

Appunti di Farmacologia

Emiliano Bruni (info@ebruni.it)

Questo articolo riassume con delle carte mnemoniche gli argomenti di farmacologia spiegati nel IV anno del corso di laurea in medicina e chirurgia a Chieti. L'uso di questo articolo non sostituisce la lettura e lo studio di un libro e degli appunti di farmacologia. Per errori, omissioni o altre note, non esitate a contattarmi via e-mail.

Indice

| | |
|--|-----------|
| I. Farmacocinetica | 3 |
| 1. Emivita | 3 |
| II. Flash Cards | 5 |
| 2. Farmaci del SNC e del SNP | 5 |
| 2.1. Acetilcolina | 5 |
| 2.1.1. Agonisti colinergici | 7 |
| 2.1.2. Antagonisti colinergici | 8 |
| 2.2. Noradrenalina | 11 |
| 2.2.1. Simpaticomimetici | 12 |
| 2.2.2. Inibitori dei recettori adrenergici | 16 |
| 2.3. Dopamina | 17 |
| 2.4. Serotonina | 18 |
| 2.5. Neurotrasmettitori purinici | 18 |
| 2.6. Monossido d'azoto (NO) | 18 |
| 3. Farmaci del sistema cardiovascolare e renale | 20 |
| 3.1. Farmaci anti-ipertensivi | 20 |
| 3.2. Farmaci nell'angina e infarto cardiaco | 21 |
| 3.2.1. Nitrati organici | 22 |
| 3.2.2. Calcio antagonisti | 23 |
| 3.2.3. β -bloccanti | 23 |
| 3.3. Insufficienza cardiaca | 24 |
| 3.4. Aritmie Cardiache | 26 |
| 4. Farmaci dell'emostasi | 30 |

Parte I.

Farmacocinetica

1. Emivita

L'emivita di un farmaco è definita come il tempo necessario a ridurre il farmaco a $1/2$ della quantità di farmaco presente nell'organismo allo steady-state.

Presupponendo che la quantità di farmaco nell'organismo abbia un andamento esponenziale decrescente con il tempo, si può definire questo matematicamente come:

$$Q(t) = \alpha e^{-\beta t}$$

Per trovare i due parametri α e β consideriamo che a $t = 0$ $Q(0) = Q_{\text{TOT}} = \alpha$ e quindi l'equazione sopra si può scrivere come

$$Q(t) = Q_{\text{TOT}} e^{-\beta t}$$

e d'altra parte se consideriamo la velocità di eliminazione del farmaco al tempo t si ha che

$$-\frac{dQ(t)}{dt} = v_{\text{elim}}(t) = -Q_{\text{TOT}}(-\beta)e^{-\beta t}$$

Ma d'altra parte, per definizione

$$CL = \frac{v_{\text{ELIM}}^{\text{STEADY STATE}}}{c^{\text{STEADY STATE}}} = \frac{v_{\text{ELIM}}(0)}{c(0)}$$

e, a $t = 0 \Rightarrow v_{\text{elim}}(0) = CL \cdot c(0) = -Q_{\text{TOT}}(-\beta)$ da cui $\beta = \frac{CL \cdot c(0)}{Q_{\text{TOT}}}$ ma

$$V_{\text{DIST}} = \frac{Q_{\text{TOT}}}{c(0)}$$

e quindi

$$\beta = \frac{CL \cdot \cancel{c(0)}}{V_{\text{DIST}} \cdot \cancel{c(0)}} \Rightarrow \beta = \frac{CL}{V_{\text{DIST}}} \text{ e quindi}$$

$$Q(t) = Q_{\text{TOT}} e^{-\frac{CL}{V_{\text{DIST}}} t}$$

$$\text{a } t = t_{1/2} \Rightarrow Q(t_{1/2}) = \frac{1}{2} Q_{\text{TOT}} = \cancel{Q_{\text{TOT}}} e^{-\frac{CL}{V_{\text{DIST}}} t_{1/2}}$$

e passando ai logaritmi naturali

$$\ln \frac{1}{2} = -\frac{CL}{V_{\text{DIST}}} t_{1/2} \Rightarrow t_{1/2} = \ln \frac{1}{2} \cdot \left(-\frac{V_{\text{DIST}}}{CL} \right) = \frac{\ln 2 \cdot V_{\text{DIST}}}{CL}$$

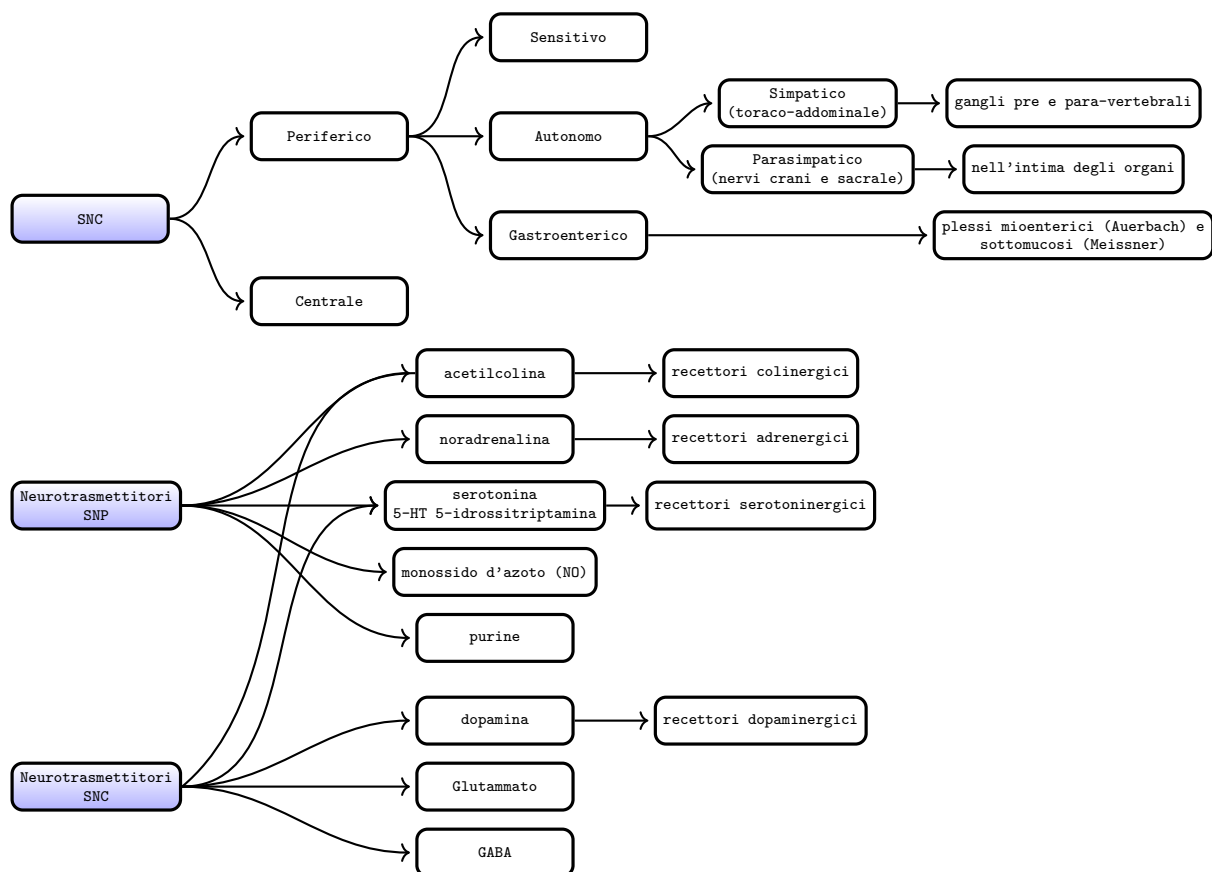
e quindi

$$t_{1/2} \simeq 0.7 \cdot \frac{V_{\text{DIST}}}{CL}$$

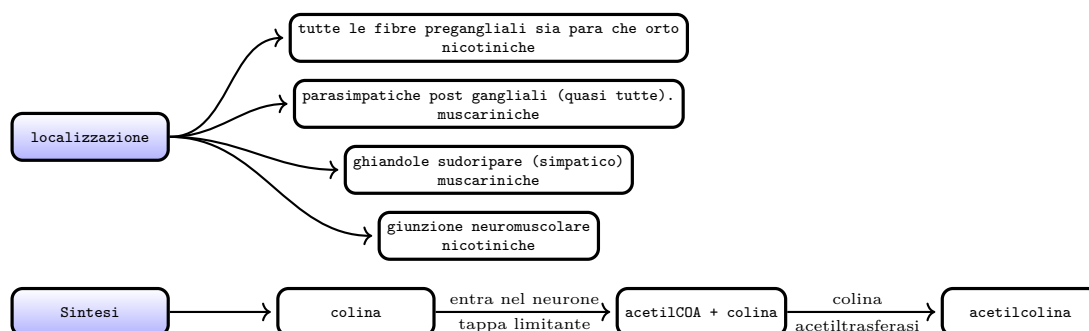
Parte II.

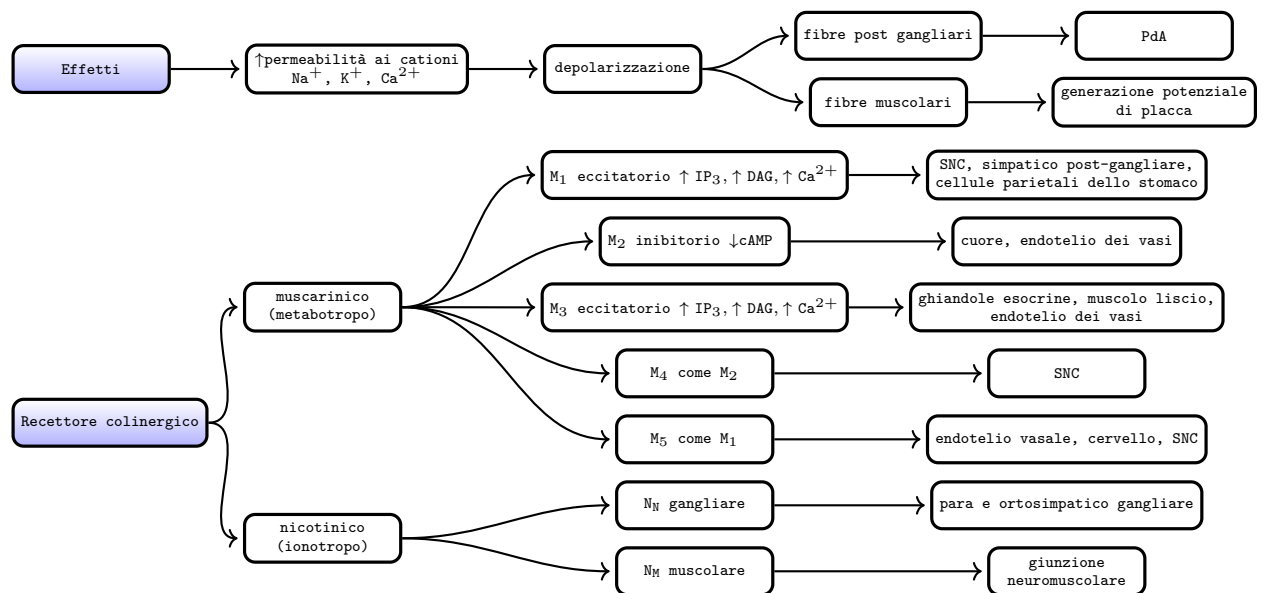
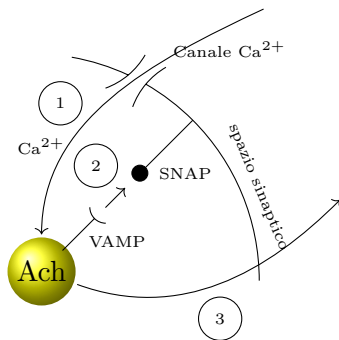
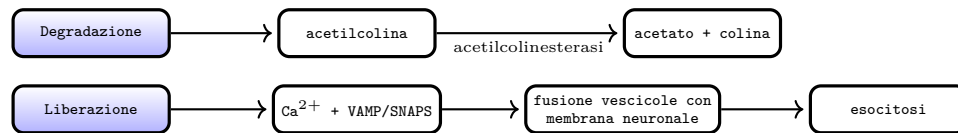
Flash Cards

2. Farmaci del SNC e del SNP

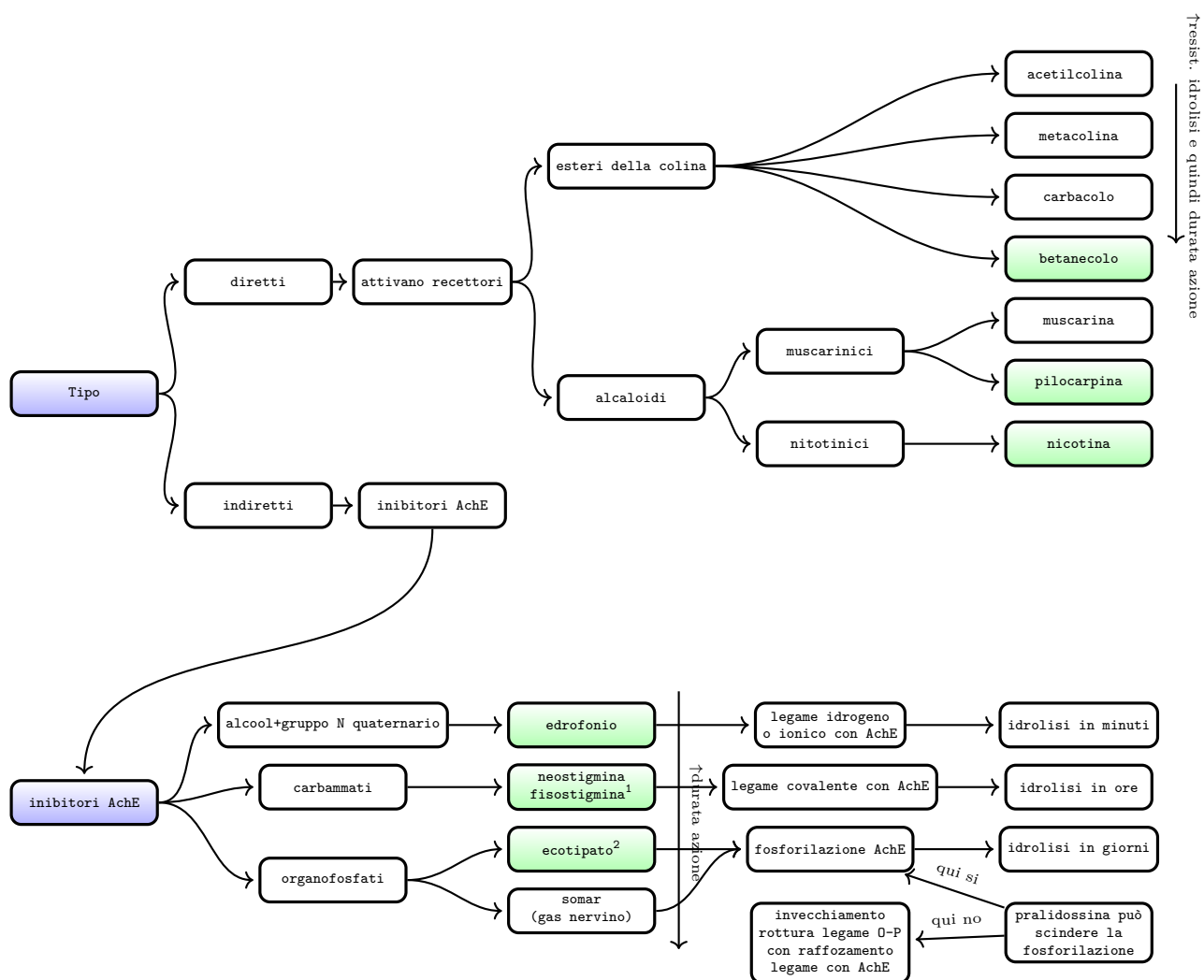


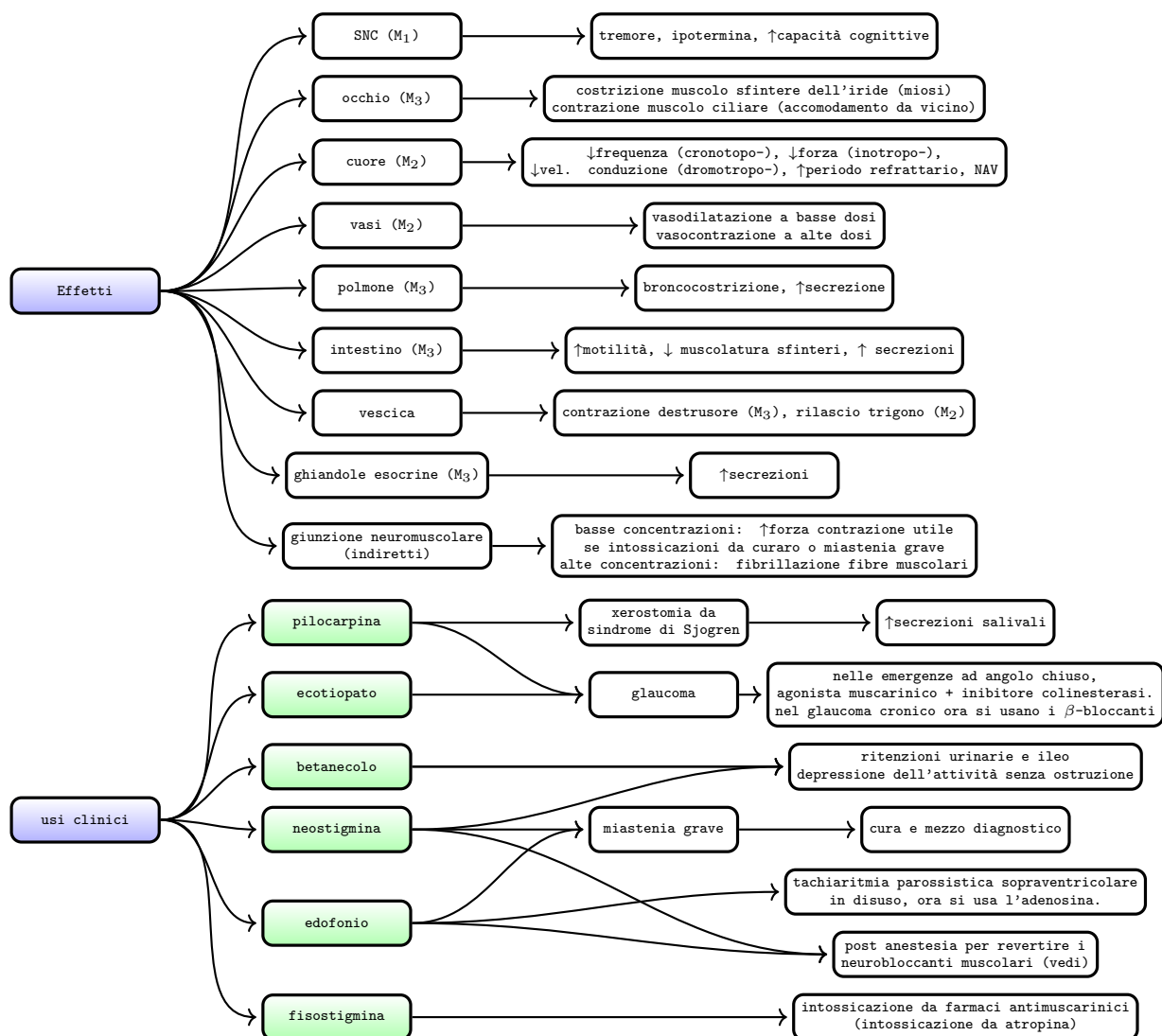
2.1. Acetilcolina



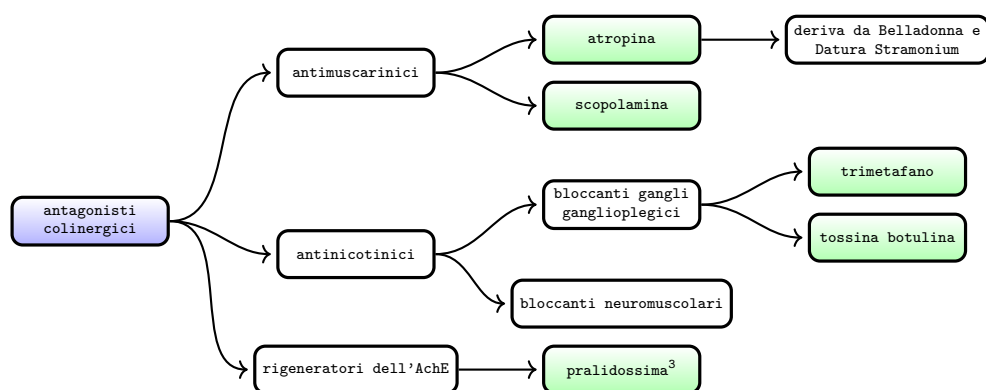


2.1.1. Agonisti colinergici

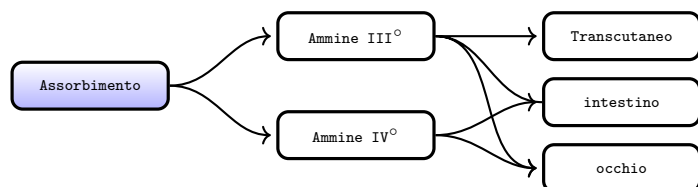
²Presente nella fava del Calabar²Unico degli organofosfati perchè altamente polare e può essere preparato come soluzione acquosa.
Era utilizzato per il glaucoma, ora in disuso.



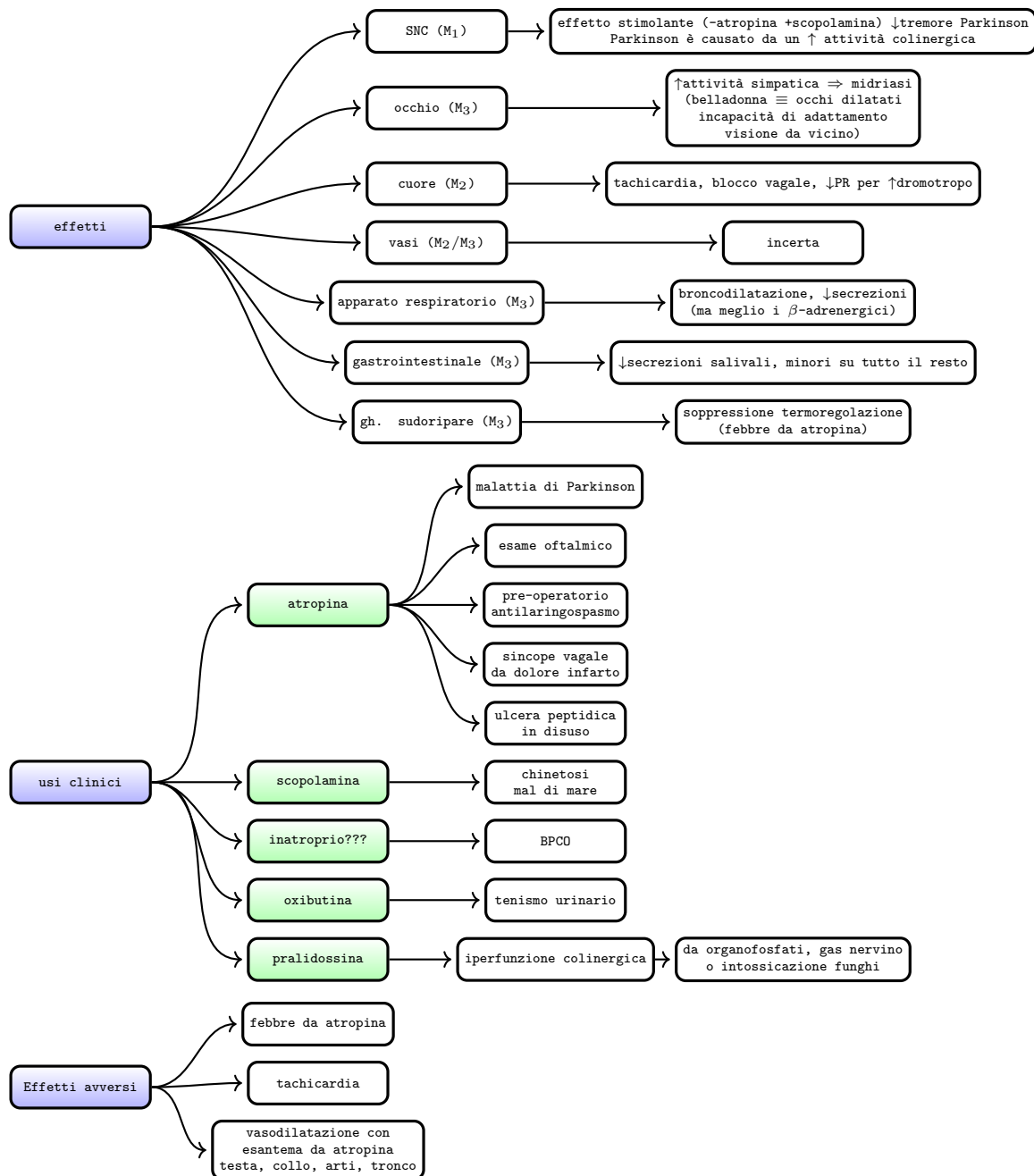
2.1.2. Antagonisti colinergici



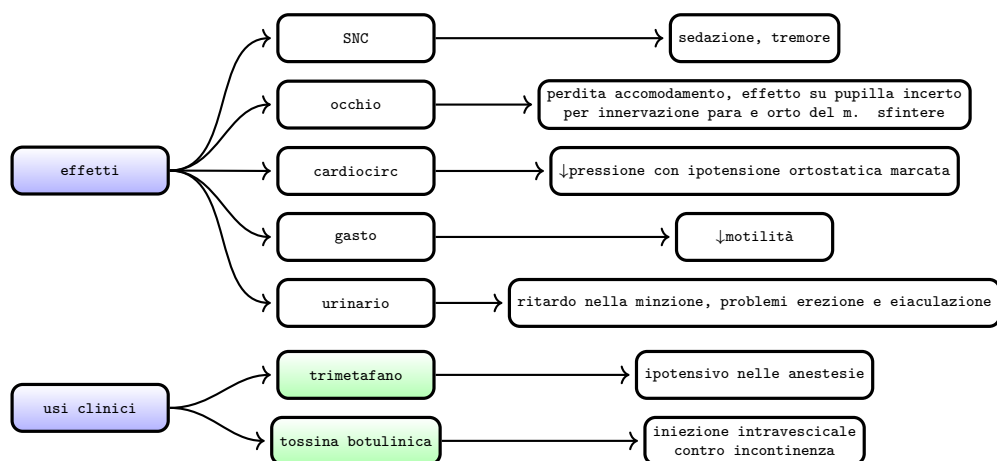
³vedi inibitori dell'AChE



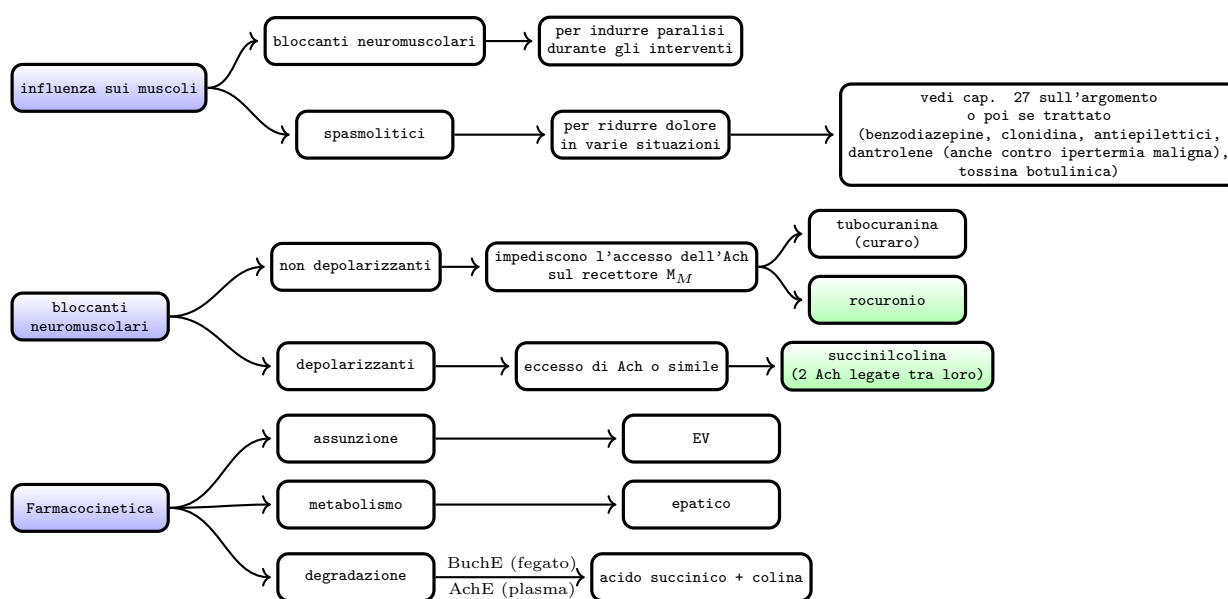
ANTIMUSCARINICI



GANGLIOPLEGICI

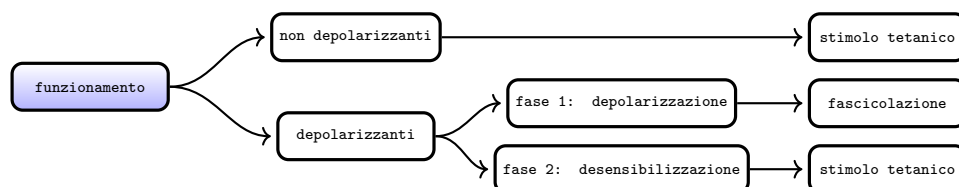


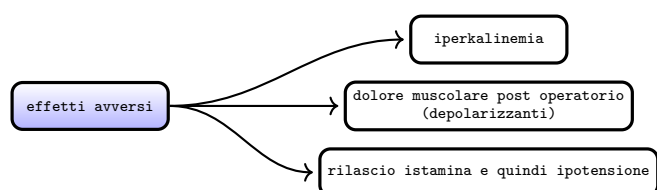
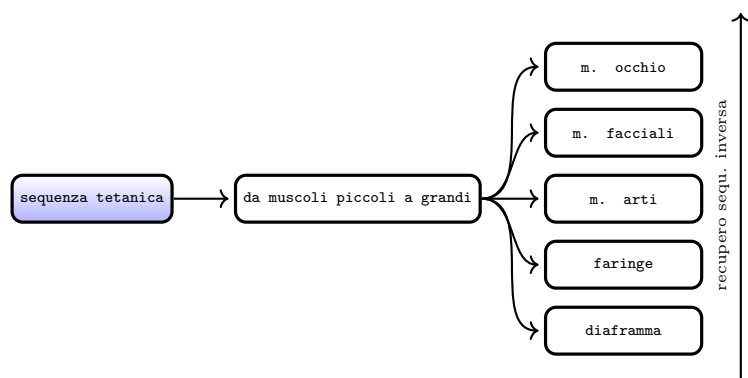
BLOCCANTI NEUROMUSCOLARI



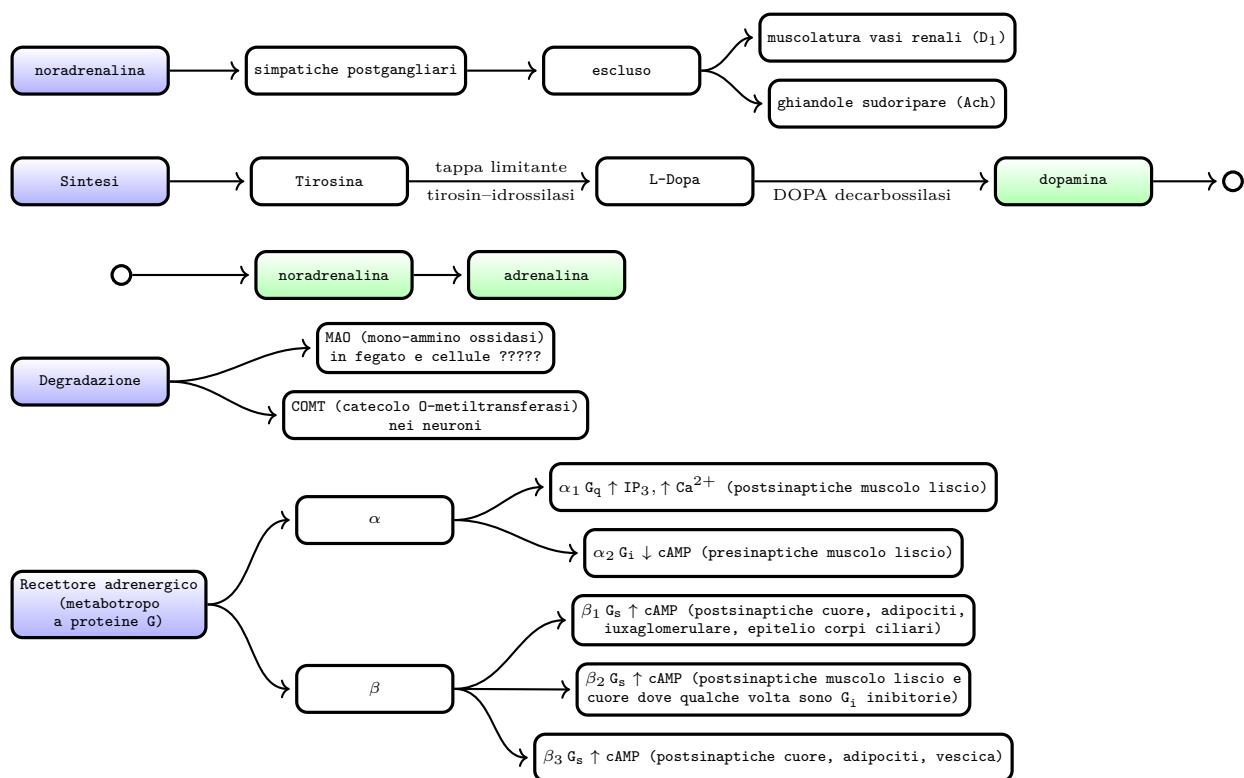
Una mutazione del gene che codifica la pseudocolinesterasi plasmatica rende alcuni pazienti più sensibili a metabolizzare la succinilcolina.

Il n. di dibucaina è un parametro per definire tali anomalie e dipende dal fatto che la dibucaina inibisce la pseudoAChE normale per l'80% mentre l'inibizione è solo del 20% in quella modificata.



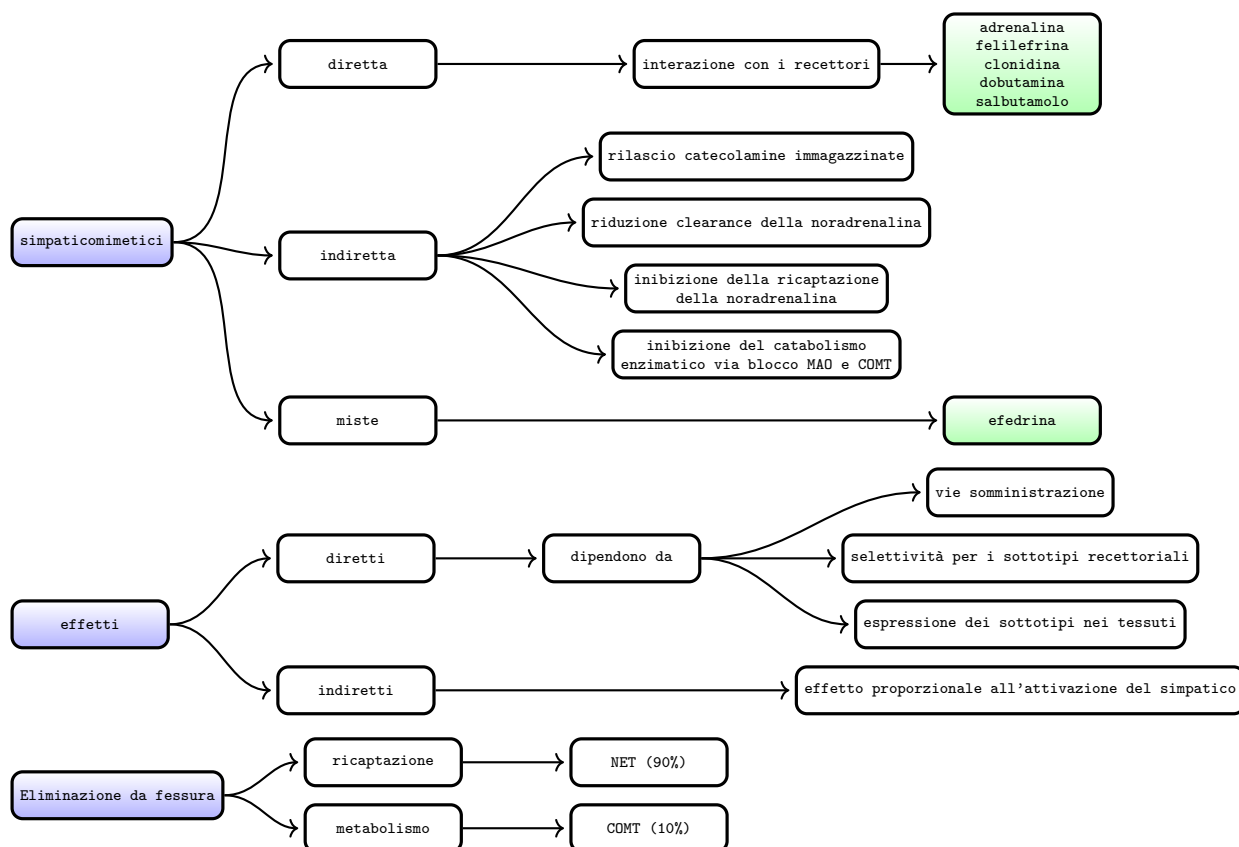


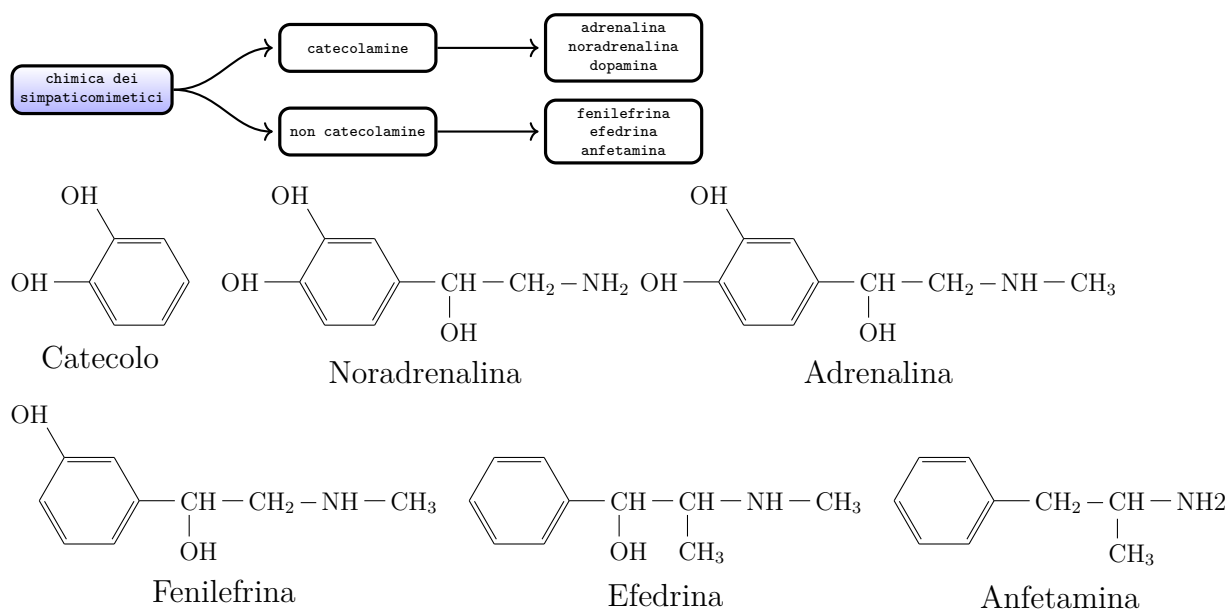
2.2. Noradrenalina



| Organo | Tipo | Recettore | Azione |
|----------------------------|---------------|-------------------|---------------------|
| M. radiale | simpatico | α_1 | costrizione |
| M. circolare | parasimpatico | M_3 | costrizione pupilla |
| M. ciliare | simpatico | β | rilasciamento |
| M. ciliare | parasimpatico | M_2 | contrazione |
| Nodo SA | simpatico | $\beta_1\beta_2$ | accelerazione |
| Nodo SA | parasimpatico | M_2 | rallentamento |
| Forza contrazione | simpatico | $\beta_1\beta_2$ | aumento |
| Forza contrazione | parasimpatico | M_2 | diminuzione |
| vasi muscolari | simpatico | β | rilasciamento |
| muscolo gastrointestinale | simpatico | $\alpha_2\beta_2$ | rilasciamento |
| muscolo gastrointestinale | parasimpatico | M_3 | contrazione |
| sfinteri gastrointestinali | simpatico | α_1 | contrazione |
| sfinteri gastrointestinali | parasimpatico | M_3 | rilasciamento |

2.2.1. Simpaticomimetici

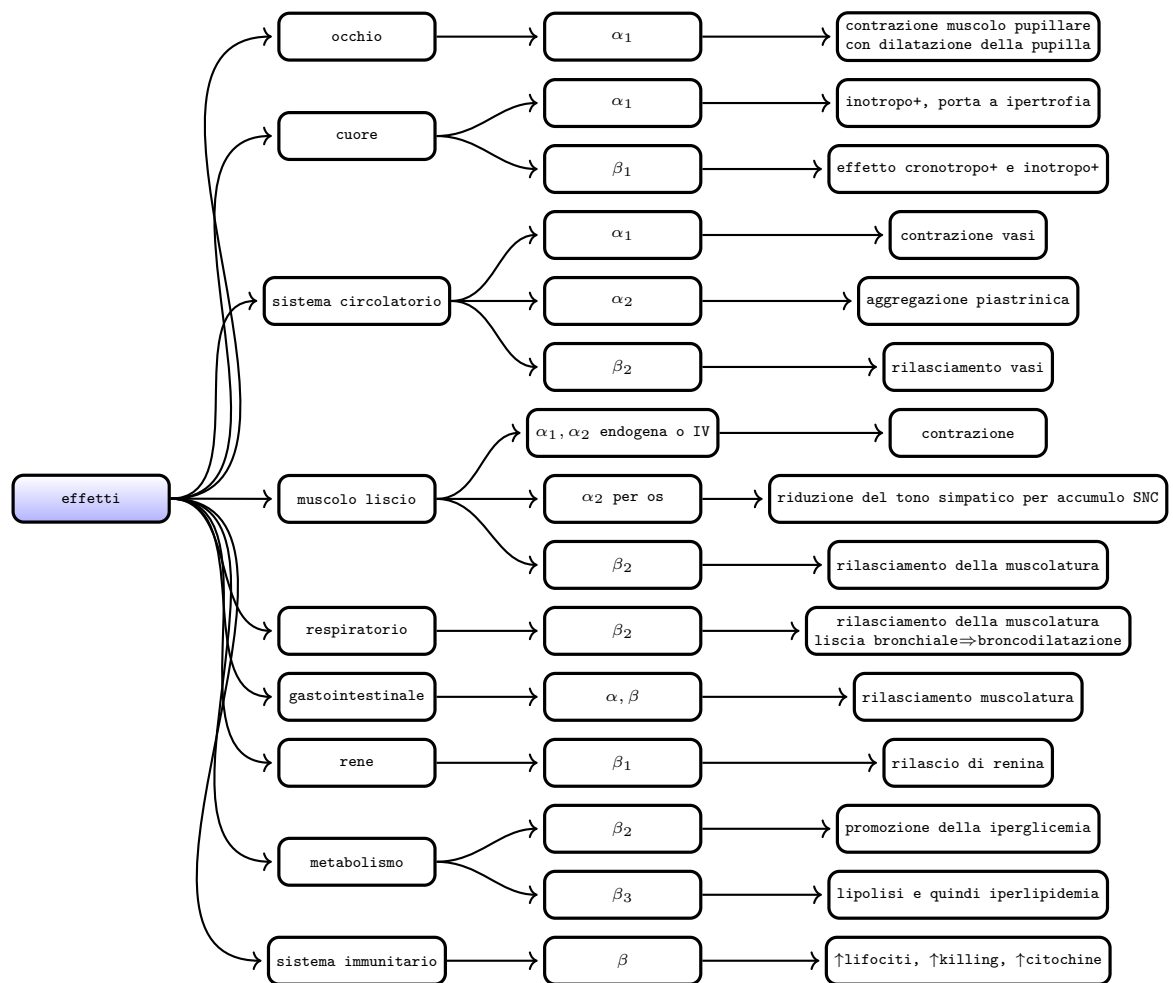


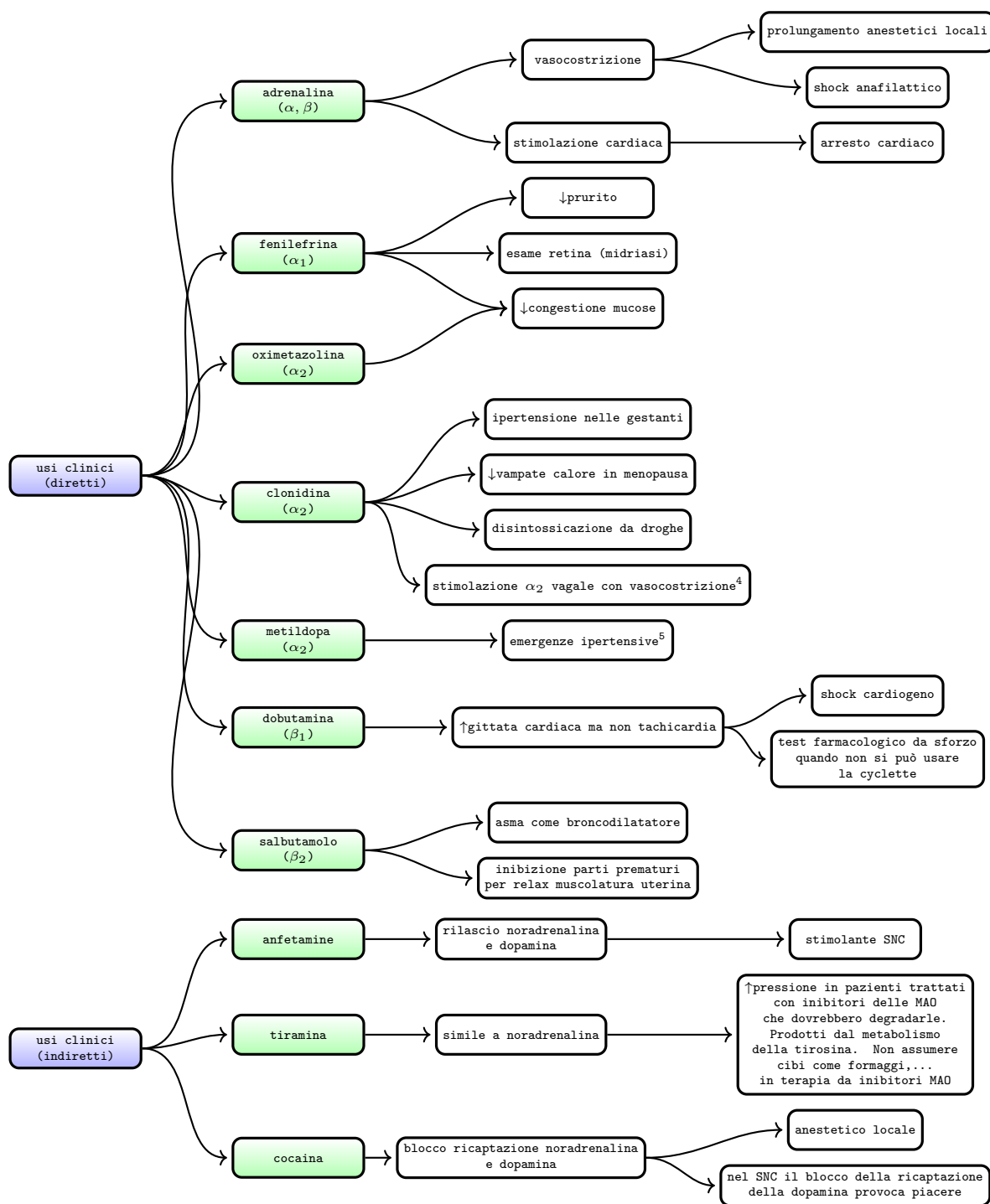


Le catecolamine sono degradate da COMT a livello intestinale e epatico per cui l'assorbimento per os è praticamente nulla.

L'assenza di uno o di ambedue i gruppi —OH ne aumenta la disponibilità per os.

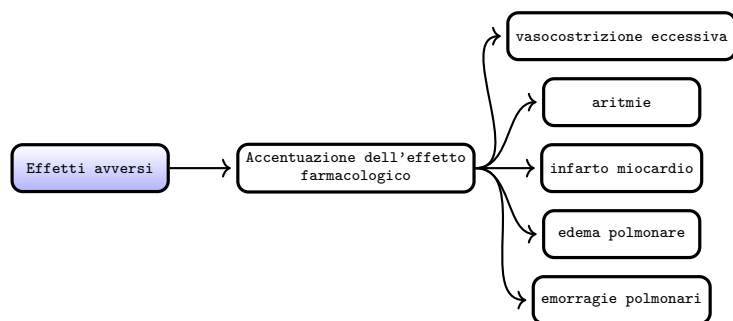
La metilazione sul primo carbonio a sx del gruppo ammino, comporta un'azione mista dei farmaci come nell'efedrina e l'anfetamina che hanno azione diretta e indiretta e quindi dipendono anche dalla presenza del neurotrasmettitore.



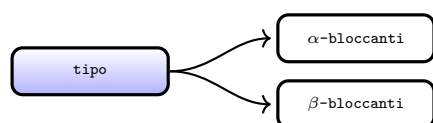


⁵Per cui può dare anche un aumento della pressione e per questo non si usa nelle emergenze da ipertensione

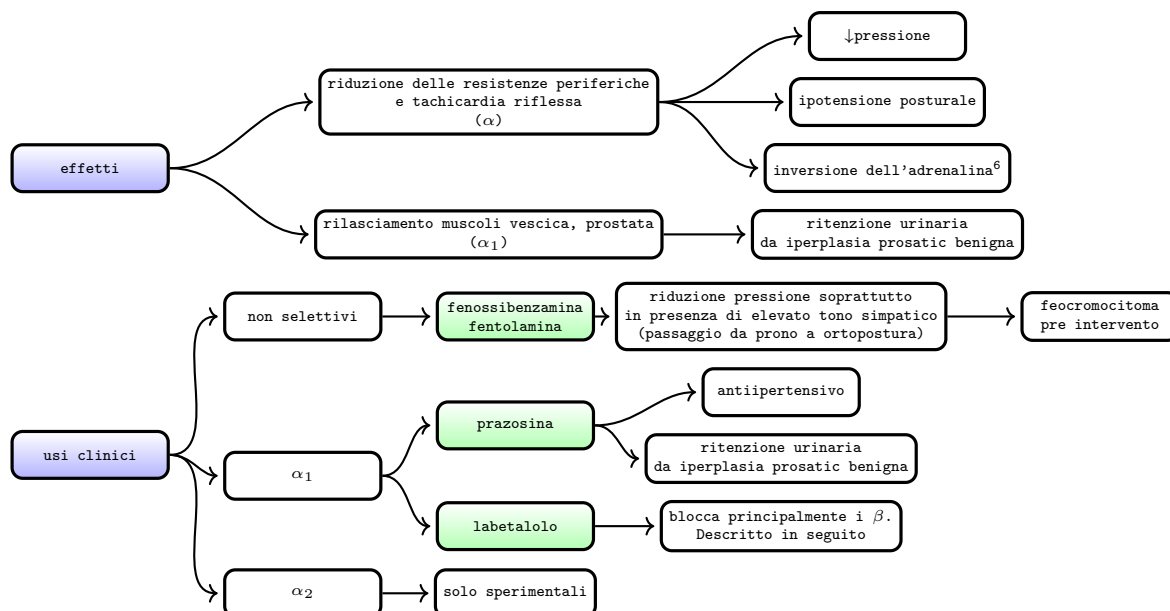
⁵È anche un inibitore della DOPA decarbossilasi per cui ↓dopamina.



2.2.2. Inibitori dei recettori adrenergici

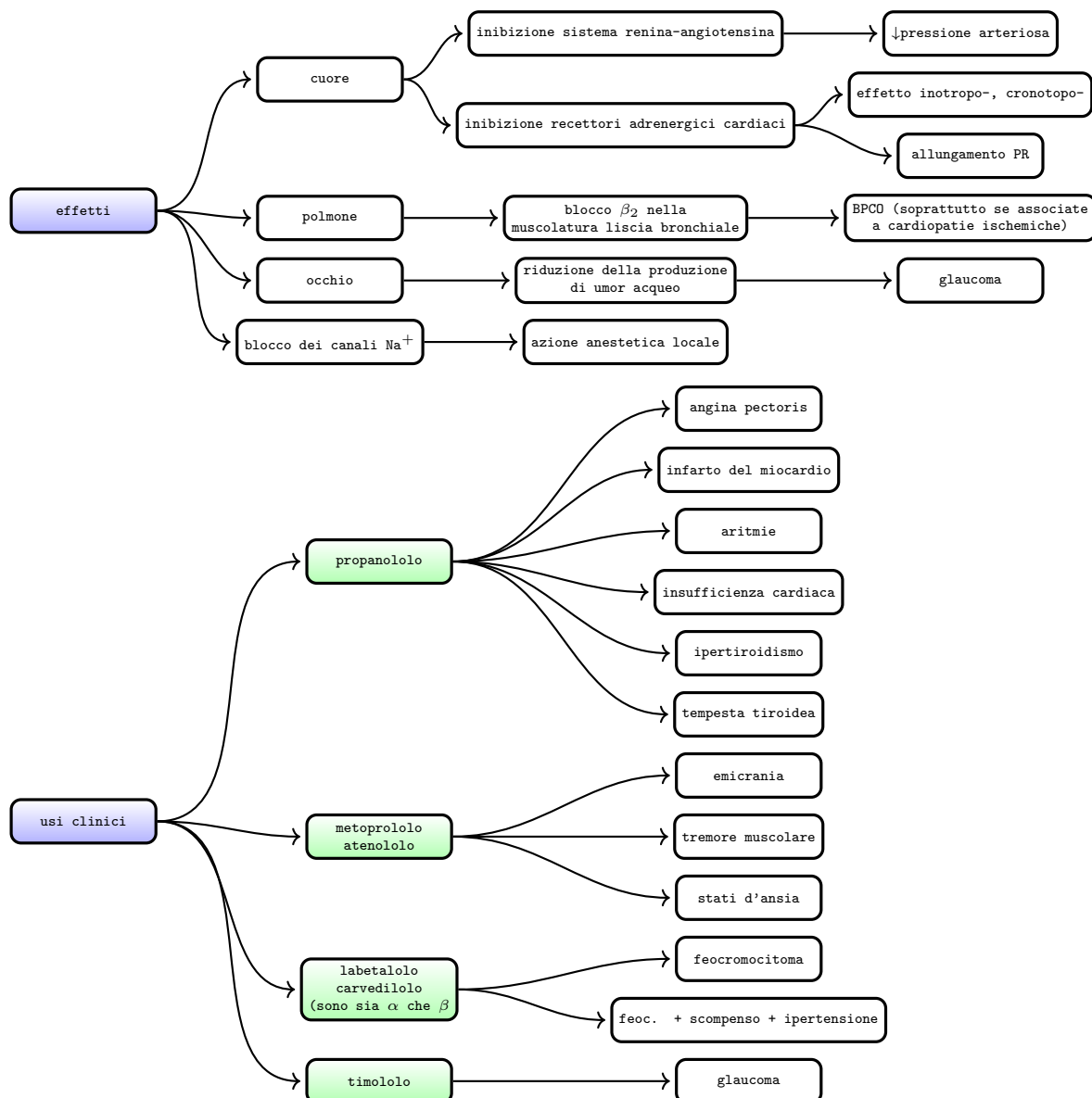


α-BLOCCANTI



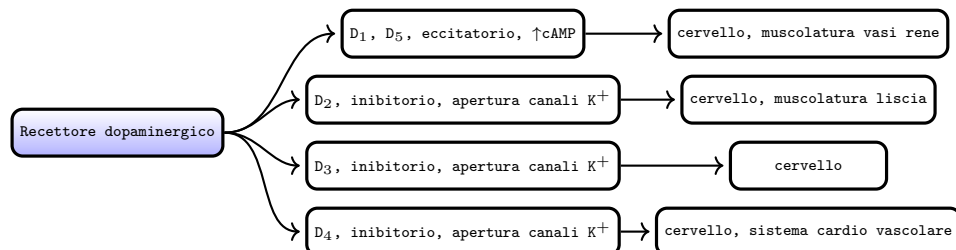
β-BLOCCANTI

⁶Attiva sia gli α che i β_2 . Se si immette un α -bloccante questo neutralizzerà l'effetto vasocostrittore dell'adrenalina lasciando la sola attivazione dei β_2 che quindi causerà una vasodilatazione da cui un'azione inversa a quella usuale dell'adrenalina

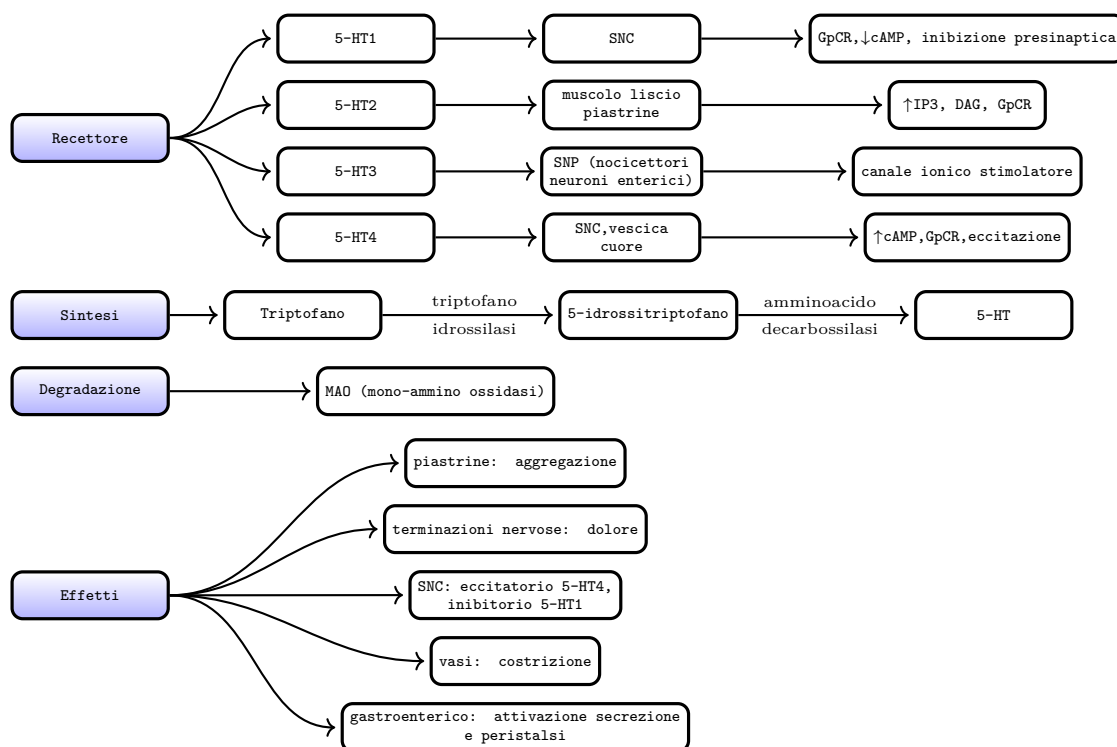


2.3. Dopamina

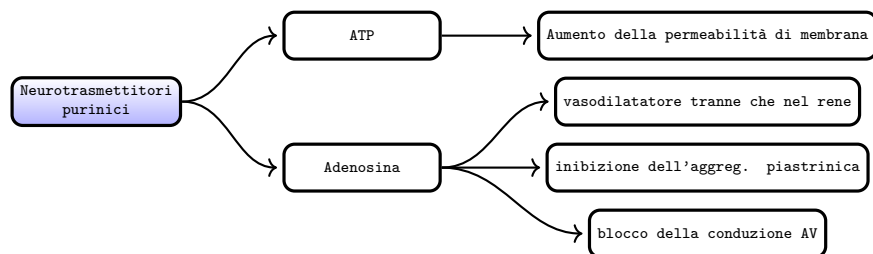
Ricorda anche la dopamina è una catecolamina quindi anche i recettori dopaminergici sono recettori adrenergici



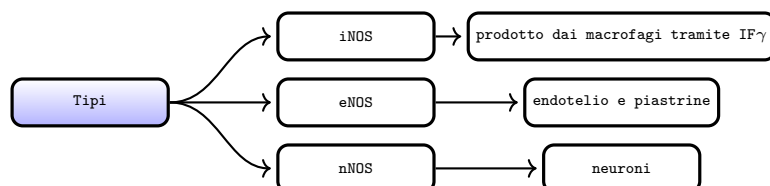
2.4. Serotonina

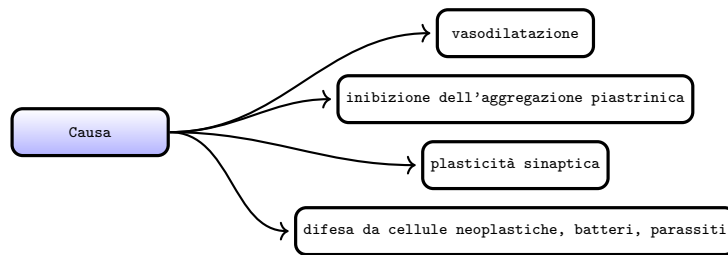


2.5. Neurotrasmettitori purinici



2.6. Monossido d'azoto (NO)



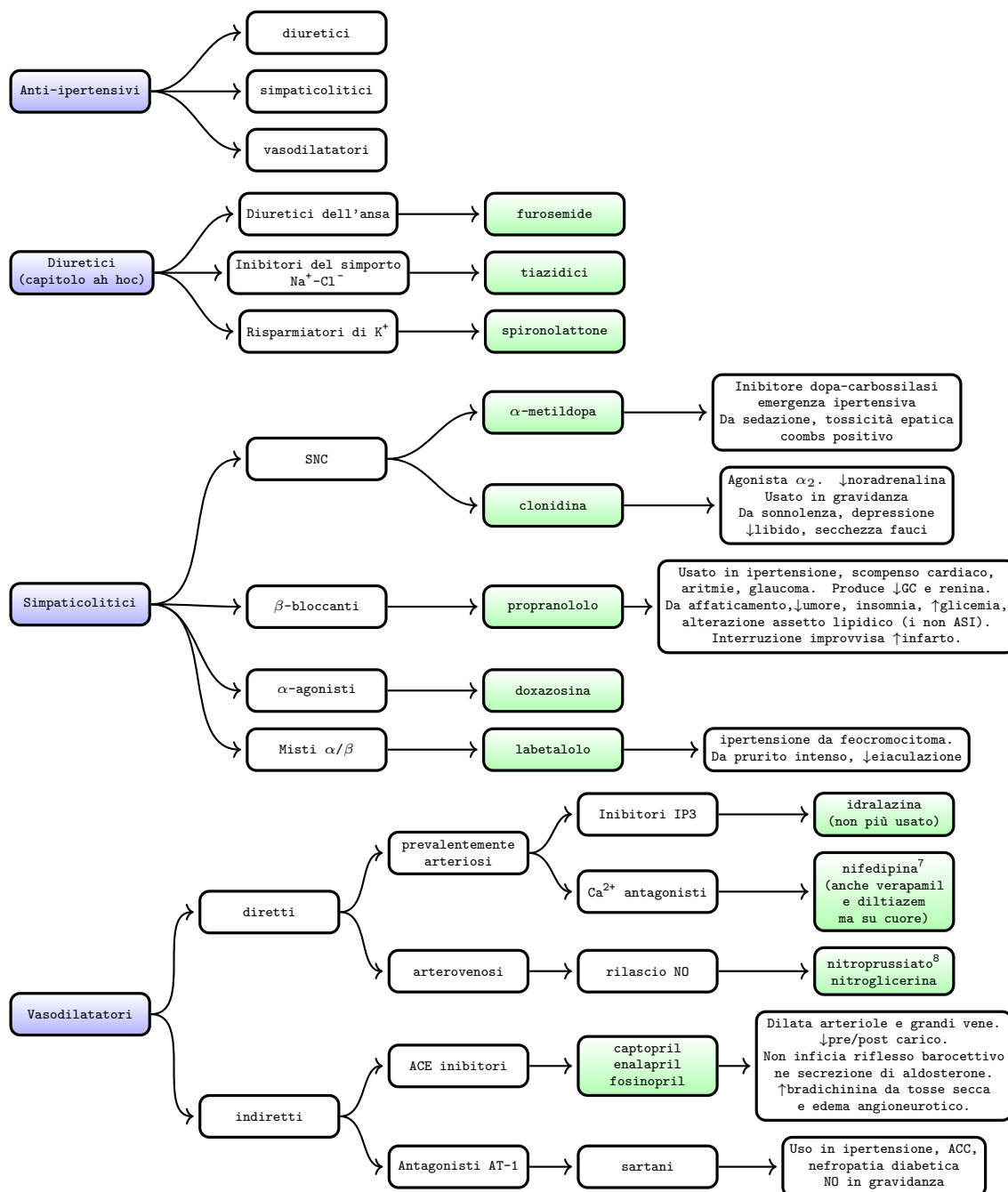


Per via inalatoria ↓shunt, ↓broncocostrizione, ↓ipertensione polmonare e quindi utile anche nella cura dell'asma.

Utile nel trattamento delle malattie neurovegetative e shock settico dove aumenta e nell'ateorscelosi e ipercolesterolemia dove diminuisce.

3. Farmaci del sistema cardiovascolare e renale

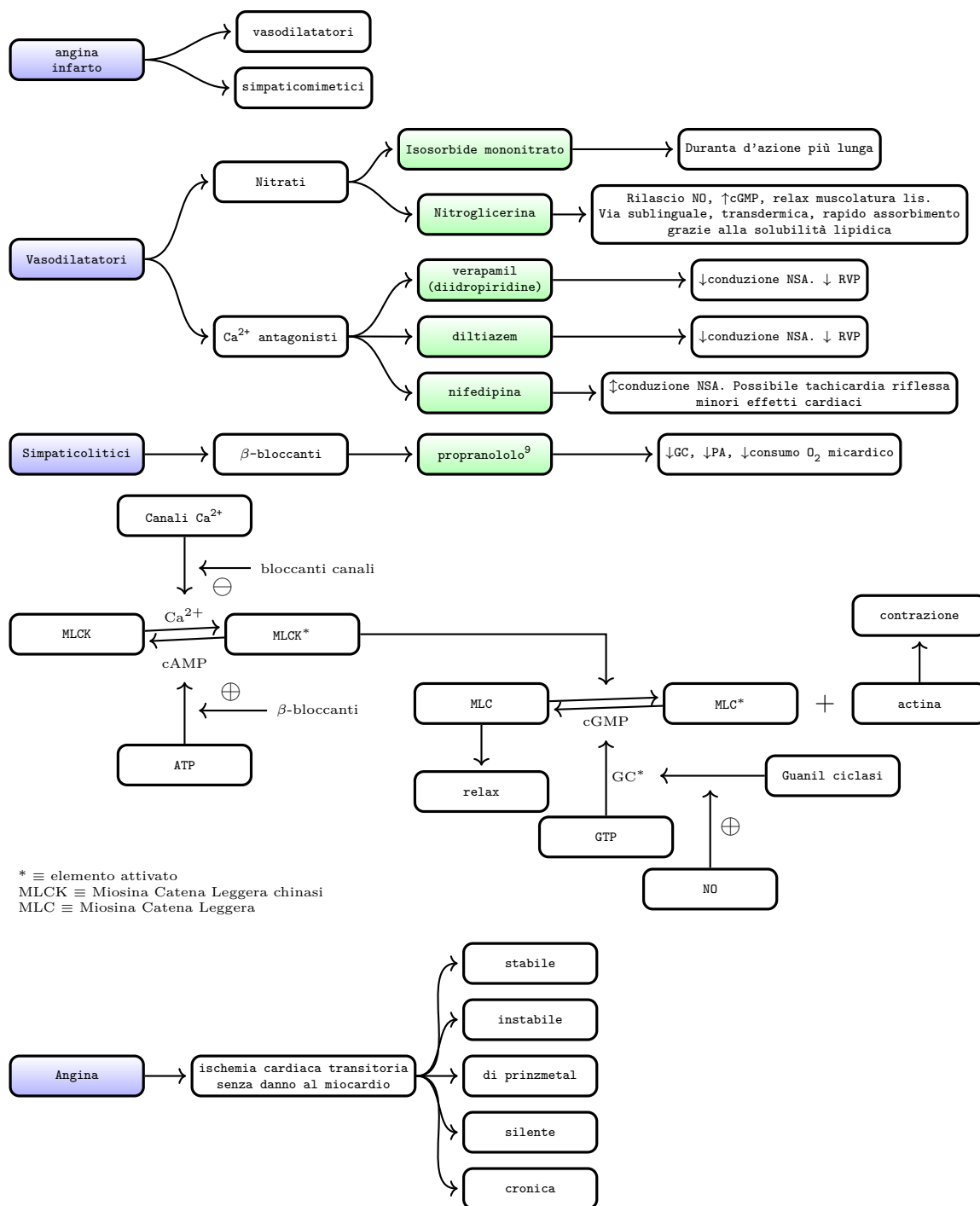
3.1. Farmaci anti-ipertensivi



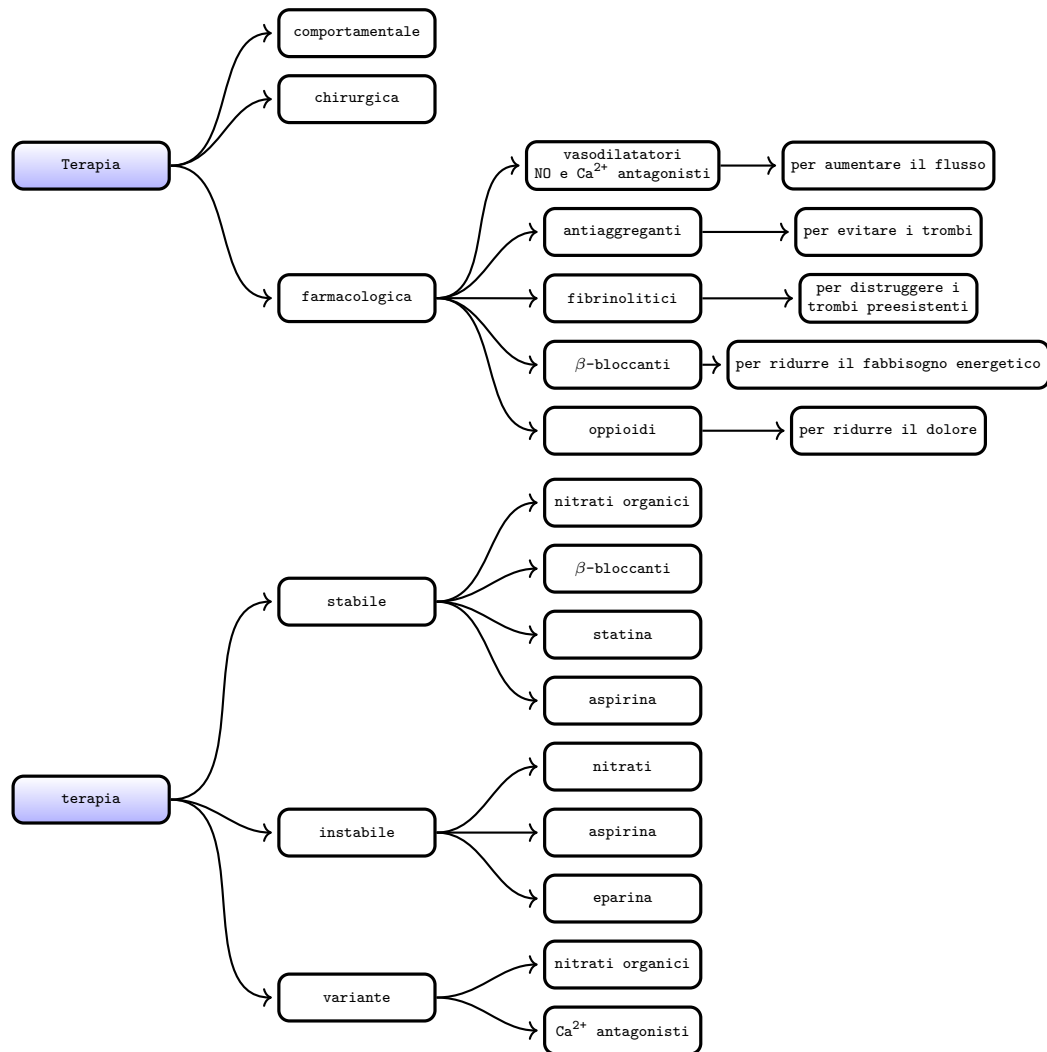
⁸Vedere farmaci angina

⁸Vedere farmaci angina

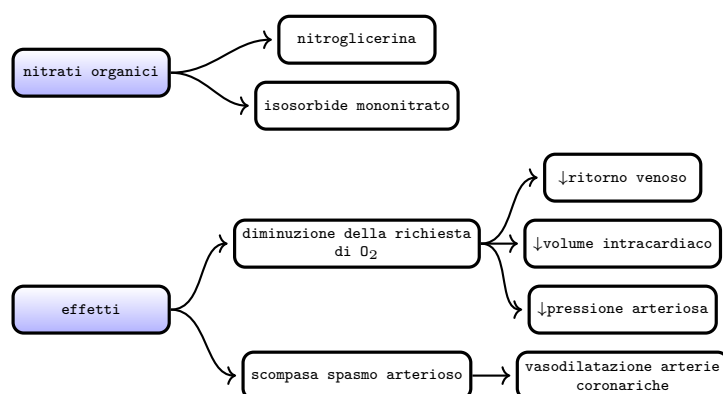
3.2. Farmaci nell'angina e infarto cardiaco

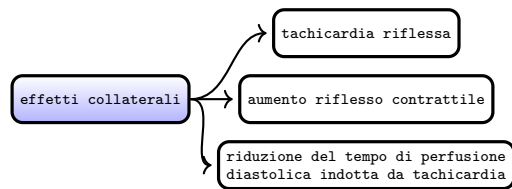


⁹vedi farmaci anti-ipertensivi

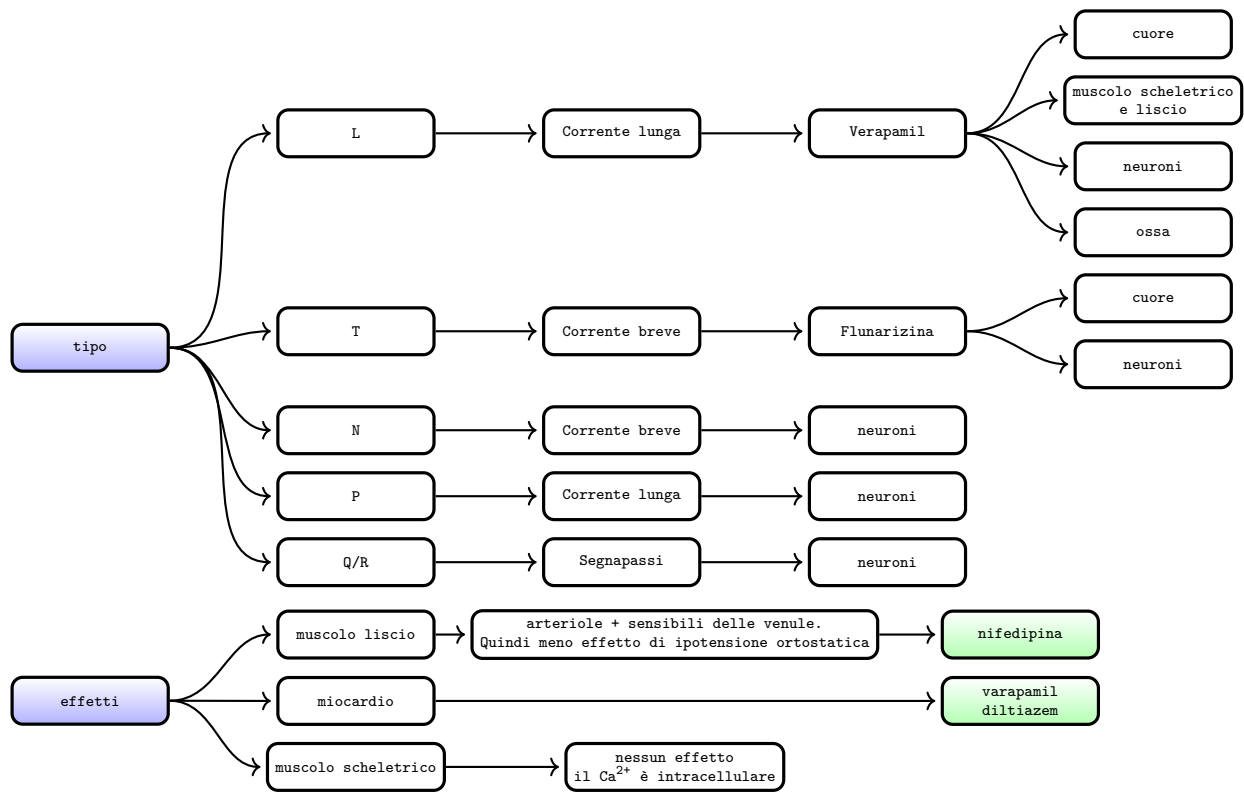


3.2.1. Nitrati organici

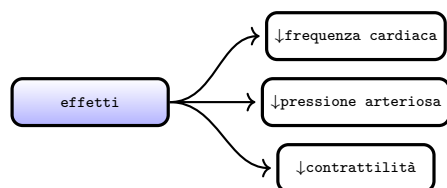


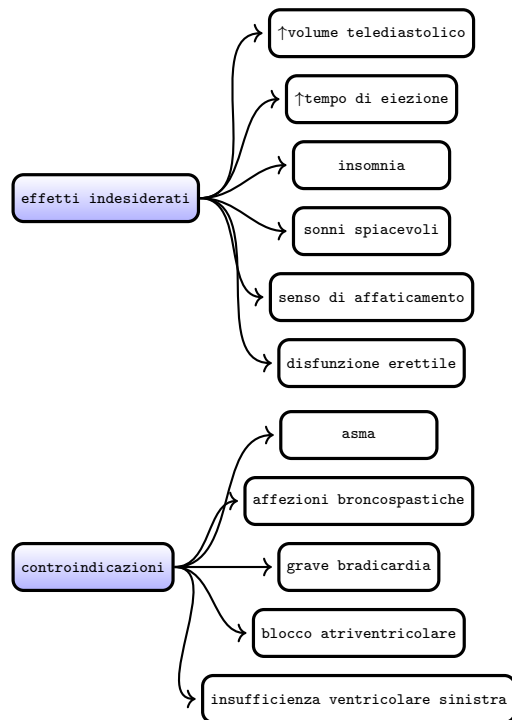


3.2.2. Calcio antagonisti

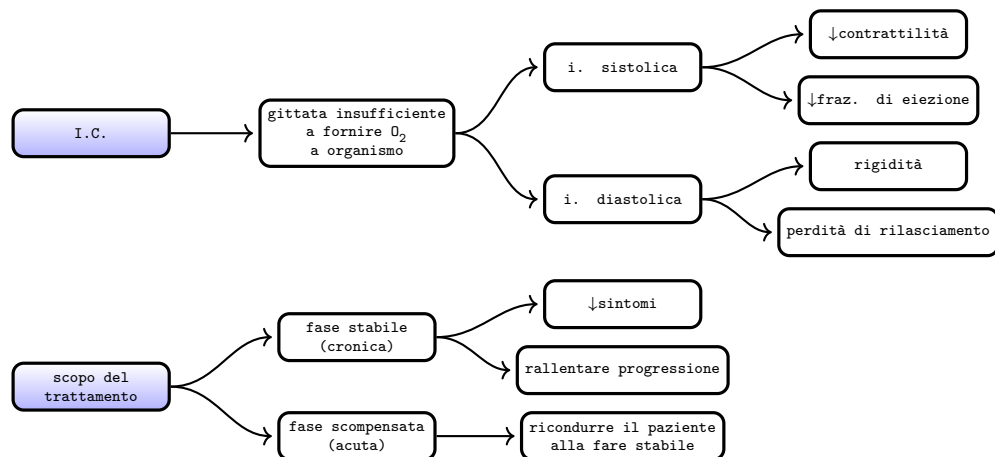


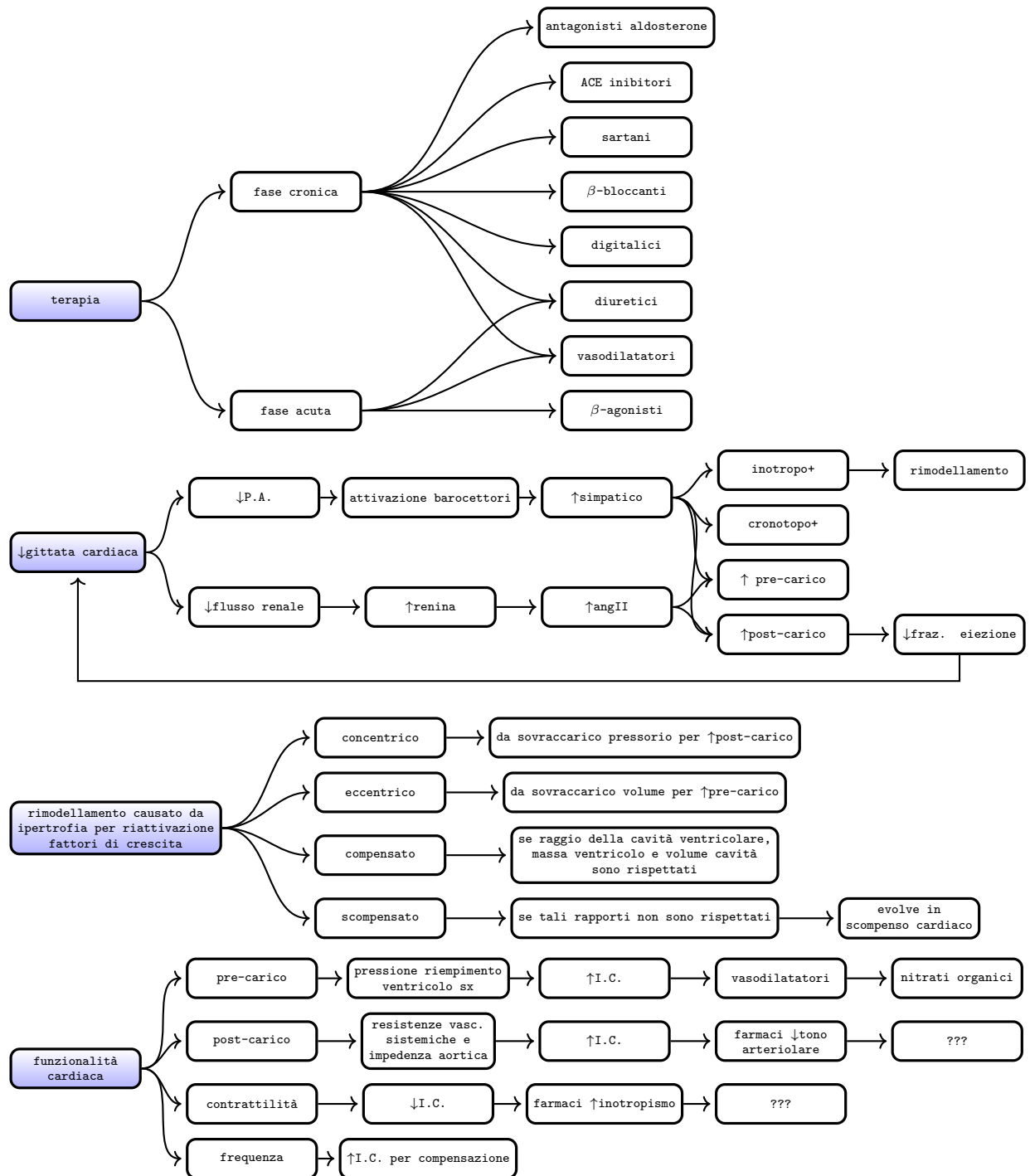
3.2.3. β -bloccanti

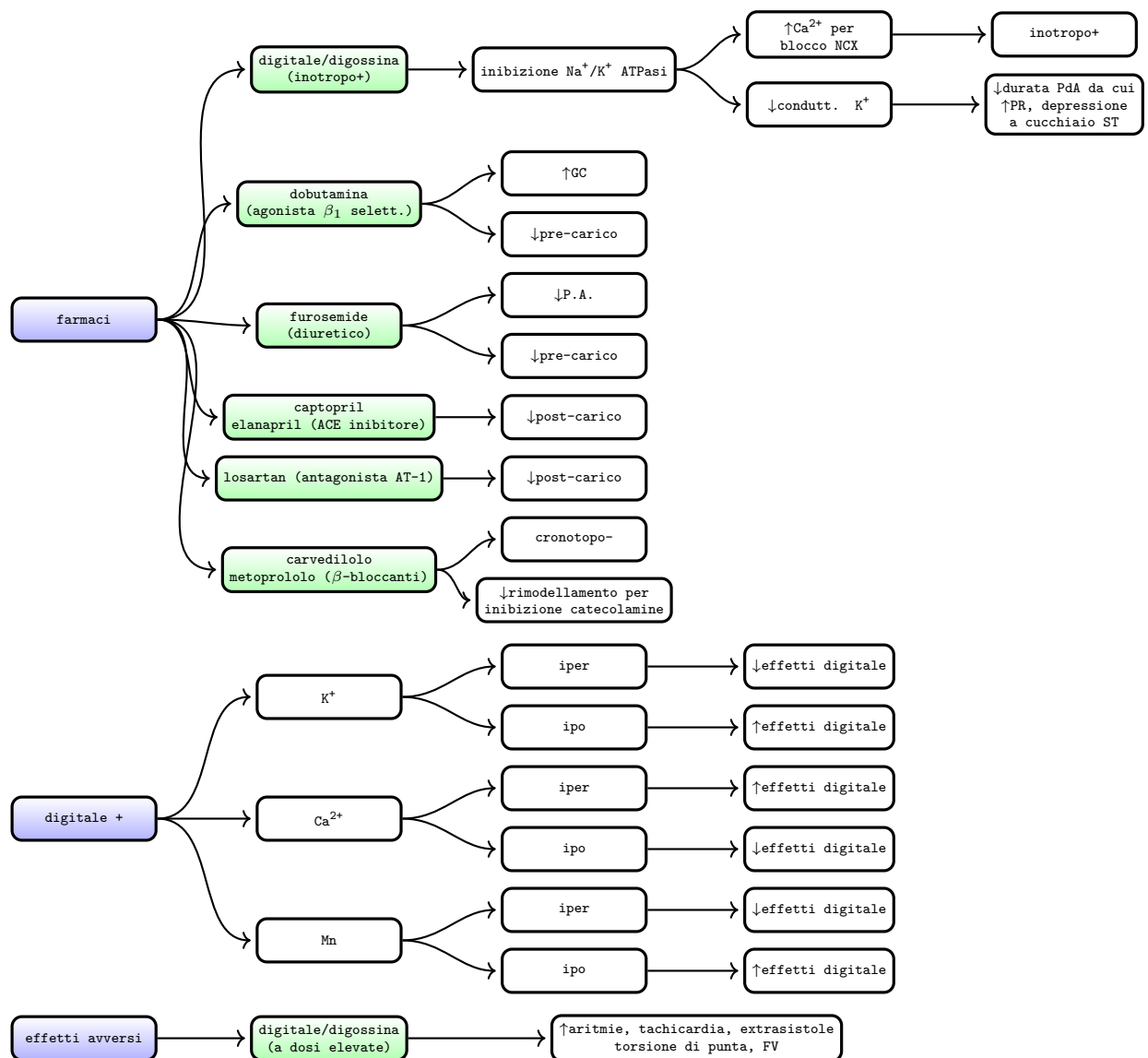




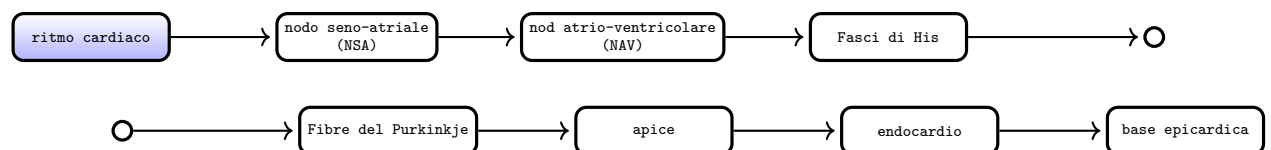
3.3. Insufficienza cardiaca

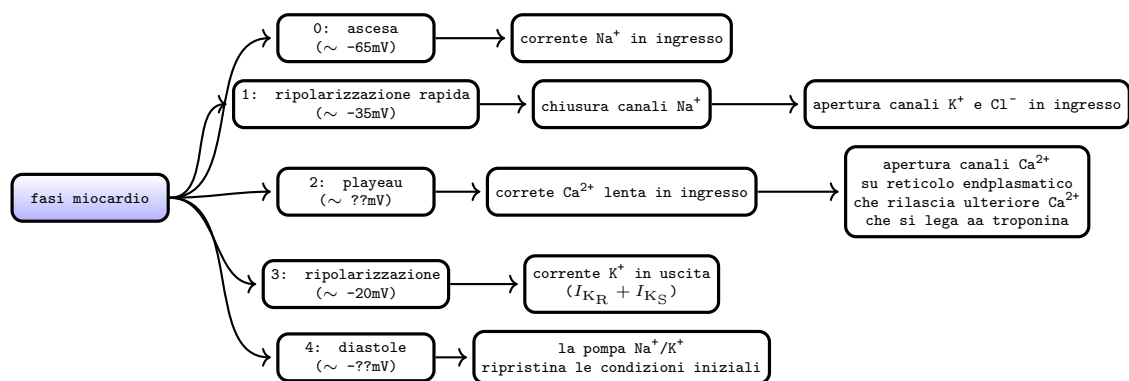




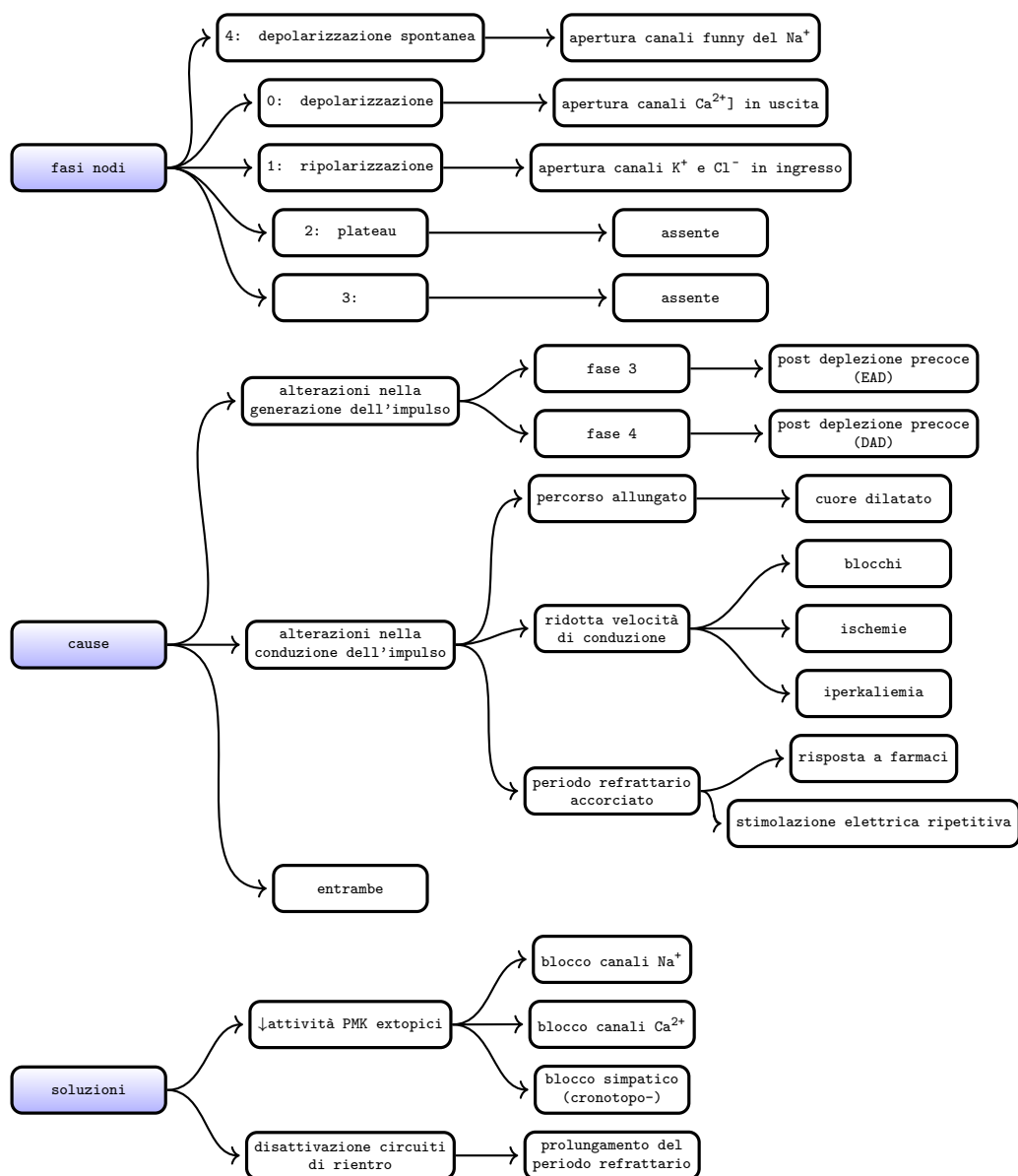


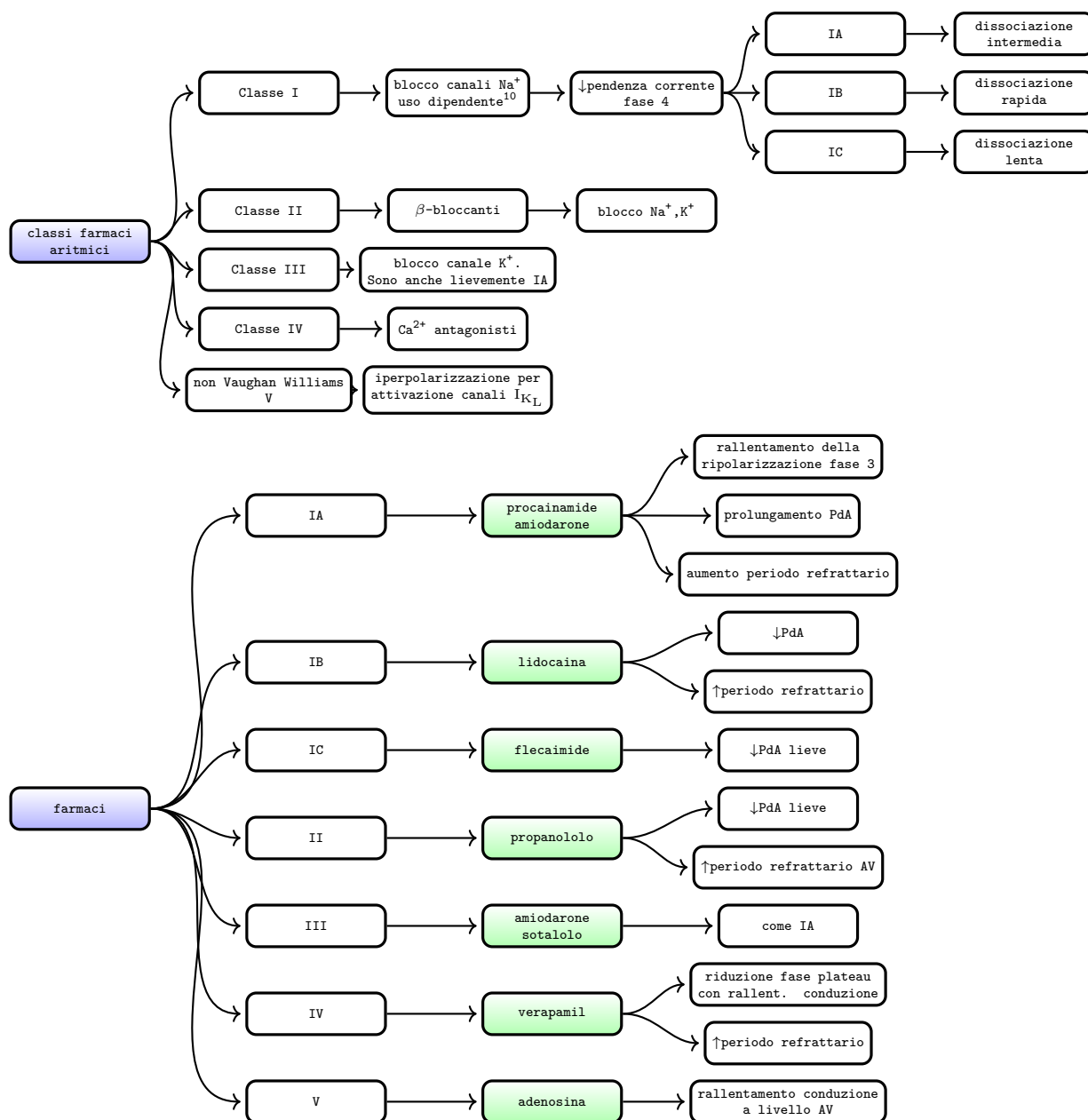
3.4. Aritmie Cardiache



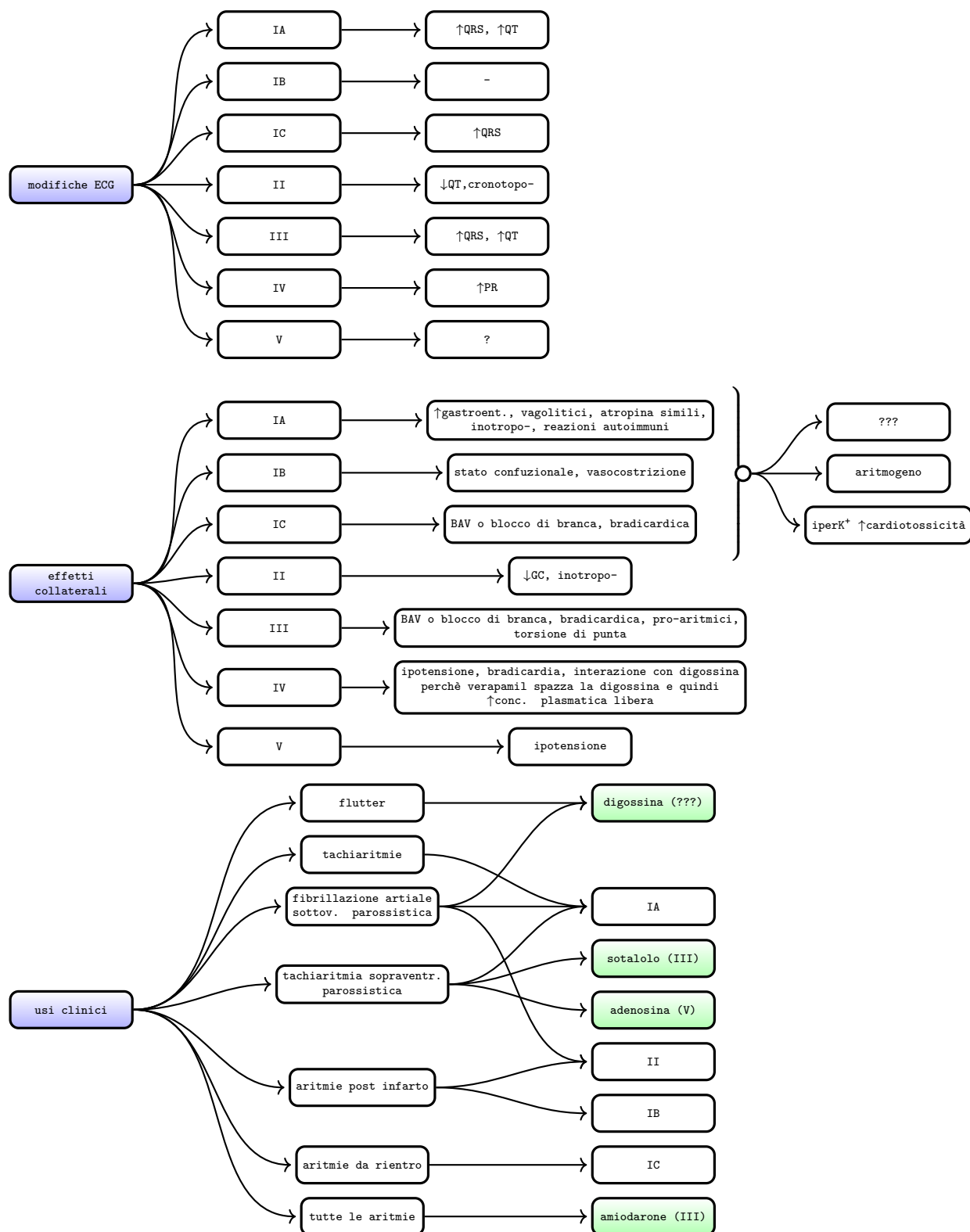


Periodo refrattario tra fase 0 e ripristino del canale Na^+ riattivati utile a consentire il propagarsi di un nuovo PdA.





¹⁰Ossia agiscono soprattutto sui canali in uso ossia aperti o refrattari. Questi sono maggiormente in questi stati nei tessuti aritmici e quindi si ha un maggiore effetto proprio su quei tessuti che stanno causando il problema rispetto a quelle che funzionano normalmente.



4. Farmaci dell'emostasi

