

Classificação: Artigo

Seletividade funcional e modificador da senso percepção.

Agonist-trafficking and hallucinogens.

Autoria: Javier González-Maeso; Stuart C. Sealton.

Panorâmica:

Introdução: Receptor com sete domínio transmembranico, também denominados receptores acoplados à proteína G (GPCRs), representam o alvo molecular mais comum para drogas terapêuticas. O modelo farmacológico geralmente aceito para ativação de GPCR é o modelo complexo ternário, no qual os GPCRs existem em um equilíbrio dinâmico entre os estados conformacionais ativos e inativos. No entanto, a demonstração de que diferentes agonistas às vezes provocam uma ativação relativa diferente de duas vias de sinalização a jusante do mesmo receptor levou a uma revisão do modelo do complexo ternário. De acordo com esse modelo de seletividade funcional, os agonistas estabilizam conformações de receptores ativados distintos que preferencialmente ativam vias de sinalização específicas. Drogas modificadora do senso percepção e drogas não modificadora do senso percepção representam um sistema experimental atraente com o qual se estuda a seletividade funcional de sinalização de receptores. Assim, muitas das respostas comportamentais induzidas por drogas modificadora da senso percepção, como a dietilamida do ácido lisérgico (LSD), a psilocibina ou a mescalina, dependem da ativação dos receptores da serotonina 5-HT_{2A} (5-HT_{2ARs}). Em contraste, esse estado neuropsicológico em seres humanos não é induzido por substâncias químicas intimamente relacionadas, como a lisurida ou a ergotamina, apesar de sua atividade in vitro semelhante no 5-HT_{2AR}.

Métodos: Nesta revisão, resumimos o conhecimento atual, bem como questões não resolvidas, sobre o tráfico de agonistas e o mecanismo de ação de drogas alucinógenas. psilocibina ou mescalina, dependem da ativação dos receptores 5-HT_{2A} da serotonina (5-HT_{2ARs}). Em contraste, esse estado neuropsicológico em seres humanos não é induzido por substâncias químicas intimamente relacionadas, como a lisurida ou a ergotamina, apesar de sua atividade in vitro semelhante no 5-HT_{2AR}.

Resultados: Nesta revisão, resumimos o conhecimento atual, bem como questões não resolvidas, sobre a seletividade funcional e o mecanismo de ação de drogas modificadora da senso percepção. psilocibina ou mescalina, dependem da ativação dos receptores 5-HT_{2A} da serotonina (5-HT_{2ARs}). Em contraste, esse estado neuropsicológico em seres humanos não é induzido por substâncias químicas intimamente relacionadas, como a lisurida ou a ergotamina, apesar de sua atividade in vitro semelhante no 5-HT_{2AR}.

Conclusão: Nesta revisão, resumimos o conhecimento atual, bem como questões não resolvidas, sobre a seletividade funcional e o mecanismo de ação de drogas modificadora da senso percepção.

Palavras-chave: Agentes Psicotomiméticos; Psilocibina; seletividade funcional; Banisteriopsis.

Overview

Keywords: Psychotomimetic Agents; Psilocybin; Agonist-trafficking; Banisteriopsis.

Publicado em: *Current Medicinal Chemistry*, v.16, n.8, p.1017-1027, 2009.

Link para o resumo: <https://www.ncbi.nlm.nih.gov/pubmed/19275609>