



Mi Universidad

Cuadros sinópticos

Dana Yanely Solano Narvaez

Proceso LADME

I parcial

Farmacología

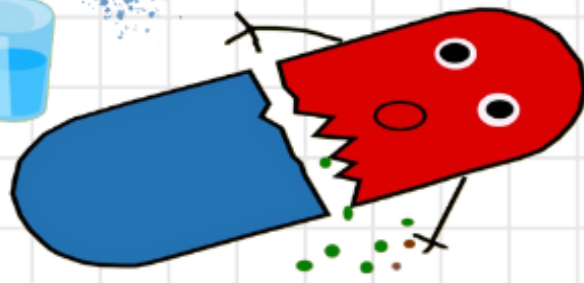
Dr. Ismael Lara Vega

Licenciatura en Medicina humana

3 semestre

Comitán de Domínguez, Chiapas, a 10 de septiembre de 2025

Liberación del Farmaco



Definición

proceso por el cual el principio activo se separa de la forma farmacéutica y queda disponible para su absorción.

Etapas de la liberación

- Desintegración { La forma farmacéutica sólida se fragmenta en partículas más pequeñas.
- Disgregación { Las partículas se separan entre sí, aumentando la superficie expuesta al medio de disolución.
- Disolución { La velocidad de disolución condiciona directamente la velocidad de absorción.

Factores que influyen en la liberación

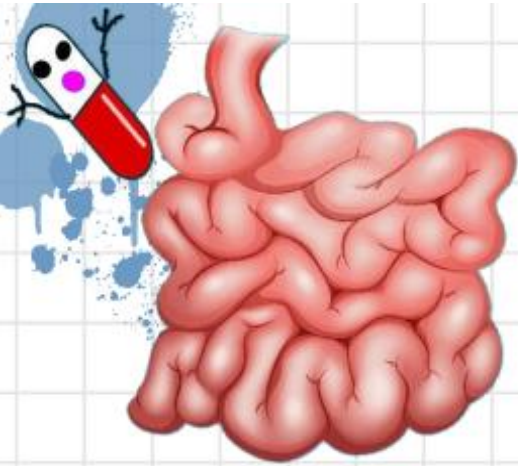
- Propiedades fisicoquímicas del fármaco: solubilidad, lipofilia, ionización.
- Forma farmacéutica: soluciones, absorción más rápida; comprimidos y cápsulas, dependen de desintegración y disolución.
- Excipientes: algunos favorecen o retrasan la liberación (recubrimientos entéricos, liberación prolongada).
- pH y vaciamiento gástrico: modifican la disolución y paso al intestino.
- Interacciones con alimentos o fármacos: pueden aumentar o disminuir la liberación.

Importancia de la liberación

- Determina la velocidad con la que el fármaco estará disponible para absorberse.
- Puede ser diseñada de manera especial {
 - Liberación inmediata: acción rápida.
 - Liberación retardada: evita el ácido gástrico, se libera en intestino.
 - Liberación controlada o sostenida: mantiene niveles plasmáticos estables por más tiempo.

LIBERACIÓN





ABSORCIÓN



Definición

Es el paso de un fármaco desde su sitio de administración hasta la circulación sistémica.

Mecanismos de paso a través de membranas

- procesos pasivos de difusión
 - filtración a través de poros
 - difusión pasiva directa
- transporte especializado
 - difusión facilitada
 - transporte activo
- transporte especializado
 - endocitosis y exocitosis
 - utilización de ionóforos
 - utilización de liposomas

Procesos pasivos vs especializados

- **Pasivos:** no requieren energía, no se saturan (difusión, filtración).
- **Especializados:** requieren energía, son selectivos y saturables (transportadores, endocitosis).

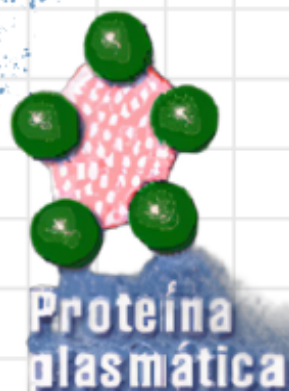
Vías de administración

- Inmediatas o directas: entran a la sangre sin barreras (rápidas).
 - Intradérmica
 - Subcutánea
 - Intramuscular
 - Intravascular (intravenosa, intraarterial, intracardiaca, intralinfática)
 - Intraperitoneal
 - Intrapleural
 - Intraarticular
 - Intraósea
 - Intrarraquídea
 - Intraneural
- mediatas o indirectas: necesitan atravesar membranas.
 - Oral
 - Bucal o sublingual
 - Rectal
 - Respiratoria
 - Dérmica o cutánea
 - Genitourinaria
 - Conjuntival

Biodisponibilidad

- Porcentaje del fármaco que llega a la sangre en forma activa. Se mide con el área bajo la curva (AUC).
- Este parámetro indica la cantidad y la forma en la que un fármaco llega a la circulación sistémica y está, por lo tanto, disponible para acceder a los tejidos y producir un efecto.

DISTRIBUCIÓN



Definición

estudia el transporte del fármaco dentro del compartimento sanguíneo y su posterior penetración en los tejidos.

Transporte de los fármacos en la sangre

Los fármacos viajan en plasma en dos formas:

- libre (activa, puede difundirse)
- unida a proteínas plasmáticas (como albúmina, alfa-glucoproteína ácida y lipoproteínas).

Solo la fracción libre puede atravesar las membranas capilares y acceder a tejidos.

Albúmina: 4 sitios de unión.

Acceso de los fármacos a los tejidos

La entrada del fármaco a los tejidos ocurre principalmente por difusión pasiva (para fármacos lipofílicos) o filtración (para hidrosolubles) a través del endotelio capilar. Solo difunde la fracción libre.

- Depósitos tisulares y redistribución

Algunos fármacos se acumulan en tejidos alejados del órgano diana, actuando como reservorios.

- Barrera HEC

Membrana protectora y selectiva, compuesta por cels. endoteliales que protegen al SNC.

- Barrera placentaria

Separa la sangre materna de la fetal. No todos los fármacos cruzan libremente, lo que protege al feto ante sustancias perjudiciales.

Cinética de distribución

- Compartimentos

conjunto de tejidos donde un fármaco se distribuye uniformemente.

1. Central
2. Periférico superficial
3. Periférico profundo

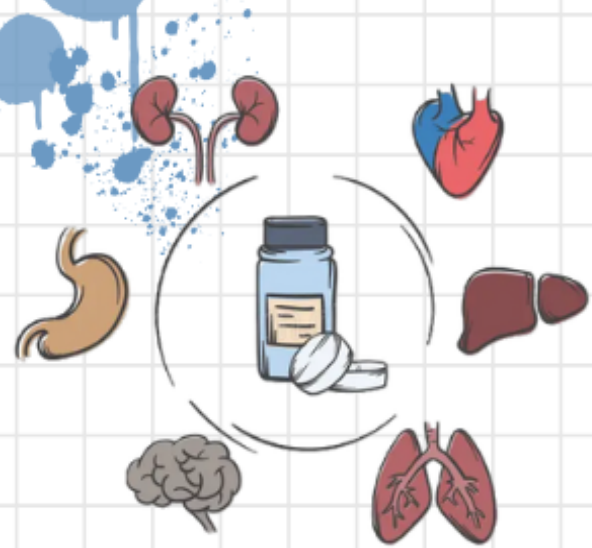
- VD

Es un parámetro que refleja cómo se reparte un fármaco entre plasma y tejidos.

DISTRIBUCIÓN



METABOLISMO



Definición

cambios bioquímicos que las sustancias extrañas sufren en el organismo para eliminarse mejor.

Órgano principal

Hígado: sitio fundamental, por su sistema enzimático del citocromo P450.

También ocurre en: intestino, riñón, pulmón, piel y plasma.

Fases del metabolismo

1. Fase I (funcionalización)

- Reacciones: oxidación, reducción e hidrólisis.
- Introducen o exponen un grupo funcional en la molécula ($-OH$, $-NH_2$, $-COOH$).
- Muchas veces generan metabolitos aún activos.
- Enzimas clave: citocromo P450 (CYP450).

2. Fase II (conjugación)

- Reacciones: glucuronidación, sulfatación, acetilación, metilación, conjugación con glutatión o aminoácidos.
- Unen el fármaco o su metabolito a moléculas endógenas.
- Generalmente producen compuestos inactivos, polares e hidrosolubles → eliminación fácil.

Variabilidad del metabolismo

- Factores genéticos: polimorfismos en enzimas.
- Edad: inmadurez enzimática en neonatos, metabolismo reducido en ancianos.
- Enfermedades: hepatopatías o insuficiencia cardíaca reducen metabolismo.

Interacciones medicamentosas:

- Inducción enzimática: aumenta la actividad.
- Inhibición enzimática: disminuye metabolismo, aumenta toxicidad.



EXCRECIÓN



Definición

salida de fármacos y de sus metabolitos desde el sistema circulatorio al exterior del organismo.

Órganos principales

- Hígado
- Riñón
- Pulmón
- Otros

Excreción renal (principal vía)

- Filtración glomerular
 - Pasa al filtrado solo la fracción libre del fármaco (no unida a proteínas plasmáticas).
 - Fármacos con alto peso molecular o muy ligados a proteínas (se filtran poco).
- Secreción tubular
 - Proceso activo en el túbulo proximal.
 - Usa transportadores específicos para ácidos orgánicos y bases orgánicas (morfina, aminos).
 - Permite eliminar fármacos incluso cuando están ligados a proteínas plasmáticas.
- Reabsorción tubular
 - Puede ser pasiva (difusión de moléculas liposolubles al plasma) o activa (para ciertos compuestos).
 - Depende del pH urinario (ácido o alcalino).
- Factores y agentes que modifican la excreción renal
 - Flujo sanguíneo renal
 - Unión a proteínas plasmáticas
 - pH urinario
 - Competencia en transportadores

Excreción por otras vías

- Excreción biliar (hígado, bilis, intestino).
- Excreción pulmonar
- Excreción en leche materna
- Excreción en sudor, saliva y lágrimas

Referencia bibliográfica:

P. Lorenzo A. Moreno J. C. Leza I. Lizasoain A. Portolés. (2019). Velázquez Farmacología Básica y Clínica, 19a Ed. Editorial médica panamericana.
Velazquez%20Farmacologia%20Basica%20y%20Clinica%2019a%20Edicion.pdf.