

MEDICINA HUMANA

CAMPUS SAN CRISTOBAL DE LAS CASAS

TERAPEUTICA FARMACOLOGICA

DR. MANUEL EDUARDO GOMEZ LOPEZ

MAPA CONCEPTUAL

FARMACOCINETICA Y FARMACODINAMIA DE LAS FAMILIAS DE FARMACOS

JUDITH ANAHI DIAZ GOMEZ

4° SEMESTRE 2° UNIDAD

San Cristóbal de las casas Chiapas a 28 de abril del 2023.

ANESTESICOS LOCALES

Farmacocinético

Absorción

- Se absorben en la piel lesionada no intacta
- Muy rápida en todas las vías mucosas
- Su velocidad a la circulación depende de:
 - Características del área de aplicación
 - Concentración y dosis
 - Velocidad de inyección
 - Asociación con vasoconstricciones

Distribución

- De acuerdo al tipo de anestésico local.
- Tipo éster: es significativo pues se metaboliza muy rápido
- Tipo amida: atraviesan la barrera BHE y placenta, se acumulan en el músculo y pulmón.
- Se modifica debido: el grado de unión a las proteínas plasmáticas
- Estado de ionización
- El pH

Metabolismo

- Varía según el tipo de anestésico:
- Tipo de amida: metabolismo o lento a nivel hepático
- Tipo éster: $t_{1/2}$ es corto

Excreción

- Principalmente renal en forma de metabolitos libres o conjugados
- Solo el 1-5%, por la orina.
- Depende del pKa del fármaco, capacidad renal filtrado, fijación a proteínas plasmáticas y Ph de la orina.

Farmacodinamia

Los anestésicos locales bloquean (suprimen) la conducción nerviosa de un estímulo nociceptivo.

Actúan sobre cualquier zona sobre cualquier tipo de fibra nerviosa.

Actúan en la membrana celular de la fibra nerviosa, bloqueando los canales de Na^+ impidiendo el aumento de su permeabilidad,

Con lo que impiden la despolarización de la membrana, fenómeno necesario para la generación y conducción del impulso nervioso.

ANALGESICOS OPIACEOS

Farmacocinética

Farmacodinamia

Absorción

Distribución

Metabolismo

Eliminación

En general se absorben por vía oral, aunque algunos presentan un primer paso hepático que sustrae de la circulación sistémica una porción variable, influyendo en su ulterior biodisponibilidad.

Acceso a los receptores y redistribución: desde el plasma los opioides se distribuyen inicialmente por los tejidos altamente perfundidos (pulmón, corazón, cerebro, hígado y riñón).

Se metabolizan principalmente en el hígado por glucoronicoconjugación (morfinina y fentanilo) u oxidación (meperidina, alfentanil, sulfentanil y metadona), pero la tasa de biotransformación de la morfinina, fentanilo y pentazocina depende más de la concentración plasmática y del aclaramiento hepático flujo dependiente, que de la actividad intrínseca microsomal de modo que, en principio la disfunción hepática limita poco la depuración a no ser que sea severa.

El riñón elimina los metabolitos procedentes de la biotransformación hepática, pero un 10% es excretado por filtración glomerular y secreción tubular activa sin ser previamente metabolizado.

Los opioides disminuyen la percepción del estímulo doloroso determinando un estado con ausencia de dolor o un dolor muy leve.

Además, modulan la sensación emocional subjetiva al dolor, y disminuyen su impacto en el individuo.

El acceso a los receptores opioides tiene lugar durante la distribución inicial y depende de la cantidad de fármaco disponible para atravesar la barrera hematoencefálica (BHE) y de su capacidad para atravesarla, lo que depende, en gran parte, de sus propiedades fisicoquímicas.

ANSIOLITICOS

Farmacocinética

Farmacodinamia

Absorción

Se absorben por vía oral, alcanzando picos plasmáticos entre los 30 minutos y las 8 horas (rápida y completa), excepto: el clorozepato.

Distribución

Se distribuye por todo el organismo.

Metabolismo

Se metabolizan principalmente en el hígado.

Eliminación

Se eliminan principalmente por la orina 85-90%
10-15 % por heces
La vida media se alarga en pacientes mayores principalmente aquellos que tienen enfermedades hepáticas.

Actúan de manera selectiva sobre subtipos específicos de receptores de tipo A del ácido gamma aminobutírico (GABA) que intervienen en la transmisión simpática inhibitoria rápida de todo el sistema nervioso central (SNC).

NEUROLEPTICOS

Farmacocinética

Absorción

Cuando se administra por vía oral, la absorción es lenta e irregular, se modifica con alimentos, con antiácidos, anticolinérgicos. Tiene un importante efecto de primer paso hepático e intestinal que puede metabolizar hasta un 60% de una dosis.

Distribución

Se acumula en cerebro, pulmón y otros tejidos con gran irrigación. En cerebro puede tener una concentración 10 veces mayor que en la sangre. Tienen alta unión a proteínas plasmáticas (98%).

Metabolismo

Son metabolizados lentamente por el hígado por oxidación microsomal y conjugación con ácido glucurónico.

Eliminación

Los metabolitos se eliminan principalmente por orina y en menor proporción por bilis.

Farmacodinamia

Bloqueadores de los receptores dopaminérgicos (subtipos 1 y 2), receptores de la histamina (subtipos 1 y 2), receptores alfa-adrenérgicos (subtipos 1 y 2), receptores muscarínicos y receptores serotoninérgicos.

La actividad antipsicótica parece ser debida a la interferencia a nivel cortical, sistema límbico y ganglios basales de la neurotransmisión dopaminérgica y se correlaciona bien con la afinidad por los receptores-2 de la dopamina.

Su acción antiemética y la capacidad para aumentar la secreción de prolactina también parecen ser debidas a la inhibición de estos receptores a nivel de la zona trigger del hipotálamo.

ANTIDEPRESIVOS

Farmacocinética

Farmacodinamia

Absorción

Facilitada por vía oral. La concentración plasmática se suele registrar entre las 6 y 12 horas, con un importante efecto de primer paso hepático. La unión a proteínas es muy alta.

Distribución

La alta liposolubilidad de los ISRS determina que se distribuyan rápida y ampliamente en el organismo, difundiendo a través de la barrera hematoencefálica. El volumen aparente de distribución presenta valores elevados que exceden del peso corporal.

Metabolismo

Es esencialmente hepático.

Eliminación

Excretándose por vía renal un máximo del 10% de la dosis absorbida como fármaco.

Efecto serotoninérgico o catecolaminérgico, ya sea actuando a nivel presináptico o bien actuando como agonistas o antagonistas de los receptores postsinápticos.

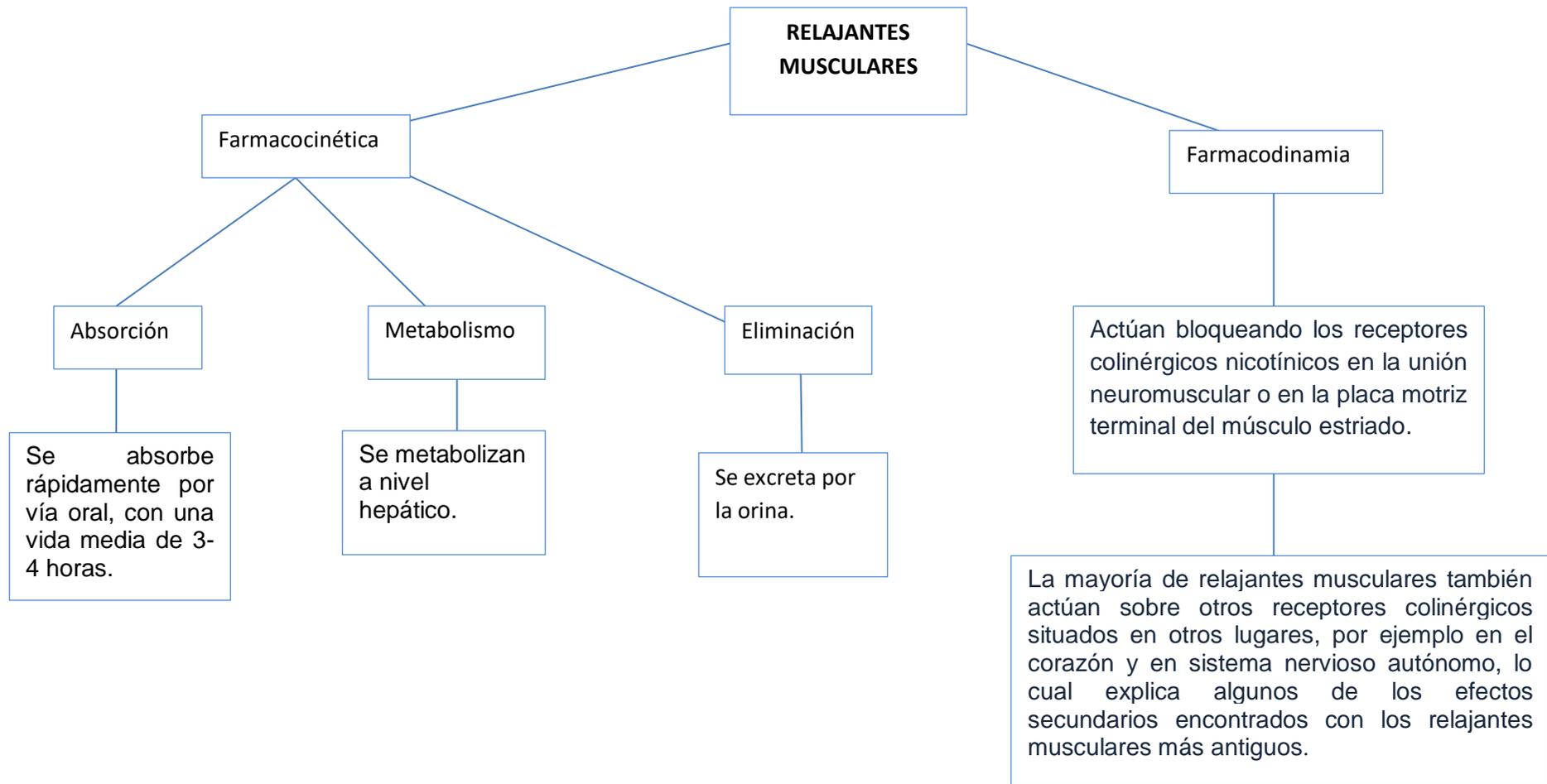
Estos mecanismos finalmente concluyen en la misma vía común, cual es, favorecer la transmisión monoaminérgica.

Acciones tempranas o precoces pueden destacarse:

- Bloqueo de la captación neuronal de aminas
- Aumento del neurotransmisor a nivel de la biofas.
- Disminución del recambio del neurotransmisor.
- Disminución de la frecuencia de descarga neuronal.

Dentro de las acciones a mediano y/o largo plazo destacan:

- Regulación "cuesta abajo" (*down regulation*) de los adrenoceptores beta
- Subsensibilidad al estímulo beta del sistema de formación. AMPc
- Cambios en los adrenoceptores alfa y cambios en los receptores serotoninérgicos.



BIBLIOGRAFÍA

- *Angulo, R. G. (2018). Anestésicos locales. En Anestesiología (pp. 91–98). Pontificia Universidad Javeriana.*
- *Uso indebido de opioides y la adicción. (2016). Substance Abuse Problems. <https://medlineplus.gov/spanish/opioidmisuseandaddiction.html>*
- *Cruciani, R. A. (2010). Opioides. Efectos secundarios sobre la calidad de vida del paciente. Offarm, 29(1), 82–85. <https://www.elsevier.es/es-revista-offarm-4-articulo-opioides-efectos-secundarios-sobre-calidad-X0212047X1047516X>*
- *W3R4cU_*. (2021, Septiembre 13). Los riesgos y efectos secundarios de los ansiolíticos. Centro de Medicina Neuro-Regenerativa. <https://www.parkinsonysalud.com/los-riesgos-de-tomar-ansioliticos-y-sus-efectos-secundarios/>*
- *neuroscie. (2023, marzo 9). ▷ Descubre los efectos de los ansiolíticos. Neuroscenter. <https://neuroscenter.com/blog/efectos-de-los-ansioliticos/>*
- *Antipsicóticos, F., Distrito Sanitario Costa, S. M., Málaga, D. S., Fernández Mal, M., Aiex, S., & Correspondencia, L. S. (s/f). REPASANDO EN AP. Samfyc.es. Recuperado el 28 de abril de 2023, de https://www.samfyc.es/wp-content/uploads/2018/10/v19n1_09_repasaFarmacos.pdf*
- *Ramamurthy, S. (2007). Antidepresivos. En Toma de Decisiones en el Tratamiento del Dolor (pp. 254–255). Elsevier.*
- *Medicamentos para el dolor de espalda. (s/f). Medlineplus.gov. Recuperado el 28 de abril de 2023, de <https://medlineplus.gov/spanish/ency/article/007486.htm>*