



ΣΤΕΛΕΧΟΣ ΔΙΑΤΡΟΦΗΣ ΔΙΑΙΤΟΛΟΓΙΑΣ

ΕΙΣΗΓΗΤΡΙΑ: ΑΡΒΑΝΙΤΑΚΗ ΕΙΡΗΝΗ

ΦΑΡΜΑΚΟΛΟΓΙΑ

2^ο Μάθημα

ΦΑΡΜΑΚΟΔΥΝΑΜΙΚΗ

Μελέτη δράσης φαρμάκων

- Μελετά τις βιοχημικές δράσεις και τους μηχανισμούς που δρουν τα φάρμακα
- Περιγράφει το τι προκαλεί ένα φάρμακο μέσα σε έναν οργανισμό και εξηγεί το πώς το προκαλεί
- Προκειμένου να προκαλέσει κάποια ενέργεια το φάρμακο πρέπει πρώτα να αλληλεπιδράσει με έναν μοριακό στόχο.



- Ξεχωριστές κατηγορίες φαρμάκων προσδένονται μόνο σε συγκεκριμένους στόχους.
- • Ξεχωριστοί στόχοι αναγνωρίζουν μόνο συγκεκριμένες κατηγορίες φαρμάκων.
- Κανένα φάρμακο δεν είναι απόλυτα ειδικό στη δράση του, καθώς αύξηση της δόσης του θα το κάνει να επηρεάσει στόχους διαφορετικούς από τον κύριο στόχο (ανεπιθύμητες ενέργειες).



ΤΡΟΠΟΣ ΔΡΑΣΕΩΣ ΦΑΡΜΑΚΩΝ

1. Η δράση των φαρμάκων οφείλεται, στις φυσικοχημικές ιδιότητές τους. (σόδα)

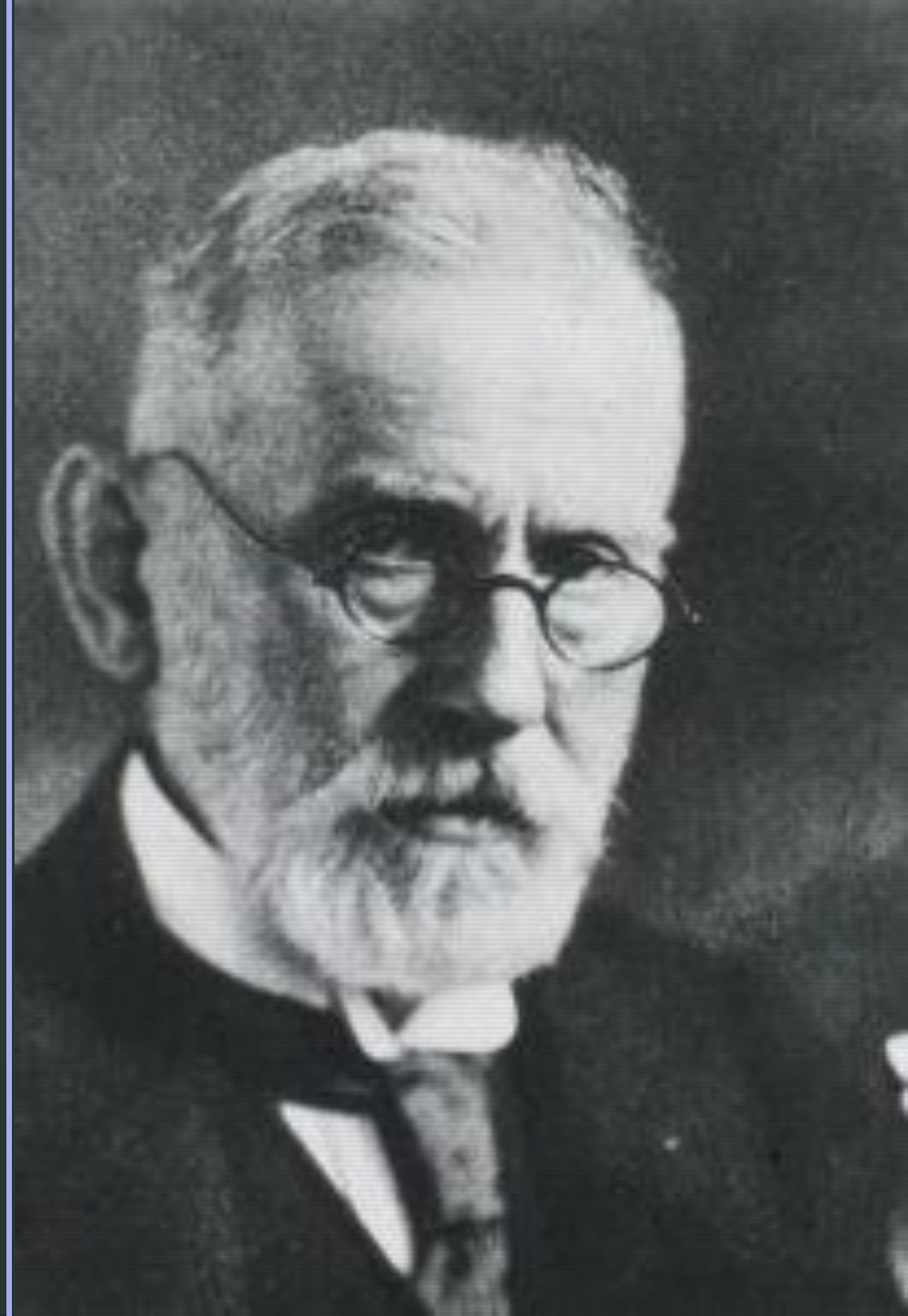
2. Και στη σύνδεσή τους με ειδικές θέσεις των κυττάρων, τους ΥΠΟΔΟΧΕΪΣ.



Θεωρία των Υποδοχέων

Από το τέλος του περασμένου αιώνα πολλοί επιστήμονες είχαν παρατηρήσει ότι τα φάρμακα εμφάνιζαν εκλεκτική δράση, ανάλογα με τη χημική δομή τους.

Το 1900 ο Ehrlich, ύστερα από σειρά πειραμάτων και παρατηρήσεων, διατύπωσε τη θεωρία των υποδοχέων, που εξηγεί το μηχανισμό δράσης των φαρμάκων.





- Με τη θεωρία αυτή γίνεται παραδεκτό, ότι πάνω σε ορισμένα κύτταρα μέσα στον οργανισμό υπάρχουν **ειδικές θέσεις**, με τις οποίες συνδέονται τα φάρμακα, ανάλογα με τη χημική τους δομή.
- Μετά τη σύνδεση αυτή η συμπεριφορά των κυττάρων αυτών αλλάζει και έτσι εμφανίζεται η δράση των φαρμάκων (φαρμακολογική ενέργεια).

ΦΑΡΜΑΚΟ- ΥΠΟΔΟΧΕΑΣ= ΚΛΕΙΔΙ-ΚΛΕΙΔΑΡΙΑ

Οι ειδικές αυτές θέσεις των κυττάρων των ιστών, που έχουν βέβαια τελείως καθορισμένη χημική δομή, λέγονται υποδοχείς.

Οι υποδοχείς είναι μακρομόρια-στόχοι όπου προσδένεται το φάρμακο για να ασκήσει τη φαρμακολογική του δράση.



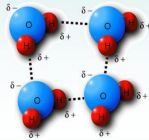
Δεσμοί Φαρμάκων - Υποδοχέων

- Το φάρμακο και ο υποδοχέας διατηρούνται συνδεδεμένα, με δυνάμεις-δεσμούς που αναπτύσσονται μεταξύ τους.
- Τα φάρμακα όταν συνδέονται με τους υποδοχείς, έχουν ένα βιολογικό αποτέλεσμα, ο οποίο είναι ανάλογο με τον αριθμό των κατειλημμένων υποδοχέων.
- Για να υπάρξει το μεγαλύτερο βιολογικό αποτέλεσμα, θα πρέπει όσο το δυνατόν περισσότεροι υποδοχείς να έχουν καταληφθεί από το φάρμακο.
- Οι υποδοχείς υπάρχουν φυσικά σε όλα τα κύτταρα, επειδή αποτελούν το κλειδί της ενδοκυττάριας επικοινωνίας

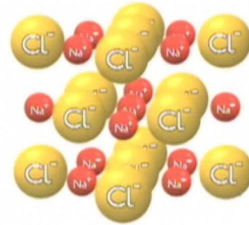


Δυνάμεις van der Waals

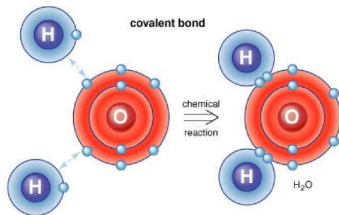
- **Ουδέτερα** άτομα και μόρια
- **Ασθενή έλξη** το ένα για το άλλο όταν βρεθούν πολύ κοντά
- Στιγμιαίες μετατοπίσεις – σχηματισμός **διπόλων**



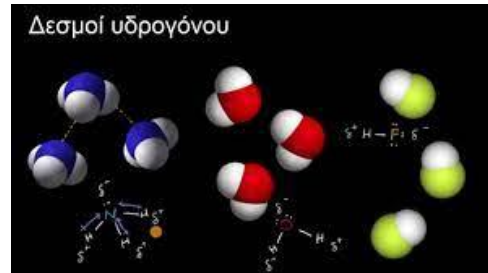
ΕΤΕΡΟΠΟΛΙΚΟΣ ΔΕΣΜΟΣ



ΟΜΟΙΟΠΟΛΙΚΟΣ ΔΕΣΜΟΣ



Δεσμοί υδρογόνου

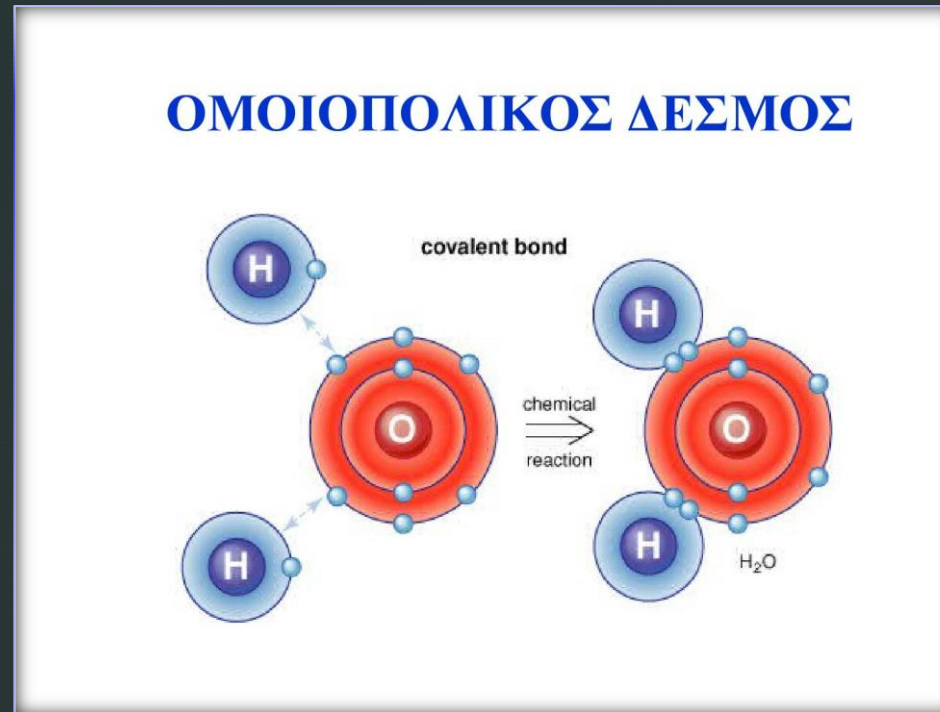


Σύνδεση φαρμάκων- υποδοχέων

- Ομοιοπολικός δεσμός
- Ετεροπολικός δεσμός
- Δεσμός υδρογόνου
- Δυνάμεις Van der Waals

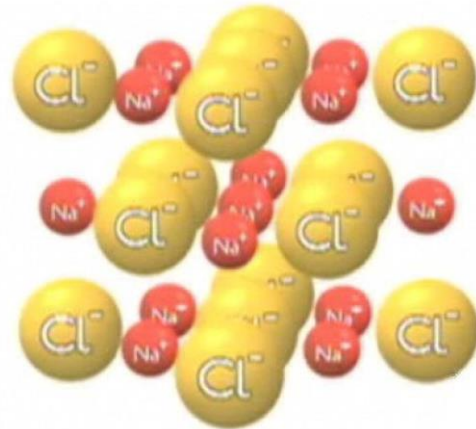
ΟΜΟΙΟΠΟΛΙΚΟΣ ΔΕΣΜΟΣ

- ❖ Με τον δεσμό αυτόν συνδέονται άτομα (C,H,N,O) με κοινό ζεύγος ηλεκτρονίων. Είναι από τους ισχυρότερους δεσμούς και σπάνια διασπάται.
- ❖ Τοξική ενέργεια Δηλητηρίων και δράση Αντιβιοτικών στα μικρόβια



ΕΤΕΡΟΠΟΛΙΚΟΣ ΔΕΣΜΟΣ

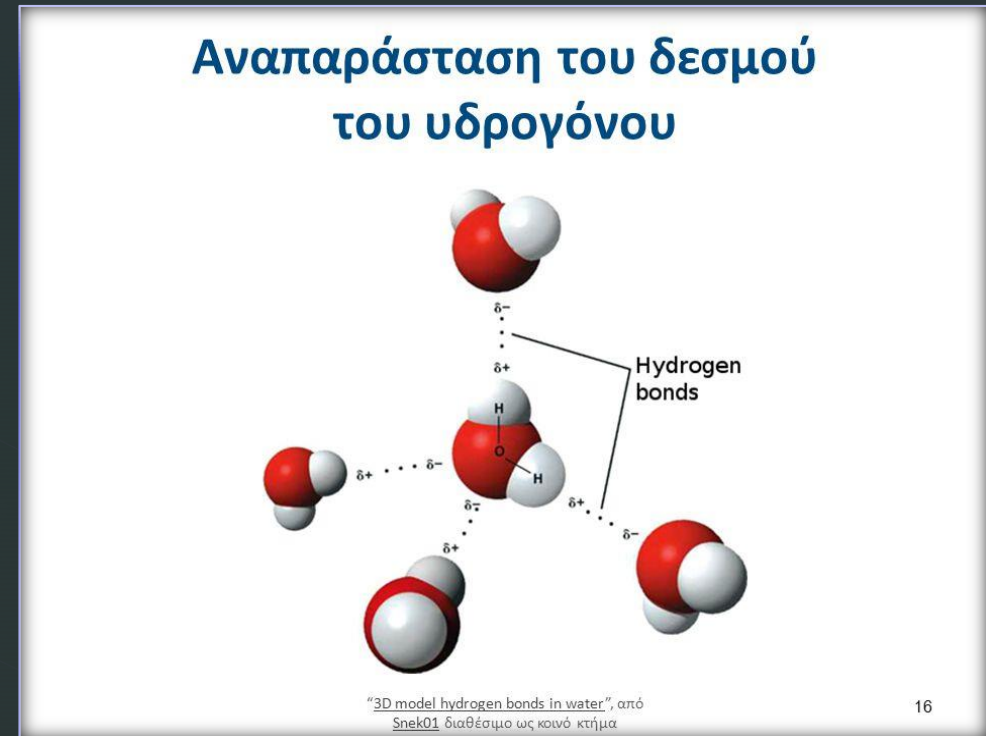
ΕΤΕΡΟΠΟΛΙΚΟΣ ΔΕΣΜΟΣ



- ❖ Ιόντα φαρμάκου και υποδοχέα αντίθετα φορτισμένα έλκονται και σχηματίζουν ιονικό δεσμό
- ❖ Η έλξη αυτή είναι σχετικά ασθενής, εξαρτάται από το pH του μέσου που βρίσκονται το φάρμακο και ο υποδοχέας
- ❖ Τοπικά αναισθητικά- μικρή δράση χρονικά

ΔΕΣΜΟΣ ΥΔΡΟΓΟΝΟΥ

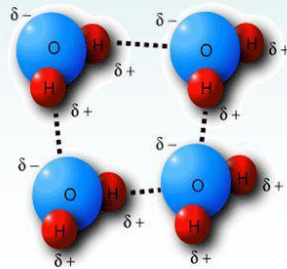
- ❖ Σχηματίζεται όταν ένα άτομο υδρογόνου συνδέεται με δύο ή περισσότερα διαφορετικά άτομα μιας ενώσεως
- ❖ Δεσμός πιο ασθενικός από τον ομοιοπολικό
- ❖ Πολύ σημαντικός όμως, γιατί φάρμακο και υποδοχέας περιβάλλονται από μόρια νερού και συνδέονται με αυτά με δεσμούς υδρογόνου
- ❖ Αντικαρκινικά, αντιμικροβιακά, αναλγητικά φάρμακα οφείλουν τη δράση τους στην ικανότητά τους να σχηματίζουν δεσμούς υδρογόνου




ΔΥΝΑΜΕΙΣ VAN DER WAALS

Δυνάμεις van der Waals

- **Ουδέτερα** άτομα και μόρια
- **Ασθενή έλξη** το ένα για το άλλο όταν βρεθούν πολύ κοντά
- Στιγμιαίες μετατοπίσεις – σχηματισμός **διπόλων**



- Δημιουργούνται όταν φάρμακο και υποδοχέας, τη στιγμή επαφής τους, φορτιστούν αντίθετα
- Ασθενείς δυνάμεις
- Συμβάλλουν σημαντικά στη σύνδεση φαρμάκου-υποδοχέα, γιατί ενισχύουν τον ετεροπολικό δεσμό



Σχέση δομής-δράσεως

Έχει αποδεικτεί ότι οι χημικές ουσίες (φάρμακα) που παρουσιάζουν παρόμοιες χημικές ή φυσικοχημικές ιδιότητες, έχουν και παρόμοιες φαρμακολογικές δράσεις.

Παρ όλα αυτά μικρές μεταβολές στις χημικές δομές πολλών φαρμάκων μπορούν να προκαλέσουν δραματικές αλλαγές στην συμπεριφορά τους.

Η χημική συγγένεια φαρμάκου-υποδοχέα, οφείλεται στα χημικά και φυσικά χαρακτηριστικά του υποδοχέα.

ΧΗΜΙΚΗ ΣΥΓΓΕΝΕΙΑ

- Είναι η ικανότητα σύνδεσης του φαρμάκου με τον υποδοχέα.
- Με άλλα λόγια, η χημική συγγένεια περιγράφει την τάση του φαρμάκου για σύνδεση με τον υποδοχέα.

ΑΝΤΑΓΩΝΙΣΜΟΣ

Το φάρμακο που προσδένεται στον υποδοχέα χωρίς να προκαλεί ενεργοποίηση εμποδίζοντας την πρόσδεση του αγωνιστή, λέγεται ανταγωνιστής του υποδοχέα (receptor antagonist).



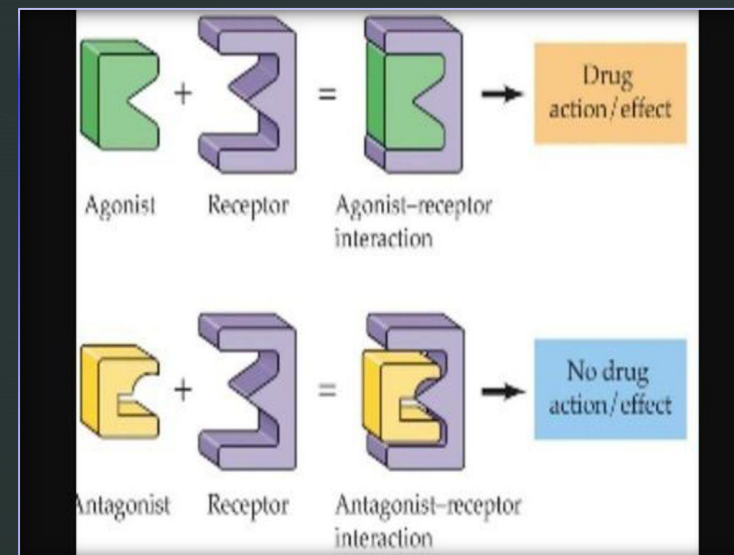
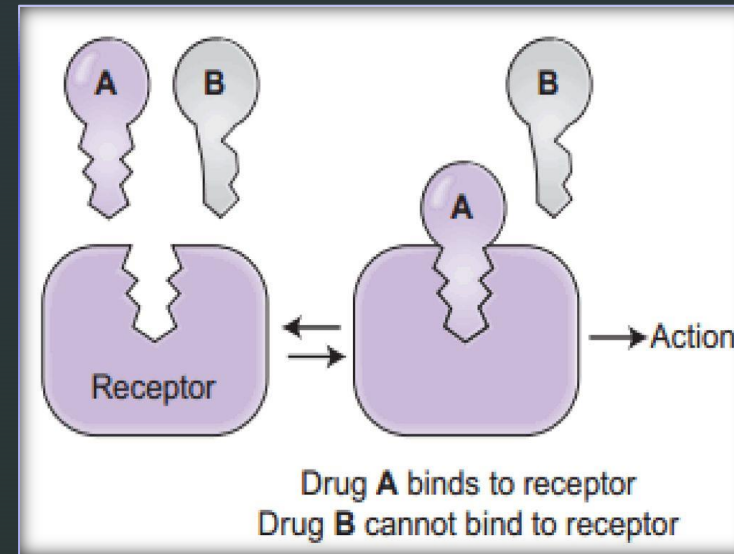
Ανταγωνισμός

Η εκλεκτική δράση των φαρμάκων μπορεί να ανασταλεί εκλεκτικά πάλι από άλλα φάρμακα.

Δηλαδή υπάρχουν ειδικές ουσίες, που ανταγωνίζονται την ειδική σύνδεση του φαρμάκου με τον υποδοχέα.

Αυτό συμβαίνει είτε διώχνοντας το φάρμακο από τον υποδοχέα, είτε δεσμεύοντας από πριν τον υποδοχέα, ώστε να μην είναι ελεύθερος να συνδεθεί το φάρμακο.

Οι χημικές αυτές ουσίες ονομάζονται **ΑΝΤΑΓΩΝΙΣΤΕΣ**.



Ανταγωνιστές

- Τα φάρμακα- ανταγωνιστές έχουν παρόμοια χημικά και φυσικά χαρακτηριστικά με τα φάρμακα (αγωνιστές) που ανταγωνίζονται.
- Η ανταγωνιστική τους δράση βασίζεται είτε στη μεγάλη χημική συγγένεια που παρουσιάζουν με τον υποδοχέα.
- Είτε γιατί χορηγούνται σε μεγαλύτερη ποσότητα από το φάρμακο.
- Στο φαινόμενο του ανταγωνισμού οφείλουν τη δράση τους τα περισσότερα αντίδοτα των δηλητηρίων.



ΣΑΣ ΕΥΧΑΡΙΣΤΩ
ΓΙΑ ΤΗΝ
ΠΡΟΣΟΧΗ ΣΑΣ!

