

# PRINCIPIOS DE FARMACOCINÉTICA Y VÍAS DE ADMINISTRACIÓN

**DRA. CINDY LIZETH DE LOS SANTOS CANDELARIA**

# Definiciones

- **Fármaco:**
  - Sustancia pura, químicamente definida, extraída de fuentes naturales o sintetizada en el laboratorio, que posee acción biológica y que se puede aprovechar o no, por sus efectos terapéuticos.
- **Medicamento:**
  - Esta constituido por uno o varios principios activos o excipientes

# Definiciones

- Farmacocinética:
  - Es la relación que existe entre la dosis administrada y la concentración plasmática lo cual implica el estudio de los diferentes procesos de absorción, distribución y biotransformación, en definitiva “que el organismo hace con el fármaco”.
  - Determina la concentración de los fármacos en el receptor y por lo tanto contribuye a la intensidad de la respuesta observada.

# Ciclo intraorgánico del fármaco

Absorción: forma en la que el fármaco penetra en el organismo

Distribución: localización del fármaco en el organismo

Metabolismo: forma en la que organismo modifica químicamente el fármaco

Excreción: forma en la que organismo elimina el fármaco

# Absorción

- Proceso farmacocinético mediante el cual un fármaco llega a la circulación general.
- Comprende las etapas de **liberación** de su forma farmacéutica, su **disolución**, la entrada al organismo desde el lugar de administración, los mecanismos de transporte, la velocidad y la cantidad de fármaco que accede a la circulación sistémica.
- En los medicamentos por vía intravenosa no se da esta parte, va directo a la sangre.
- **Vida media de absorción:** tiempo que se ocupa para que el 50% que se administró se absorba.

# Mecanismos de absorción de fármacos

## Difusión pasiva / osmosis.

- Los fármacos liposolubles atraviesan fácilmente las membranas celulares de forma pasiva, mediante gradiente de concentración

## Difusión facilitada.

- Mediante proteínas transportadoras también, pero NO necesita energía. Son saturables (si hay mucho fármaco) y selectivos (vale sólo para un tipo de neurotransmisor o fármaco). A favor del gradiente de concentración.

## Transporte activo.

- Se hace mediante un transportador de membrana que conduce el fármaco contra un gradiente. Para ello necesita energía. Funciona contra el gradiente electroquímico. Es saturable y selectivo (susceptible de inhibición competitiva).

## Endocitosis / Pinocitosis

# Biodisponibilidad

- Es el porcentaje de medicamento que llega a la sangre. Fracción de la dosis que llega al torrente circulatorio y a su lugar de acción.
- Implica aquellas modificaciones que pueden darse inclusive en el metabolismo de primera fase, para que el fármaco llegue a una concentración plasmática.

# Distribución

El medicamento puede circular o libre, o unido a proteínas plasmáticas.

Eficaz solo la parte que va libre, porque puede salir del torrente sanguíneo (y necesita llegar a las neuronas).

La importancia reside en que explicará casos de interacciones medicamentosas: interacción medicamentosa.



# ELIMINACIÓN

Cada vez q la sangre con medicamento pasa por el hígado o intestino, éste metaboliza y reduce su biodisponibilidad.

Cuando se habla de aclaramiento no sólo se refiere al riñón, también se da a nivel biliar, hepático, en glándulas exocrinas.

**Vida media de eliminación:** el tiempo necesario para reducir a la mitad la concentración inicial del fármaco

# VÍAS DE ADMINISTRACIÓN

# UDS Clasificación

Oral: polvos, granulados, comprimidos, cápsulas, jarabes, suspensiones, emulsiones.

Rectal y vaginal: Supositorios, enemas, óvulos, comprimidos vaginales, dispositivos intrauterinos.

Tópica y subcutánea: Pomadas, cremas, geles, pastas, parches, implantes.

Oftálmica y ótica: colirios, pomadas, emulsiones, insertos oftálmicos, gotas.

Parenteral: Inyectables para vía intravascular (intravenosa, intraarterial) o para vía extravascular (intradérmica, subcutánea, intramuscular, intratecal, epidural, intraperitoneal)

Inhalatoria: gases medicinales (anestésicos), aerosoles.

# UDS

## Oral

- La vía oral constituye la vía más utilizada de administración de fármacos.
- Inconvenientes:
  - No se puede utilizar en pacientes con dificultad para deglutir, convómitos o si están inconscientes.
  - Sabor desagradable
  - Irritación gástrica

# Tipos de formas orales

Comprimidos: obtenidos por compresión mecánica del granulado.

- Ventajas: bajo coste, precisión en la dosificación y prolongado periodo de validez.
- Desventajas: Limitado uso en pacientes que no pueden deglutir, problemas de biodisponibilidad.

Cápsulas: Cubierta gelatinosa en cuyo interior se encuentra dosificado el fco.

- Ventajas: buena estabilidad y biodisponibilidad, fácil elaboración.
- Desventajas: Mayor coste que los comprimidos, limitaciones de contenido, no pueden fraccionarse ni ser utilizadas por pacientes con problemas de deglución.

# Tipos de formas orales

Polvos: Cada dosis se administra previa preparación de una solución extemporánea en agua u otra bebida. Dosis unitarias (bolsas y papelillos).

Granulados: Agregados de partículas de polvos que incluyen principios activos, azúcares y coadyuvantes. Se puede administrar esta ff o puede servir como intermedio para la obtención de comprimidos o relleno de cápsulas.

# Tipos de formas líquidas

Los líquidos para administración oral son habitualmente soluciones, emulsiones o suspensiones que contienen uno o más principios activos disueltos en un vehículo apropiado.

Las formas líquidas para administración oral más usuales son:

- Jarabe: solución acuosa edulcorada.
- Elixir: solución hidroalcohólica edulcorada.
- Suspensión y suspensión extemporánea (se prepara en el momento de ser administrada): admon de principios activos poco solubles en agua .
- Emulsiones fluidas (ppios activos liposolubles: vitaminas liposolubles)

# UDS SUBLINGUAL

La mucosa sublingual está muy vascularizada: rápida velocidad de absorción.

Ausencia de efecto de primer paso.

formas: comprimidos y aerosoles.

- Comprimidos: redondeado, elíptico o biconvexo, sin ángulos y lo más pequeño posible para minimizar la secreción de saliva (y la deglución).
- Aerosoles: pulsar del spray con el dedo índice, dirigiendo el chorro a la región sublingual. Cerrar la boca y permanecer unos segundos sin deglutir (sin tragar) para facilitar la absorción del medicamento.



# RECTAL

Absorción más lenta que la gastrointestinal

Formas farmacéuticas:

- Supositorios: ff sólida, forma cónica u ovoide, que al fundirse en el recto libera los medicamentos que contiene.
- Enemas: ff líquidas, de absorción colónica y elevada biodisponibilidad en velocidad (fcos lipófilos)

Tres tipos de acciones:

- Mecánica: efecto laxante.
- Tópica localizada: antihemorroidales.
- Sistémica: antitérmicos.

# VAGINAL

Administración de medicamentos con efecto a nivel local o sistémico.

La biodisponibilidad depende: espesor del epitelio vaginal, composición del fluido y pH.

Formas farmacéuticas:

- Soluciones
- Comprimidos
- Óvulos (“supositorios vaginales”)
- Gel
- Espumas
- Anillos vaginales (anticonceptivo hormonal).

# UDS

## PARENTERAL

Inyectables: disoluciones, emulsiones o suspensiones estériles y apirógenas.

### Requerimientos:

- Limpidez: ausencia de partículas en suspensión detectables mediante controles ópticos.
- Neutralidad: el pH del organismo humano oscila 7,3-7,4, es recomendable regular los preparados alrededor de este valor.
- Isotonía: es isotónico con la sangre si al ponerla en contacto con eritrocitos no experimentan alteración. Obligatorio en admon en LCR.
- Estéril: ausencia de microorganismos (formas vegetativas y de resistencia). Obligatorio para todos los inyectables.
- Apirógena: ausencia de sustancia que provoque un proceso febril. Obligatorio en inyectables.

vía de urgencia, ofrece una respuesta:

- Rápida
- Intensa
- Sistémica

Administración en forma de bolus o perfusión.

Lugar de administración: antebrazo, muñeca o vía central (tratamientos largos).

Administración de soluciones acuosas. Excepciones:

- Emulsiones lipídicas para nutrición parenteral.
- Vitamina K (solución oleosa)
- Anfotericina B (liposomas).
- Ciclosporina (solución oleosa, emulsión lipídica)

INTRAMUSCULAR

SUBCUTANEO

ENDOVENOSO

INTRADERMICA

