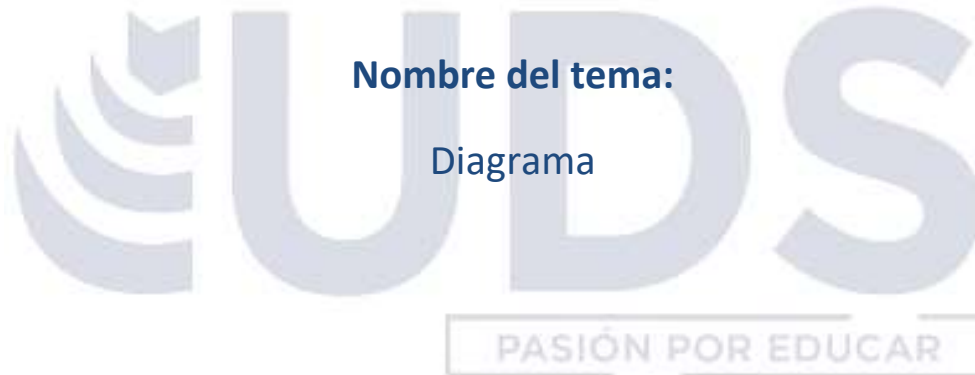




Universidad del Sureste

Campus Comitán

Medicina Humana



Nombre del tema:

Diagrama

Nombre del alumno:

Elena Guadalupe Maldonado Fernández

Materia:

Farmacología

Grado: 3

Grupo: A

Nombre del profesor:

Dr. Miguel Abelardo Ortega Sánchez

Farmacocinética

Modos de penetración y transporte

- Difusión pasiva — Moléculas del fármaco penetran por difusión a lo largo de un gradiente de [] gracias a la solubilidad en la bicapa lipídica — En estado estable, la [] del fármaco no unido es la misma en ambos lados de la membrana siempre y cuando el fármaco no sea electrolito
- Influencia del pH en los fármacos ionizables — Para compuestos iónicos, las [] en estado estable dependen del gradiente electroquímico para el ion y de las diferencias en el pH a través de la membrana
- Transporte de membrana mediado por transportador
 - Difusión facilitada — Facilitan el movimiento del soluto hacia dentro o fuera de la célula
 - Transporte activo — Capacidad para mover el soluto contra un gradiente electroquímico — - Saturabilidad
- Selectividad
- Inhibición competitiva entre los compuestos cotransportados
 - Transporte paracelular — Paso paracelular de los solutos y líquidos a través de los espacios intercelulares

Absorción

- Proceso por el cual el medicamento pasa desde la vía de admin. hasta la circulación sanguínea
- Pasa por membrana celular por medio de mecanismos de transporte
- Fx. que modifican la absorción
 - Solubilidad
 - Liposoluble
 - Hidrosoluble
 - Fórmula
 - Sólidos
 - Líquidos
 - Concentración
 - Ácidos y bases débiles
 - Ácidos y bases fuertes

Distribución

- Proceso por el cual el fármaco pasa del estado intravascular hasta las células de los tej. corporales
- Unión de fármacos a proteínas plasmáticas
 - Albúmina — Fármacos ácidos
 - Glicoproteína ácida — Fármacos básicos
 - Lipoproteína — Fármacos básicos
 - Globulina unión a esteroides — Esteroides y cortisol
- Unión a los tejidos — Por medio de componentes celulares
 - Proteínas
 - Fosfolípidos
 - Proteínas nucleares

Biotransformación

- Cinética de primer orden
 - La cantidad del fármaco metabolizado por unidad de tiempo es proporcional a la concentración plasmática del fármaco
 - La fracción del fármaco eliminada por el metabolismo es constante
- Cinética de orden cero
 - Una cantidad constante de fármaco se metaboliza por unidad de tiempo
 - La cinética de orden cero puede ocurrir con concentraciones altas (tóxicas) a medida que la capacidad metabólica para el fármaco se satura
- Enzimas inducibles de biotransformación — Los principales sistemas que metabolizan fármacos son enzimas inducibles de amplio espectro con algunas variaciones genéticas predecibles
- Fx. que modifican el metabolismo
 - Edad, sexo, nutrición
 - Patologías que afectan al hígado
 - Unión a proteínas plasmáticas
 - Inhibidores o inductores enzimáticos

Excreción

- Renal
 - Filtración glomerular — La cantidad de fármaco que ingresa la luz tubular por filtración depende de la tasa de filtración glomerular y de la unión del fármaco al plasma — Sólo se filtra el fármaco no unido
 - Secreción tubular activa — Mediada por transportador también puede agregar fármaco al flujo tubular
 - Reabsorción tubular pasiva — El fármaco de la luz tubular puede reabsorberse y regresar a la circulación sistémica
- Biliar y fecal
 - Fármacos y metabolitos presentes en la bilis se liberan en el tracto GI durante el proceso digestivo — Para interrumpir el ciclo enterohepático, las sustancias pueden administrarse por vía oral para unirse a metabolitos excretados en la bilis
 - Las excreciones biliares y el fármaco no absorbido se excretan en las heces

Farmacodinamia

Receptores

- Receptores nucleares
 - Dominio de activación de transcripción
 - Dominio de unión al ADN
 - Le toma 30 min. a horas
 - Efectos duran horas o días
- Receptores ligados a cinasas
 - 1) Se unen ligandos al receptor
 - 2) Se dimerizan
 - 3) Receptores de tirosina se fosforilan
 - 4) Activan a los Jak
 - 5) Se activan a los Stat, fosforilan, dimerizan, s-s, separan, van al núcleo y hacen la transcripción de genes específicos
- Receptores ionotropos
 - Transmiten una señal de membrana plasmática aumentando la conductancia y activando así el potencial eléctrico a través de la membrana
 - Provoca la abertura del canal, permite el paso de moléculas al citoplasma
- Receptores metabotropos
 - Señalización transmembrana, receptor, proteína, adenilato ciclasa- ATP- AMPc, proteína cinasa, 2canales ionicos para ejercer la función y permitir el paso de iones.

Especificidad de las respuestas a los fármacos

- Fuerza de interacción reversible entre un fármaco y su receptor medida por la constante de disociación se define como la afinidad de uno por el otro
- Tanto la afinidad de un fármaco por su receptor como su actividad intrínseca están determinadas por su estructura química
- La estructura química de un fármaco también contribuye a su especificidad
- Mecanismos
 - Especificidad del receptor
 - Expresión específica del tejido del receptor o los receptores
 - El acceso del fármaco a los tejidos blancos
 - Concentraciones de los fármacos en diferentes tejidos
 - Farmacogenética
 - Interacciones con otros fármacos
- La administración crónica de un medicamento causa una regulación a la baja de los receptores o la desensibilización de la respuesta que requiere ajustes de dosis para mantener una terapia adecuada

Afinidad, eficacia y potencia

- La interacción fármaco-receptor se caracteriza por
 - Unión del fármaco al receptor
 - Generación de una respuesta en un sistema biológico

Aditividad y sinergismo: isoblogramas

- Los fármacos con diferentes mecanismos de acción a menudo se usan en combinación para lograr efectos sinérgicos
 - Aditivos
 - Positivos — Efectos superaditivos de los fármacos usados en combinación

Fx. que modifican la acción del fármaco

Numerosos factores contribuyen a la amplia variabilidad de paciente a paciente en la dosis requerida de muchos fármacos para una terapia óptima

Mecanismos de acción de los fármacos

- Receptores que afectan las concentraciones de ligandos endógenos
 - Actúan alterando
 - La síntesis
 - Almacenamiento
 - Liberación
 - Transporte
 - Metabolismo de ligandos endógenos
- Receptores de fármacos asociado con procesos extracelulares
 - Tienen como blanco las enzimas y las moléculas que controlan los procesos extracelulares
 - Trombosis
 - Inflamación
 - Respuestas inmunes
- Receptores utilizados por agentes antiinfecciosos
 - Proteínas microbianas
 - Claves en las rutas bioquímicas que requiere el agente infeccioso
- Receptores que regulan el medio iónico
 - Los receptores para estos medicamentos son bombas de iones y transportadores, muchos de los cuales se expresan sólo en células especializadas del riñón y el tracto GI.