




MÓDULO 2

FARMACOCINÉTICA y FARMACODINAMIA

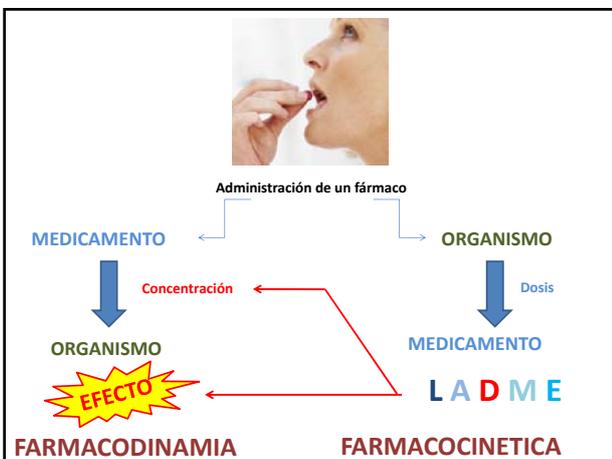
1

Partes de la Farmacología

Según el objeto del estudio se puede dividir:

- **FARMACODINAMIA:** Estudia las acciones y efectos de los fármacos (lo que el fármaco hace en el organismo)
- **FARMACOCINETICA:** Estudia los procesos y factores que van a determinar la cantidad de fármaco (procesos que hace el organismo sobre el fármaco)
- **FARMACOLOGIA TERAPEUTICA:** Estudia la aplicación del fármaco en el ser humano (para qué sirve)
- **FARMACOLOGIA TOXICOLOGICA:** Estudia los efectos nocivos del fármaco así como las condiciones y mecanismos que favorecen la existencia de esa toxicidad y su aplicación

2



FARMACOCINÉTICA

- La farmacocinética se define como el estudio del comportamiento o evolución temporal, desde un punto de vista cuantitativo, de los fármacos en el organismo, desde que son administrados hasta que se eliminan.
 - Los componentes básicos de la farmacocinética son:
 - Liberación del fármaco del preparado farmacológico
 - Absorción o paso del fármaco a la sangre
 - Distribución en el organismo
 - Metabolismo
 - Eliminación
- }

LADME
- La farmacocinética permite definir y cuantificar parámetros como:
 - Velocidad de absorción del fármaco
 - Biodisponibilidad
 - Vida media de eliminación
 - Concentración plasmática total del fármaco
 - Área bajo la curva

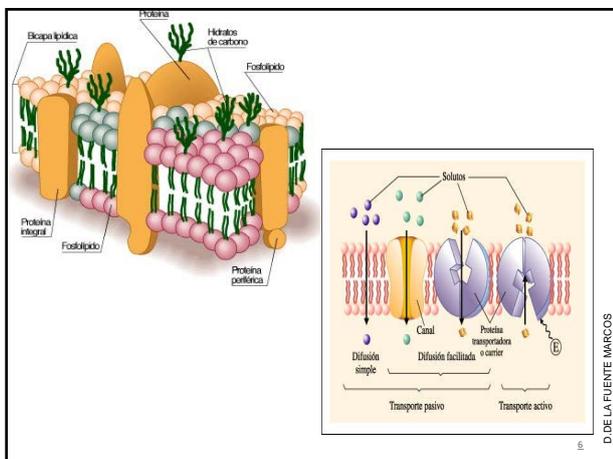
4

MECANISMOS DE TRANSPORTE

Las moléculas de fármaco deben atravesar membranas formadas por una doble capa lipídica

- A través de poros: Fármacos con bajo Peso Molecular (PM) e Hidrosolubles
- Difusión pasiva o simple: Fármacos con bajo PM y liposolubles
A favor de gradiente de concentración
- Difusión facilitada: Fármacos sin suficiente liposolubilidad y PM no muy pequeño
A favor de gradiente de concentración
Transportadores especiales. Saturable
- Transporte activo: Fármacos sin suficiente liposolubilidad y PM no muy pequeño
En contra de gradiente de concentración
Transportadores específicos. Saturable. Requiere energía
- Pinocitosis: Fármacos con elevado PM

5



6

La mayoría de los fármacos son ácidos o bases débiles (no ionizados y liposolubles) que atraviesan fácilmente las membranas celulares ya que estas tienen naturaleza lipídica.

LIBERACIÓN

Para que el fármaco se absorba, debe estar disuelto y, por tanto, se ha de liberar de la forma de dosificación que lo contiene.

La preparación farmacéutica condiciona la velocidad con que el fármaco se libera, se disgrega y se disuelve.

ABSORCIÓN

La absorción supone el paso de las moléculas del fármaco desde el lugar de administración a la circulación sistémica.

La absorción de un fármaco depende de las siguientes características:

Características del fármaco

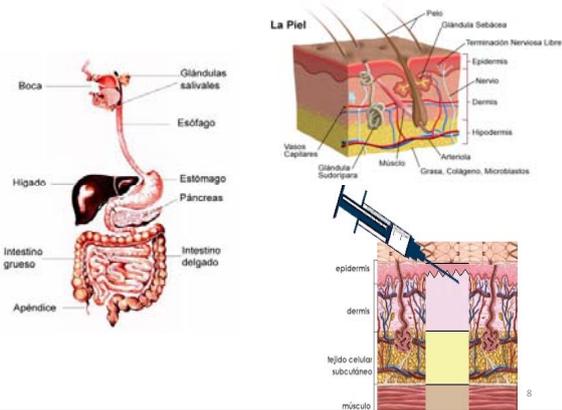
- Concentración
- Peso molecular
- Liposolubilidad
- Velocidad de absorción

Características del lugar de absorción

- Vía de administración
- Sitio de absorción
- Tiempo en contacto con la superficie de absorción
- Superficie de absorción
- Espesor de la membrana
- Flujo sanguíneo
- pH

2

PUNTOS DE ABSORCIÓN



Efecto del pH sobre la absorción y eliminación de fármacos

	<u>pH ácido</u>	<u>pH alcalino</u>
Fármaco ácido	Predomina la forma no ionizada (liposoluble) Facilita la absorción Dificulta la eliminación $AH \rightleftharpoons A^- + H^+$	Predomina la forma ionizada (hidrosoluble) Dificulta la absorción Facilita la eliminación $AH \rightleftharpoons A^- + H^+$
Fármaco alcalino	Predomina la forma ionizada (hidrosoluble) Dificulta la absorción Facilita la eliminación $BOH \rightleftharpoons B^+ + OH^-$	Predomina la forma no ionizada (liposoluble) Facilita la absorción Dificulta la eliminación $BOH \rightleftharpoons B^+ + OH^-$

9

DISTRIBUCIÓN

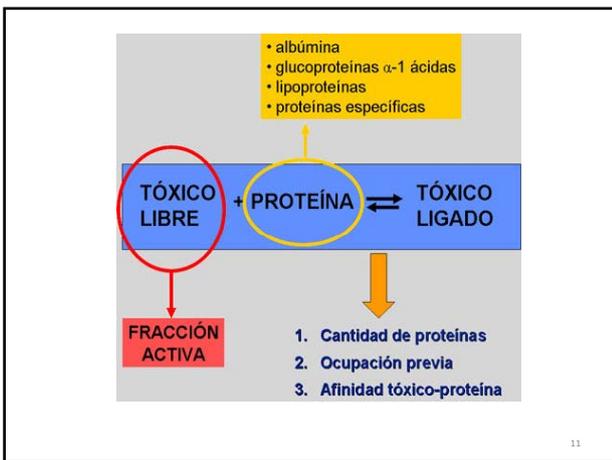
Proceso farmacocinético por el cual el fármaco es transportado por la sangre desde el lugar de absorción hasta el órgano diana, donde ejercerá su acción.

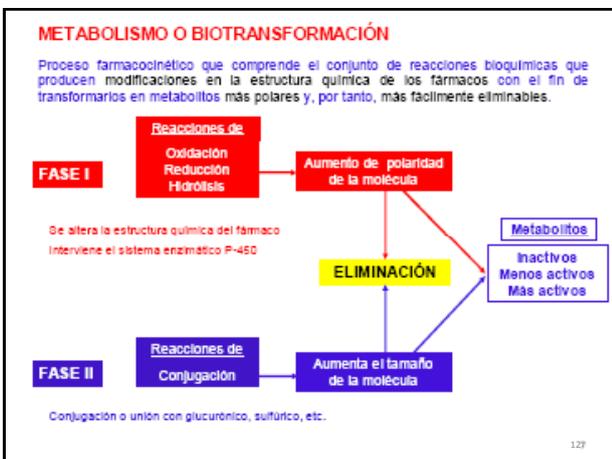
Las moléculas del fármaco pueden unirse a proteínas plasmáticas como la **albúmina**, cumpliendo en ocasiones con otros fármacos o sustancias

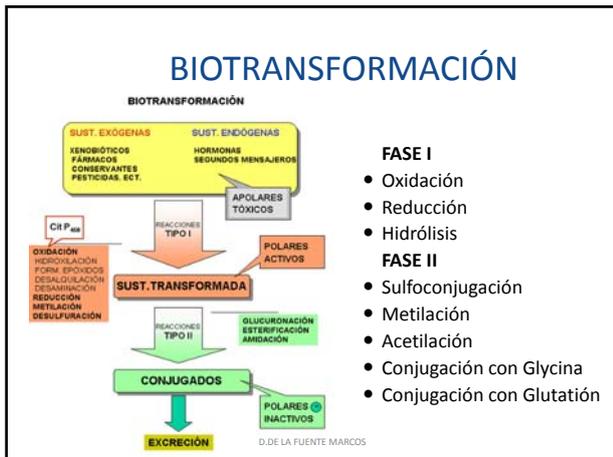
La velocidad, el grado de distribución en los distintos tejidos y el paso de los fármacos a través de las distintas barreras depende de múltiples factores:

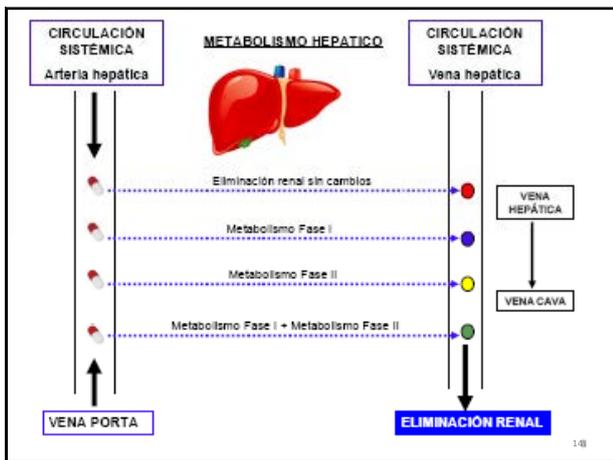
- Propiedades fisicoquímicas del fármaco
- La afinidad del fármaco por las moléculas transportadoras
- Posibles interacciones
- El flujo sanguíneo del tejido
- Factores patológicos como la inflamación
- La existencia de barreras especiales (placentaria, hematoencefálica)
- El tamaño de los órganos
- La solubilidad del fármaco en el tejido
- La unión del fármaco a macromoléculas del órgano

106









Factores que pueden modificar el metabolismo de un fármaco:

- Factores fisiológicos: Edad, sexo
- Patologías que afectan al hígado
- Unión a proteínas plasmáticas
- Inhibidores o inductores enzimáticos

→ Inhibidor: sustancia o fármaco que reduce el metabolismo de otro, aumentando su concentración, pudiendo llegar a niveles tóxicos.

Aloprinolol	Eritromicina
Cimetidina	Corticoides

→ Inductor: Sustancia o fármaco que aumenta el metabolismo de otros fármacos. Si el metabolito es inactivo se reduce el efecto y si es activo aumenta la actividad farmacológica.

Tabaco	Fenobarbital
Etanol	Rifampicina

Efecto de primer paso

Se entiende por primer paso hepático la metabolización del fármaco absorbido en el tracto gastrointestinal que llega al hígado a través de la vena porta y se metaboliza en él antes de llegar a la circulación sistémica

159

ELIMINACIÓN

Proceso por el cual los fármacos inalterados o sus metabolitos son expulsados al exterior del organismo.

La capacidad de eliminación o aclaramiento determinará la concentración en sangre y tejidos. A mayor aclaramiento, menores niveles plasmáticos durante menos tiempo.

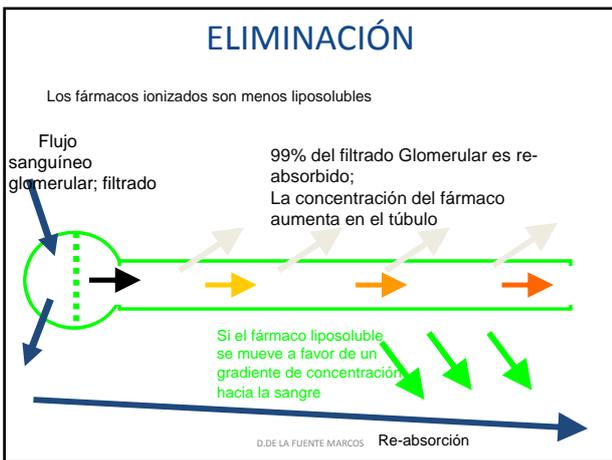
El principal órgano excretor es el riñón, pudiéndose eliminar también por otras vías, como la biliar, pulmonar y salivar, además de por la leche materna y sudor.

La vía de eliminación renal posee dos mecanismos distintos de excreción de fármacos:

- 1.- Filtración glomerular
- 2.- Secreción tubular activa

No todo el fármaco o los metabolitos filtrados se eliminan, ya que algunos de ellos si son formas no ionizadas de ácidos o bases débiles, se pueden reabsorber en un proceso de reabsorción tubular pasiva en el túbulo distal, volviendo el fármaco a circulación sanguínea

190



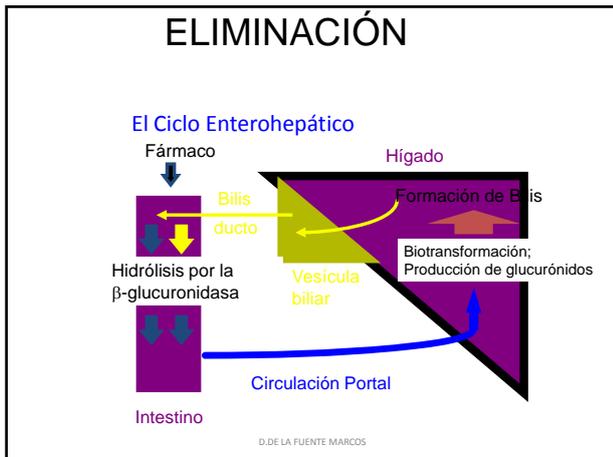
La excreción renal puede alterarse por:

- ◆ Edad
- ◆ Procesos patológicos (Insuficiencia renal)
- ◆ Modificación del flujo sanguíneo renal
- ◆ Modificación del pH de la orina

Otras vías de eliminación de fármacos y sus metabolitos:

- ✓ Por heces de forma inalterada
- ✓ Por biles, produciéndose reabsorción a nivel del Intestino (circulación enteronepática) y siendo eliminados finalmente por la orina y parcialmente por las heces
- ✓ Por saliva, volviendo a ser deglutidos y reabsorbidos a nivel gastrointestinal
- ✓ Pueden pasar a la leche materna y, por tanto, al lactante
- ✓ Por vía pulmonar, como los gases anestésicos generales
- ✓ Por el sudor

191



FARMACODINAMIA

La farmacodinamia estudia la acción y mecanismo de acción de los fármacos sobre el organismo.

Se denomina acción farmacológica a la modificación que produce un fármaco sobre procesos fisiológicos del organismo. Estas modificaciones son siempre cuantitativas

Los fármacos actúan con un mecanismo de acción específico y su efecto se produce tras la interacción o unión selectiva del fármaco con moléculas celulares, llamadas receptores, situados en la membrana o interior de las células, de igual forma que las sustancias endógenas.

Los receptores son macromoléculas de naturaleza proteica en las cuales encajan las moléculas de los fármacos, para formar uniones complejas, generalmente reversibles.

La unión fármaco-receptor es muy específica

Pequeñas variaciones en la estructura química de un fármaco pueden dar lugar a modificaciones en el efecto farmacológico.

292

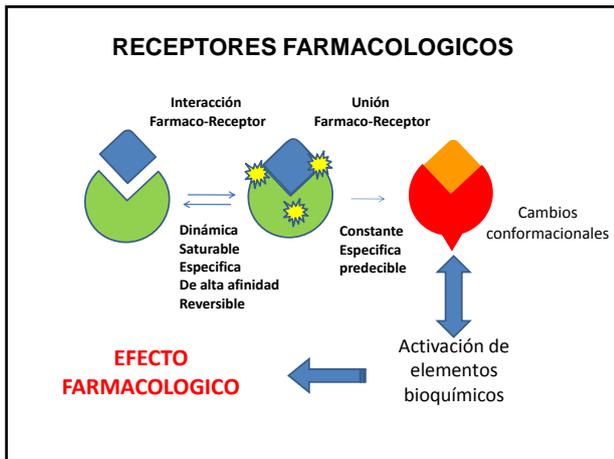
Requisitos o características de la unión FÁRMACO-RECEPTOR

- **AFINIDAD** Capacidad para interactuar o encajar y formar el complejo Fármaco-Receptor
- **ESPECIFICIDAD** Capacidad de discriminar una molécula de otra, aun siendo parecidas
- **ACTIVIDAD INTRÍNSECA** Capacidad para activar el receptor y producir un efecto

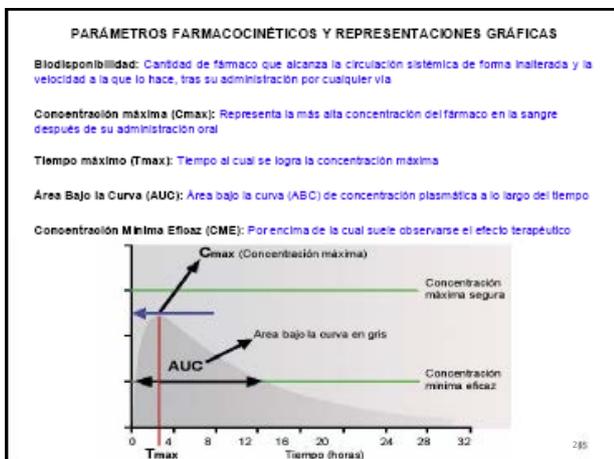
Tipos de fármacos para un mismo receptor:

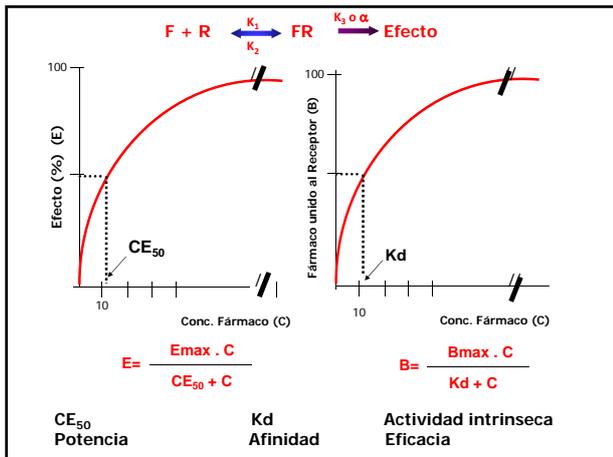
	AFINIDAD	ESPECIFICIDAD	ACTIVIDAD INTRÍNSECA (VALOR)	
AGONISTA	SI	SI	SI	(1)
ANTAGONISTA	SI	SI	NO	(0)
AGONISTA PARCIAL	SI	SI	SI	(0 a 1)

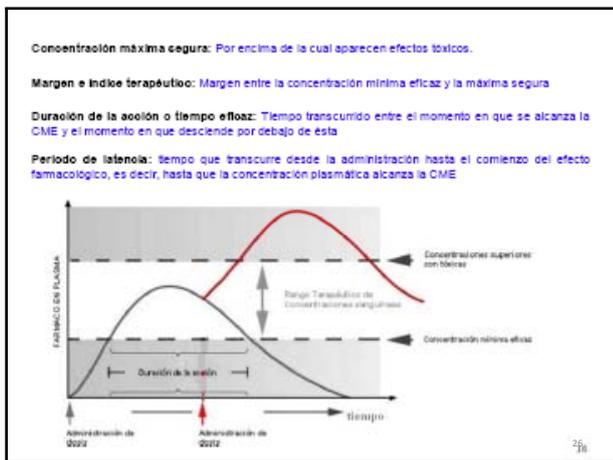
213



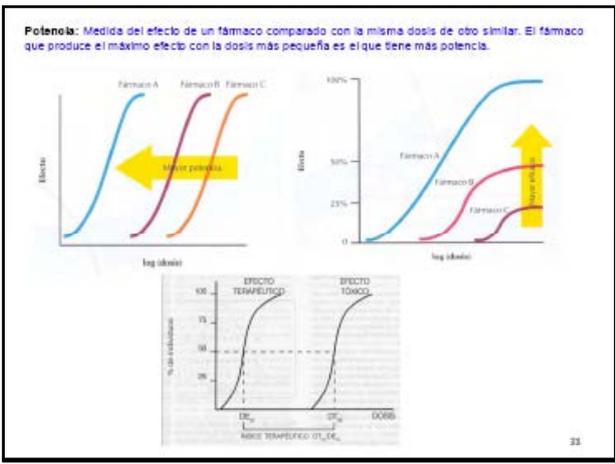












MUCHAS GRACIAS POR VUESTRA ATENCIÓN
domifunte@hotmail.com

32
