FICHA IDENTIFICATIVA

Datos de la Asignatura

Código	43029
Nombre	Interacción fármaco-receptor
Ciclo	Máster
Créditos ECTS	4.0
Curso académico	2021 - 2022

Titulación(es)

Titulación	Centro	Curso	Periodo
2138 - Máster Universitario en Investigación y Uso Racional del Medicamento	Facultad de Farmacia y Ciencias de la Alimentación	1	Primer cuatrimestre
3103 - Doct. en Biomedicina y Farmacia	Escuela de Doctorado	0	Primer cuatrimestre

Materias

Titulación	Materia	Carácter
2138 - Máster Universitario en Investigación y Uso Racional del Medicamento	7 - Interacción fármaco-receptor	Optativa

Coordinación

Nombre	Departamento
IVORRA INSA, MARIA DOLORES	135 - Farmacología
NOGUERA ROMERO, MARIA ANTONIA	135 - Farmacología

RESUMEN

Asignatura en la que, a partir de los conceptos básicos de la interacción fármaco-receptor, se van desarrollando los mecanismos moleculares, bioquímicos y fisiológicos así como los modelos matemáticos que permiten estudiar y comprender el concepto de receptor y su modulación farmacológica. Sirve de base para la comprensión de una gran parte de los mecanismos farmacológicos básicos sobre los cuales gira la investigación en farmacología por lo que resulta de interés para los estudiantes que orienten su formación hacia la investigación del mecanismo de acción de los fármacos, pero también para aquellos que necesiten una formación sólida en los mecanismos moleculares de transducción de señales.

CONOCIMIENTOS PREVIOS

Relación con otras asignaturas de la misma titulación

No se han especificado restricciones de matrícula con otras asignaturas del plan de estudios.

Otros tipos de requisitos

Se requieren conocimientos previos de Farmacología y de inglés.

COMPETENCIAS (RD 1393/2007) // RESULTADOS DEL APRENDIZAJE (RD 822/2021)

2138 - Máster Universitario en Investigación y Uso Racional del Medicamento

- Utilizar adecuadamente las herramientas informáticas, métodos estadísticos y de simulación de datos, aplicando los programas informáticos y la estadística a los problemas biomédicos
- Que los/las estudiantes sean capaces de integrar conocimientos y enfrentarse a la complejidad de formular juicios a partir de una información que, siendo incompleta o limitada, incluya reflexiones sobre las responsabilidades sociales y éticas vinculadas a la aplicación de sus conocimientos y juicios.
- Que los/las estudiantes sepan comunicar sus conclusiones y los conocimientos y razones últimas que las sustentan a públicos especializados y no especializados de un modo claro y sin ambigüedades.
- Ser capaces de trabajar en equipo con eficiencia en su labor profesional o investigadora.
- Ser capaces de realizar una toma rápida y eficaz de decisiones en su labor profesional o investigadora.
- Ser capaces de acceder a la información necesaria (bases de datos, artículos científicos, etc.) y tener suficiente criterio para su interpretación y empleo.
- Poseer y comprender conocimientos que aporten una base u oportunidad de ser originales en el desarrollo y/o aplicación de ideas, a menudo en un contexto de investigación.
- Saber redactar y preparar presentaciones para posteriormente exponerlas y defenderlas.
- Ser capaces de acceder a herramientas de información en otras áreas del conocimiento y utilizarlas apropiadamente.
- Ser capaces de aplicar la experiencia investigadora adquirida en labores propias de su profesión, tanto en la empresa privada como en organismos públicos.
- Capacidad de seleccionar y gestionar los recursos disponibles (instrumentales y humanos) para optimizar resultados en investigación.
- Dominar el método científico, el planteamiento de protocolos experimentales y la interpretación de resultados en la búsqueda, desarrollo y evaluación de nuevos fármacos.

RESULTADOS DE APRENDIZAJE (RD 1393/2007) // SIN CONTENIDO (RD 822/2021)

Al finalizar el proceso de enseñanza-aprendizaje el estudiante deberá ser capaz de:

1. Familiarizarse con el concepto de receptor y los mecanismos moleculares de transducción de señales, tanto desde el punto de vista conceptual como metodológico.

2. Analizar un problema y optimizar los recursos metodológicos para la resolución del mismo

3. Dominar las técnicas de laboratorio habituales para el estudio de receptores y saber analizar los resultados experimentales obtenidos.

4. Planificar la organización adecuada para realizar un trabajo en equipo y llevarlo a cabo de manera eficiente.

5. Buscar y localizar los artículos y revisiones necesarios para plantear un proyecto de investigación basado, desde el punto de vista metodológico, en estudios funcionales de órgano aislado y ensayos de unión de radioligandos.

6. Construir un artículo científico o una exposición oral de forma estructurada y concisa sobre las interacciones ligando-receptor y los mecanismos de transducción.

DESCRIPCIÓN DE CONTENIDOS

1. ASPECTOS TEÓRICOS DE LA INTERACCIÓN FÁRMACO-RECEPTOR

Desarrollo del concepto de señalización a través de receptores como mecanismo fundamental para la modulación fisiológica o farmacológica de los procesos celulares.

Especificación de contenidos de la unidad:
Concepto de receptor y su repercusión en las Ciencias Biomédicas.
Teoría de la interacción fármaco-receptor. Modelos de activación de receptores.
Actividad constitutiva: Agonismo, Agonismo Inverso, Antagonismo.
Sistemas de transducción de la señal.
Mecanismos de regulación fisiológica y farmacológica de receptores.

2. TECNICAS DE ESTUDIO DE LOS RECEPTORES

Manejo de los mecanismos moleculares de transducción de señales, tanto desde el punto de vista conceptual como metodológico, incluyendo pruebas de laboratorio y análisis de los resultados obtenidos.

Especificación de contenidos de la unidad:
Unión de radioligandos específicos y de ligandos fluorescentes.
Western blotting, inmunoprecipitación, inmunofluorescencia.
Análisis de la expresión de receptores mediante RT-PCR cuantitativa a tiempo real.

Análisis de la funcionalidad de los receptores: técnicas de órgano aislado.
Otras técnicas de estudio: microscopiía laser confocal.

VOLUMEN DE TRABAJO

ACTIVIDAD	Horas	% Presencial
Prácticas en laboratorio	15,00	100
Clases de teoría	10,00	100
Seminarios	10,00	100
Trabajos en grupo	5,00	100
Elaboración de trabajos en grupo	25,00	0
Elaboración de trabajos individuales	10,00	0
Estudio y trabajo autónomo	10,00	0
Lecturas de material complementario	10,00	0
Preparación de actividades de evaluación	10,00	0
Preparación de clases prácticas y de problemas	10,00	0
Resolución de cuestionarios on-line	10,00	0
TOTAL	**125,00**	

METODOLOGÍA DOCENTE

Durante las actividades, tanto teóricas como prácticas, se indicarán las aplicaciones de los contenidos de la asignatura en relación con los Objetivos de Desarrollo Sostenible (ODS). Con ello se pretende proporcionar conocimientos, habilidades y motivación para comprender y abordar dichos ODS, a la vez que se promueve la reflexión y la crítica.

Clases teóricas lección magistral participativa

Discusión de artículos (lecturas)

Seminarios

Prácticas de laboratorio y aula de informática

Desarrollo de proyectos

Debate o discusión dirigida

Conferencias de expertos

El curso se estructura en una serie de clases magistrales, que introducirán al estudiante en los conceptos teóricos de la interacción fármaco-receptor, para, a partir de ellas, plantear al estudiante un problema experimental que debe resolver. Con los conocimientos que ha adquirido y con bibliografía adicional disponible en el Aula Virtual, el estudiante debe elaborar un protocolo experimental adecuado para resolver el problema, ejecutarlo en el laboratorio, obtener unos resultados experimentales, analizarlos y

desarrollar por escrito un informe de todas estas actividades siguiendo el esquema de un trabajo de investigación. Finalizará el curso con la exposición oral de los trabajos realizados.

Para completar la docencia presencial, los estudiantes podrán realizar cuestionarios on line, ejercicios prácticos, comentarios de artículos de investigación...

Como soporte de comunicación se utilizará la plataforma Aula Virtual de la Universitat de València, que permite la comunicación profesor-estudiantes y el almacenamiento de diapositivas.

Otros recursos didácticos que quedan a disposición de los estudiantes.

EVALUACIÓN

Evaluación continua:

Asistencia a clases presenciales 20%

Participación activa 10%

Examen de teoría 10%

Trabajo individual (problemas y cuestiones) 30%

Trabajo en grupo 30%

Para superar la asignatura se requerirá la asistencia al 80% de las sesiones presenciales y la obtención de una calificación mayor o igual al 50% dentro de cada apartado evaluado.

REFERENCIAS

Básicas

- WHALEN E.J., RAJAGOPAL S., LEFKOWITZ R.J. Therapeutic potential of b-arrestin- and G protein-biased agonists. Trends in Molecular Medicine (17): 2011.
- RAJAGOPAL S., RAJAGOPAL K., LEFKOWITZ R.J. Teaching old receptors new tricks:biasing seven-transmembrane receptors. Nature Reviews, 9, 2010.
- ZHOU X.E., MELCHER K., XU H.E. Understanding the GPCR biased signaling through G protein and arrestin complex structures. Current Opinion in Structural Biology. 45: 150-159, 2017.
- KENAKIN T. International Union of Basic and Clinical Pharmacology Review. New concepts in pharmacological efficacy at 7TM receptors: IUPHAR. Br. J. Pharmacol. 168: 554-575, 2013.
- SCHARGE R., DE MIN A, HOCHHEISER K, KOSTENIS E., MOHR K. Superagonism at G protein-coupled receptors and beyond. Br.J.Pharmacol. 173: 3018-3027, 2016.

- KENAKIN T. Signaling bias in drug discovery, Expert Opinion on Drug Discovery, 12:4, 321-333, 2017.
- JEAN-ALPHONSE F., HANYALOGLU A.C. Regulation of GPCR signal networks via membrane trafficking. Molecular and Cellular Endocrinology 331, 205214, 2011.
- ALEXANDER S.P., MATHIE A., PETERS J.A. Guide to Receptor and Channels, Br J. Pharmacol, 5th edition,(164):S1-S324, 2011.
- Rankovica Z,*, Tarsis F. Brustb, and Laura M. Bohnb,*"Biased agonism: An emerging paradigm in GPCR drug discovery"

Complementarias

- HALL and LANGMEAD. Matching models to data: a receptor pharmacologists guide. British Journal of Pharmacology DOI:10.1111/j.1476-5381.2010.00879.x
- Articulos en revistas especializadas
- SCHEERER P., SOMMER M.E. Structural mechanism of arrestin activation. Current Opinion in Structural Biology. 45: 160-169, 2017
- STODDART L.A., WHITE C.W., NGUYEN K., HILL S.J., PFLEGER K.D.J. Fluorescence- and bioluminescence-based approaches to study GPCR ligand binding. Br. J. Pharmacol. 173: 3028-3037, 2016.https://webges.uv.es/uvGuiaDocenteWeb/guia#
- SEGURA V, PÉREZ-ASO M, MONTO F, CARCELLER E, NOGUERA MA, PEDIANI J, MILLIGAN G, MC GRATH J, D´OCON MP. "Differences in the Signaling Pathways of a1A- and a1B Adrenoceptors Are Related to Different Endosomal Targeting" PlosOne 8(5): e64996, 2013.
- MC GRATH J. "Localization of -adrenoceptors: JR Vane Medal Lecture" Br. J. Pharmacol. 172: 1179-1194, 2015
- Von Moo E, van Senten JR, Bräuner-Osborne H, Møller TC. Arrestin-dependent and -independent internalization of GPCRs methods, mechanisms and implications on cell signaling. Mol Pharmacol. 2021; 99(4):242-255 DOI: 10.1124/molpharm.120.000192

ADENDA COVID-19

Esta adenda solo se activará si la situación sanitaria lo requiere y previo acuerdo del Consejo de Gobierno

1. Contenidos

Se mantienen los contenidos inicialmente programados.

2. Volumen de trabajo y planificación temporal de la docencia

Para impartir esta docencia, se mantienen los horarios programados y se dará libertad al estudiante para que realice el aprendizaje autónomo con los materiales que se van subiendo en el aula virtual, pero manteniendo el volumen de trabajo que marca la guía docente original . Las clases teóricas se impartirán mediante BBC. En el caso de prácticas de laboratorio se proporcionarán al estudiante datos de otras prácticas que puedan analizarlos y discutirlos. Previamente se les mostrará con ayuda de vídeos, powerpoint o programas informáticos, como sería la realización de la práctica en el laboratorio.

3. Metodología docente

-Subida de materiales en el Aula Virtual

En el caso de las sesiones de Seminarios teóricos/participativos, impartidos por profesorado externo, se proporcionarán a los alumnos (a través del Aula Virtual) los materiales previstos en la guía original, adaptados e incorporando anotaciones explicativas de modo que el estudiante pueda acceder a ellas en cualquier momento

-Videoconferència síncrona BBC

- Utilización del foro del aula virtual y el e-mail para atender las dudas

4. Evaluación

No es necesaria la adaptación del proceso de evaluación descrito en la guía docente.

5. Bibliografía

Se mantiene la misma bibliografía recomendada en la guía docente.