

AKTIVITAS INTRINSIK

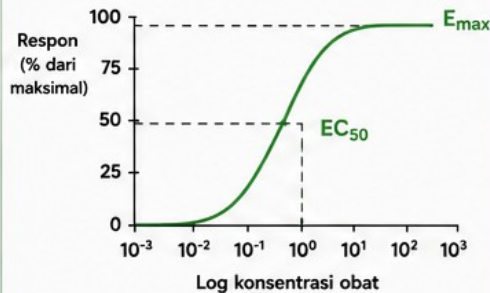
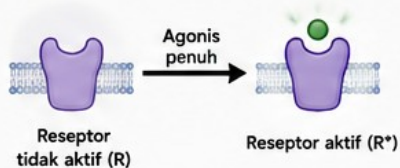
Kemampuan obat untuk mengaktivasi reseptor setelah berikatan

Obat yang berikatan dengan reseptor dapat memiliki aktivitas intrinsik (α) yang berbeda. Aktivitas intrinsik menentukan seberapa besar respon yang dihasilkan (E_{max}).

KATEGORI AKTIVITAS INTRINSIK

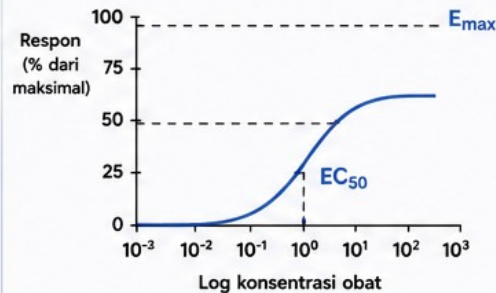
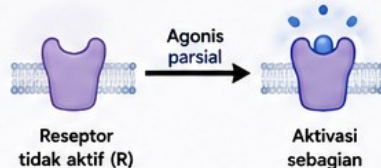
1. AGONIS PENUH (Full Agonist)

Menghasilkan aktivasi maksimum reseptor ($E_{max} = 100\%$).
Aktivitas intrinsik (α) = 1



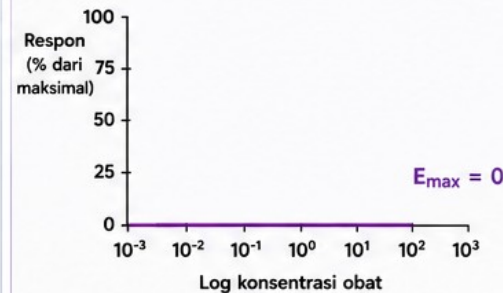
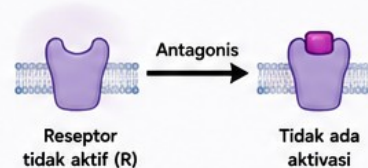
2. AGONIS PARSIAL (Partial Agonist)

Menghasilkan aktivasi kurang dari maksimum, meskipun semua reseptor terikat.
Aktivitas intrinsik ($0 < \alpha < 1$)



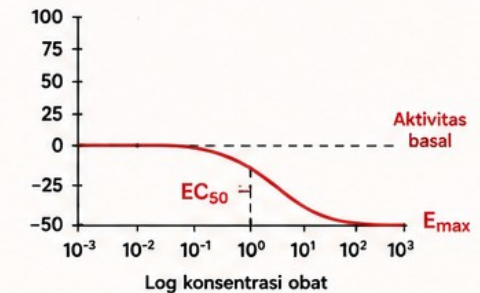
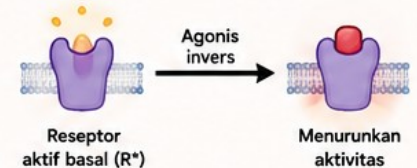
3. ANTAGONIS NETRAL (Antagonist)

Berikatan dengan reseptor tetapi tidak mengaktivasi reseptor.
Aktivitas intrinsik (α) = 0



4. AGONIS INVERS (Inverse Agonist)

Mengurangi aktivitas konstitutif reseptor (aktivitas basal) di bawah tingkat basal.
Aktivitas intrinsik ($\alpha < 0$)



RINGKASAN

Agonis Penuh

Agonis Parsial

Antagonis Netral

Agonis Invers

Aktivitas intrinsik (α)

= 1

$0 < \alpha < 1$

= 0

$\alpha < 0$

E_{max} (efek maksimal)

100% (maksimal)

< 100%

0

Negatif (di bawah basal)

Efek pada reseptor

Mek pada reseptor

Mengaktivasi sebagian

Tidak mengaktivasi

Menghambat aktivitas basal

Contoh

Norepinefrin, Fenilefrin

Aripiprazole, Pindolol

Nalokson, Atropin

Beberapa antihistamin (H_2) seperti Ranitidin*

Kurva dosis-respon menunjukkan hubungan antara konsentrasi obat (sumbu X, skala log) dan respon biologis (sumbu Y).

- EC_{50} = konsentrasi obat yang menghasilkan 50% dari E_{max} .
- E_{max} = efek maksimal yang dapat dicapai obat.

*Contoh agonis invers pada reseptor H_2 .