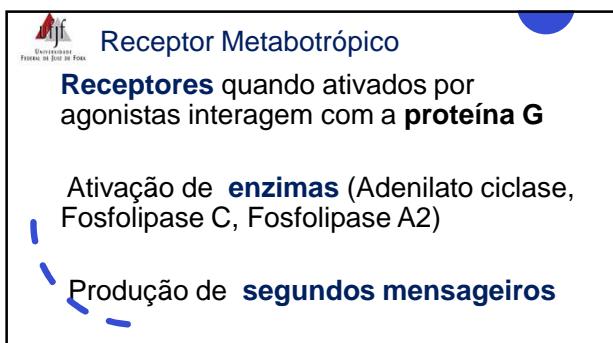
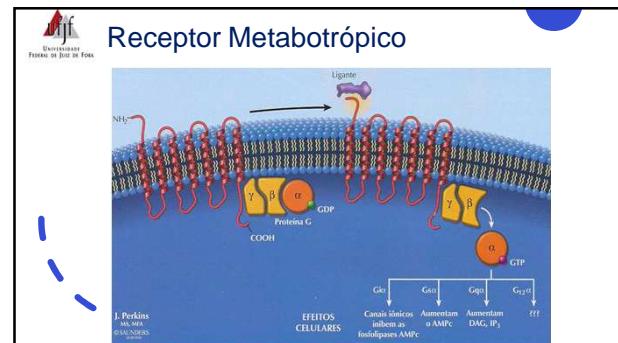
### Ligante Endógeno + Agonista

O ligante endógeno provoca um efeito celular particular.

O acréscimo de agonista aumenta o número de interações ligante-receptor, aumentando o efeito.









## Receptores de Reserva

Agonistas com grande eficácia podem produzir **efeito máximo** mesmo que poucos receptores sejam ocupados.

### Propriedades dos fármacos : Afinidade e Eficácia.

Emax não corresponde necessariamente a 100% ocupação dos receptores mas pode ocorrer após ocupação de uma pequena fração dos mesmos.



## Ciclo dos receptores

**Síntese** → retículo endoplasmático rugoso

Membrana plasmática

Aptos para acoplar com ligantes

Transdução de sinais

Internalização



## Dessensibilização e Tolerância

\***Síntese de menor número de receptores** (infraregulação).

\***Fosforilação de receptores.**

\***Internalização de receptores.**

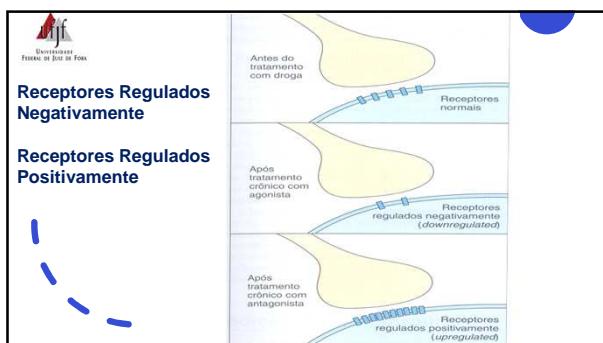
\***Depleção de mediadores.**

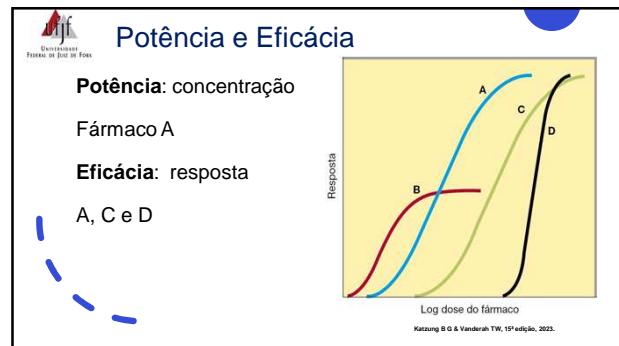
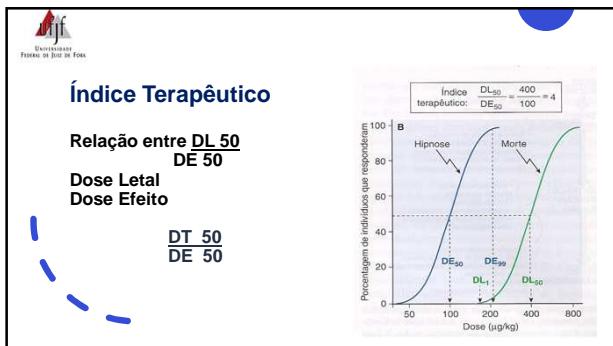
\***Adaptação fisiológica (resposta homeostática).**



### Receptores Regulados Negativamente

### Receptores Regulados Positivamente





**Mensagem Final – Pontos importantes**

Importância do estudo da farmacodinâmica para explicar mecanismo de ação e efeitos dos fármacos.

Processo de atuação dos agonistas e antagonistas.

Aspectos da interação fármaco e receptor.