

# RESUMOS NOTA 10

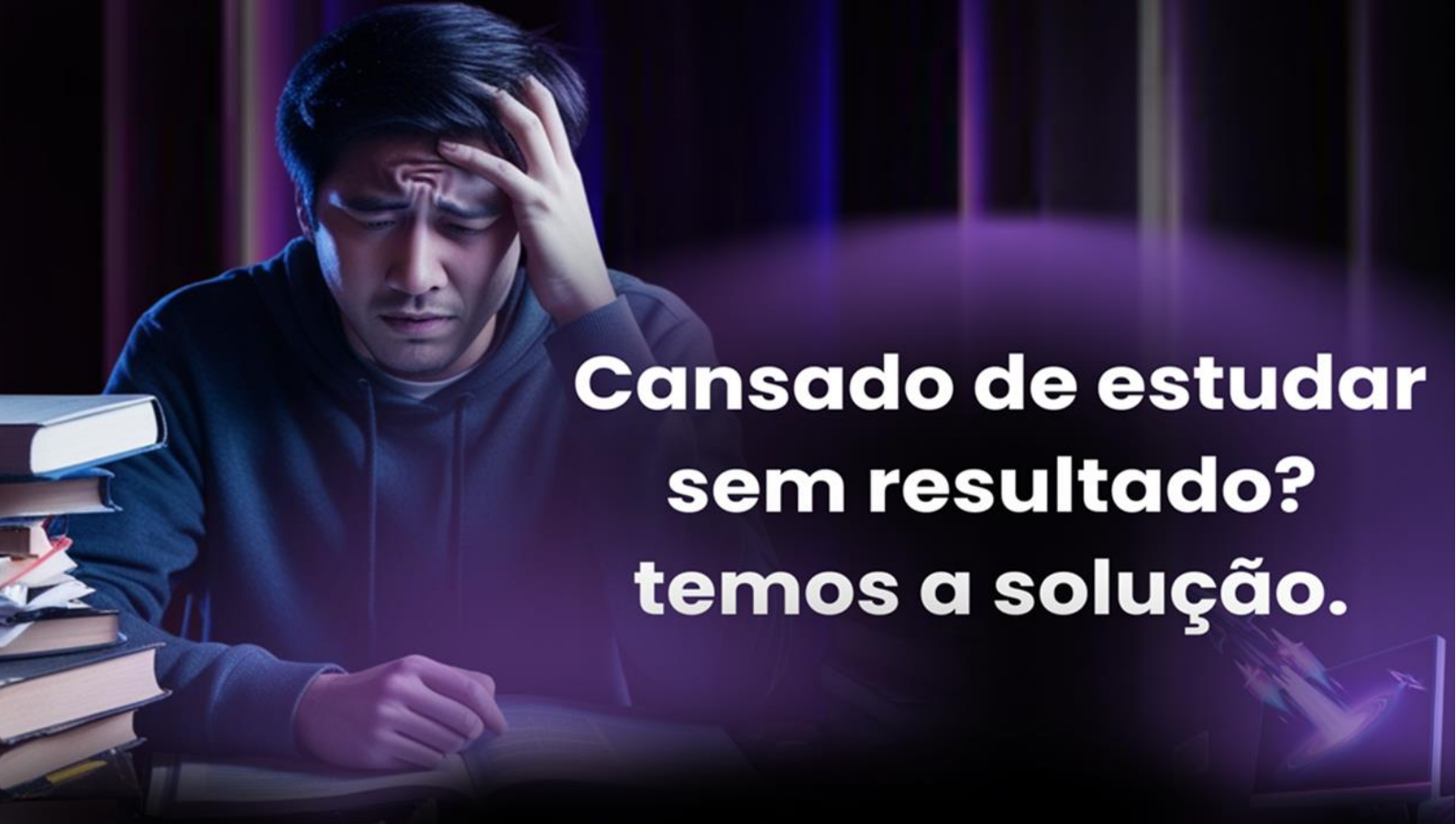
---



**Receptores**

---

# FARMACOLOGIA



**Cansado de estudar  
sem resultado?  
temos a solução.**

# DentistaON



**Cursos e Resumos**



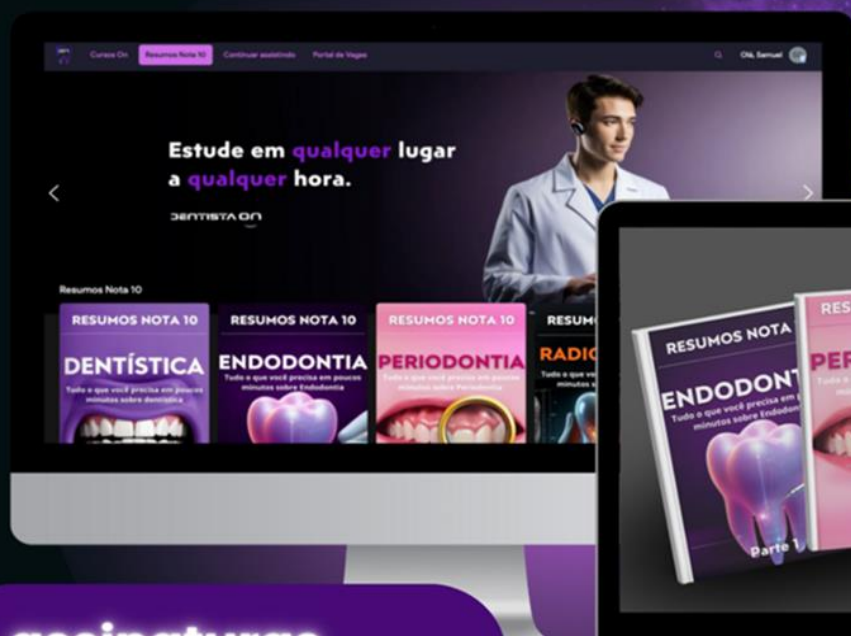
**Portal de vagas**



**Certificados**



**Horas  
complementares**



**assinaturas  
mensais e anuais**

**DENTISTA ON**

## Receptores

### Conceito de Receptores

Receptores são macromoléculas que:

- Reconhecemos e se ligamos a ligantes (moléculas específicas como fármacos, hormonais ou neurotransmissores).
- Transmitem sinais intracelulares que modulam funções biológicas.

Os medicamentos podem atuar como:

- **Agonistas** : Ativam o receptor, mimetizando o ligante natural.
- **Antagonistas** : Bloqueiam o receptor, impedindo a ação do ligante natural ou de outros agonistas.

Cada fármaco tem afinidade com determinado receptor chamado de atividade intrínseca.

Algumas vezes o fármaco é eficiente para uma determinada etnia e ineficiente para outra devido a variação genética.

Os principais receptores de fármacos são encontrados na membrana celular e por isso alguns textos descrevem como verdadeiros.

### Tipos de receptores:

Os receptores podem ser classificados com base em sua estrutura e no tipo de resposta que induzem. As principais categorias são:

a. Receptores Acoplados à Proteína G (RCPG)

- Constituem a maior família de receptores.
- Tem sete domínios transmembrana.
- Atuam via proteínas G, que ativam ou inibem enzimas e canais iônicos, gerando segundos mensageiros como AMP cíclico (AMPC) e inositol trifosfato (IP<sub>3</sub>).  
*Exemplos* : Receptores adrenérgicos ( $\alpha$  e  $\beta$ ), muscarínicos de acetilcolina.

b. Receptores Ionotrópicos (Canais Iônicos Ligante-Dependentes)

- Permitem o fluxo de íons ( $\text{Na}^+$ ,  $\text{K}^+$ ,  $\text{Ca}^{2+}$ ,  $\text{Cl}^-$ ) quando ativados.
- São funções rápidas e controladas como transmissão sináptica e contração muscular.  
*Exemplos* : Receptores nicotínicos de acetilcolina, receptores GABAUMUM.

c. Receptores Catalíticos ou de Tirosina Quinase

- Enzimas ativadas por ligantes que desencadeiam reações de fosforilação intracelular.
- Regular processos como crescimento celular e diferenciação.  
*Exemplos* : Receptores de insulina, fatores de crescimento (EGFR).

d. Receptores Nucleares

- Localizados no núcleo ou citoplasma.
- Liga-se a hormônios lipossolúveis (esteroides, hormônios tireoidianos) e regula a expressão gênica.



*Exemplos : Receptores de glicocorticóides, estrogênios.*

**Canais iônicos:** aumentar ou diminuir a passagem dos íons.

**Fármaco voltagem dependente:** Os fármacos podem ter uma fórmula química que reconhece esse sítio de ligação, exemplo, os benzodiazepínicos e fármacos que promovem hipnose, tem um sítio de atuação específico.

Quando um fármaco encontrar um receptor inotrópico e estimular a passagem do sódio haverá uma grande despolarização e a célula irá entrar em atividade.

Existe receptores inotrópicos voltagem dependente. Quando esse canal iônico ligante dependente permitir a passagem do cloreto a célula hiper polariza (fica bem negativa) e diminui sua atividade, exemplo os ansiolíticos e anestesia geral. Todas as vezes que o fármaco ligar em um receptor inotrópico o tempo é avaliado em milissegundos.

### **Proteína G**

O segundo mecanismo importante, é quando o fármaco se liga a proteína G e essa por sua vez pode ser de:

**GI** - Inibição

**GS** - Estímulo direto

**GQ** - Estímulo indireto quinase, uma proteína no interior da célula irá ganhar um fosfato e ficará ativa.

**GS** e **GQ** pode estimular a formação de um segundo mensageiro ou então atuar sobre um canal iônico.

### **Receptores acoplados a proteína G:**

Quando o ligante encontra o sítio na proteína G ela pode executar duas atividades diferentes:

**Primeira atividade:** ativando ou inibindo uma enzima, ao ativar a enzima irá produzir um segundo mensageiro chamado de AMPc (adenosina mono fosfato). Os segundos mensageiros podem desencadear vários efeitos celulares, como liberar cálcio ou ativar uma proteína.

**Segunda atividade:** pode ativar ou inibir um canal iônico, ou seja, dentro dos receptores da proteína G possui um canal inotrópico.

Esses dois efeitos são chamados de efeito metabotrópico e ocorre em segundos.

Exemplo: adrenalina fisiológica e farmacológica atua sobre a proteína G, que em locais diferentes terá efeitos diferentes

### **O terceiro mecanismo é ativação intracelular de uma enzima (quinase):**

o receptor na membrana vai permitir através da fosforilação a ativação de uma proteína que irá gerar um efeito celular, como por exemplo a insulina executa essa ação para que a glicose produza energia, esse mecanismo ocorre em horas.

### **A quarta possibilidade será a ação do fármaco sobre o código genético (cortisona):**

Significa que o fármaco ultrapassa a membrana celular e atua no código genético da célula. Pacientes portadores de osteoporose utilizam um fármaco do grupo bifosfato, esse fármaco inibe a atividade osteoplástica, porém pode provocar

diminuição do fluxo sanguíneo e morte das células presentes na medula principalmente da mandíbula (necrose).

O local onde o fármaco encontra o seu receptor é chamado de biofase, a ligação entre os dois é chamado de ação e o produto é o efeito, a ligação geralmente é fraca, mas produz efeito as ligações fortes são irreversíveis.

### Um fármaco pode ser

**Agonista:** ao encontrar o seu receptor ele irá desempenhar o mesmo efeito do fisiológico (hormônio.)

**Antagonista:** ocupa o receptor e bloqueia a ação do fisiológico bloqueia o efeito.

**Adrenalina** usada no anestésico local é agonista e provoca vasoconstrição.

**O atenolol** é um fármaco antagonista da noradrenalina no coração. Existem fármacos que são agonistas parciais liga no receptor e produz um efeito menor.

Fármacos não criam funções 99% dos fármacos para ter ação e efeito precisam se ligar a um receptor.

Quando o fármaco se liga no receptor ele vai sinalizar algum evento bioquímico.

Os receptores principais de fármacos são grandes moléculas de proteína, estão distribuídos por todos os nossos tecidos, porém alguns receptores podem estar protegidos por barreiras

Os fármacos que se ligam nos receptores estão ocupando o lugar de substâncias fisiológica como

hormônios, neurotransmissores, neuromoduladores e altacois.