

UNIVERSIDAD DEL SURESTE

Campus Comitán

LADME - CUADROS SINOPTICOS

Materia: Farmacología

Alumna: Eunice Yamileth Roblero Rodríguez

Catedrático: Dr. Ismael Lara Vega



3 - "C"

LADME

LIBERACIÓN
Proceso por el cual el principio activo sale de su forma farmacéutica y se disuelve en el cuerpo

PROCESOS

DISGREGACIÓN

- Fragmenta los fármacos en trozos mas pequeños
- Solo en formas farmacéuticas agregadas

DISOLUCIÓN

- Disolución lenta de los fragmentos pequeños en el medio
- Todos los fármacos excepto las soluciones

DIFUSIÓN

- Una vez ya disuelto debe de llegar al lugar de absorción

- Comprimidos
- Grageas
- Capsulas

TIPOS

INMEDIATA

- De forma rápida

Capsula al humedecerse

CONTROLADA

- De forma paulatina
- Permite mantener niveles terapéuticos estables en la sangre

ABSORCIÓN
Paso de los fármacos desde el exterior al medio interno (circulación sistémica)

PASO A TRAVÉS DE LAS MEMBRANAS BIOLÓGICAS

COMPOSICIÓN

- Fosfolípidos
- Proteínas

ESTRUCTURA

- Bicapa lipídica

MECANISMOS DE PASO POR LA MEMBRANA

MÁS USUAL

- Disolución de su componente lipóideo

TIPOS

Proceso Pasivo

- Filtración a través de poros
- Difusión pasiva directa

Proceso Especializado

- Uso de proteína transportadora
- No requiere uso de energía

Proceso Activo

- Contra gradiente electroquímico
- Requiere energía

Otros sistemas

- Endocitosis y exocitosis
- Utilización de ionóforos
- Utilización de liposomas

CONDICIONADO POR:

- Gradiente de concentración
- Potencial
- Presión hidrostática
- Presión gaseosa
- Presión osmótica

LADME

DISTRIBUCIÓN

Transporte del fármaco dentro del compartimento sanguíneo y su posterior penetración en los tejidos

FARMACOS EN SANGRE

FORMAS DE ENCONTRARLOS

1. Disueltos en el plasma
2. Incorporados a las células (hematíes)
3. Fijados a las proteínas Plasmáticas

PROTEÍNAS

- Condicionan su efecto farmacológico
- Cuando se unen al fármaco no permiten su difusión por el capilar
- Lo libera paulatinamente

ALBUMINA

- Más abundante en el plasma
- Mayor superficie y capacidad para fijar sustancias exógenas
- Cuatro sitios diferentes para la unión de los fármacos

1. Ácidos
2. Básicos
3. Ácidos débiles (casi exclusivos a la albumina)
4. Algunas bases débiles

LIPOPROTEÍNAS

- Bases débiles
- Sustancias no ionizables

α-GLUCOPROTEÍNA

- Bases débiles

ACCESO A LOS TEJIDOS

SANGRE - LÍQUIDO INTERSTICIAL

A TRAVÉS DE LOS CAPILARES

- Difusión pasiva (si son liposolubles)
- Filtración (si son hidrosolubles)
- Solo difunde la fracción plasmática libre)

RED CAPILAR

- Resistencia de paso

Limitada

- En el ojo
- Circulación fetal
- Secreciones exocrinas

Mínima

- En los sinusoides hepáticos

Intermedia

- Capilares del territorio muscular

Máxima

- Capilares del SNC

DEPÓSITOS TISULARES

- Principales depósitos de los fármacos
- Habitual que se acumulen en órganos distintos al órgano diana

HEMATOENCEFÁLICA

- Llegan al líquido intersticial cerebral por circulación capilar

DIFICULTAD DE PASO

- Zonula occludens
- Membrana basal
- Capa discontinua de pericitos
- Intimo contacto con células gliales

- Acceden por difusión al líquido cefalorraquídeo

DIFICULTAD DE PASO

- Epitelio de plexos coroideos

BARRERAS

PLACENTARIA

PASAN

- Peso molecular bajo (< 600)
- Lipofilia

NO PASAN

- Peso molecular alto (> 1000)
- Bases con pKa alto y ácidos con pKa bajo

LADME

METABOLISMO

Transformaciones bioquímicas que sufren sustancias extrañas para facilitar su eliminación.

CARACTERÍSTICAS

F. HIDROSOLUBLES

- Pueden eliminarse sin transformaciones

F. LIPOSOLUBLES

- Requieren transformarse en compuestos polares (metabólicos) para eliminarse.

- Evita reabsorción renal por difusión.

FASES

FASE I (NO SINTÉTICA)

REACCIONES

- Oxidación
- Reducción
- Hidrólisis

FUNCIÓN

- Añadir o liberar grupos funcionales → ↑ ionización e hidrosolubilidad

RESULTADO

- Activación
- Cambio de actividad
- Inactivación

FASE II (SINTÉTICA)

- Reacciones: conjugación con compuestos endógenos (ácido glucurónico, acético, sulfúrico).
- Función: ↑ tamaño molecular, inactivar fármaco, ↑ hidrosolubilidad.
- Excreción: por orina o bilis.
- Nota: el fármaco puede pasar solo por Fase I, solo por Fase II o en distinto orden.

BIOTRANSFORMACIÓN MICROSOMAL

LOCALIZACIÓN

- Retículo endoplásmico liso hepático (principal)
- Riñón
- Otros tejidos.

REQUERIMIENTO

- Liposolubilidad del fármaco

ENZIMAS

- Oxidasas de función mixta
- Monooxigenasas.
- Citocromo P-450 → hemoproteína clave.

MECANISMO

- Uso de O_2 (un átomo oxida al fármaco, otro forma H_2O con donante de electrones).

BIOTRANSFORMACIÓN NO MICROSOMAL

LUGAR

- Hígado
- Plasma
- Otros tejidos

REACCIONES

OXIDACIONES

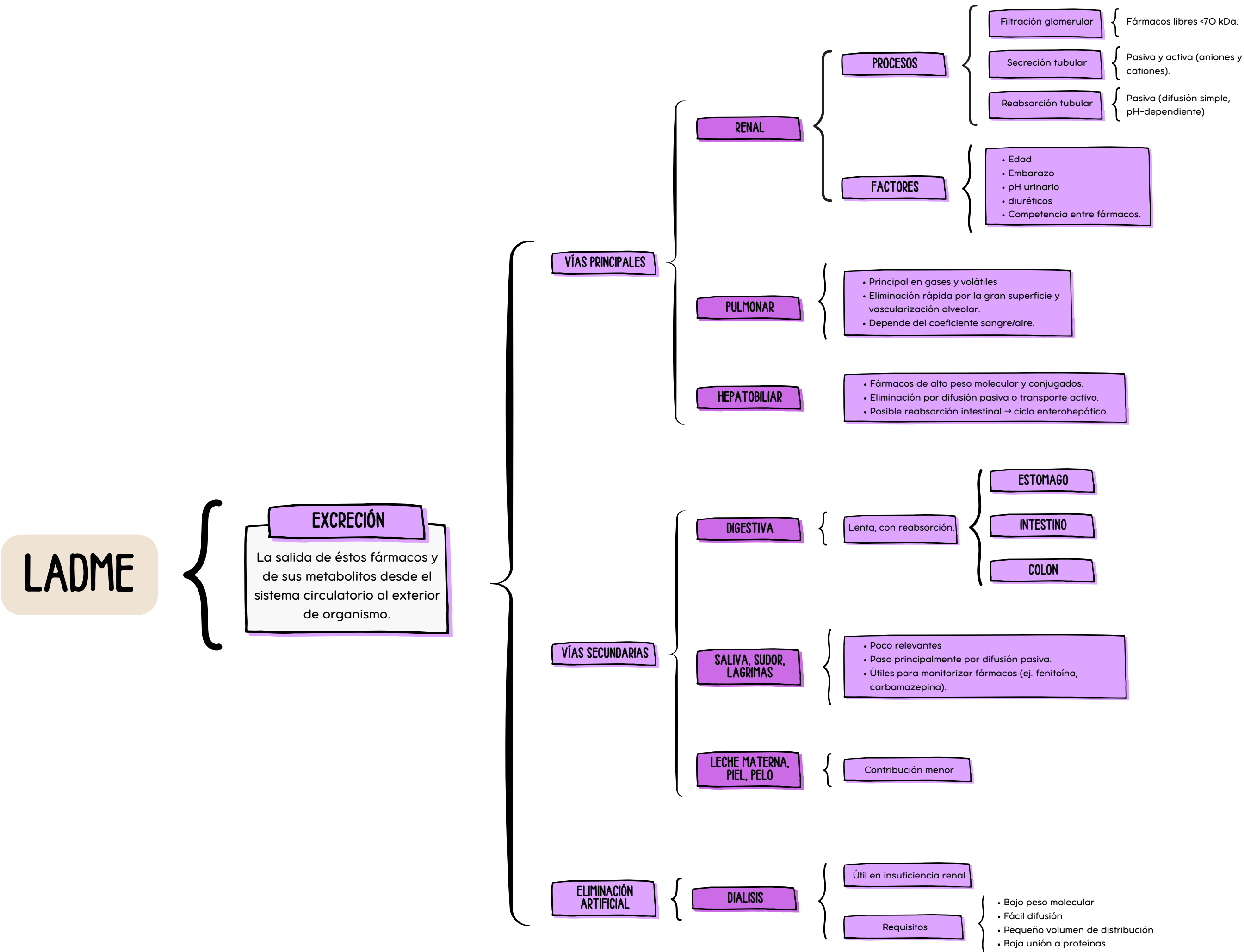
- Alcoholes, aminos por MAO, purinas por xantino-oxidasa

REDUCCIONES

- Flora intestinal: nitrocompuestos, azocompuestos, catecoles; alcohol-deshidrogenasa

CONJUGACIONES

- Todas excepto glucurónidos



Bibliografía

- Lorenzo F.P & Moreno G.A (2018). Velázquez Farmacología Básica y Clínica. Ed 19ª. Capítulo I y II. Páginas 13 - 47