



## **Cuadros sinópticos**

*Dana Yanely Solano Narvaez*

*Proceso LADME*

*I parcial*

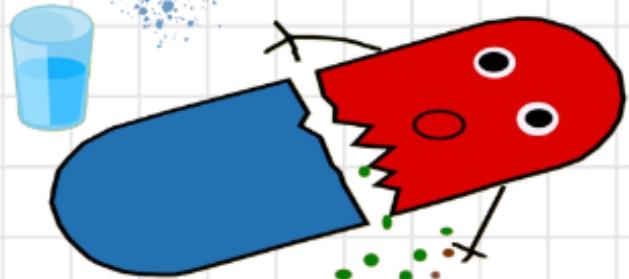
*Farmacología*

*Dr. Ismael Lara Vega*

*Licenciatura en Medicina humana*

*3 semestre*

## Liberación del Farmaco



# LIBERACIÓN



### 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

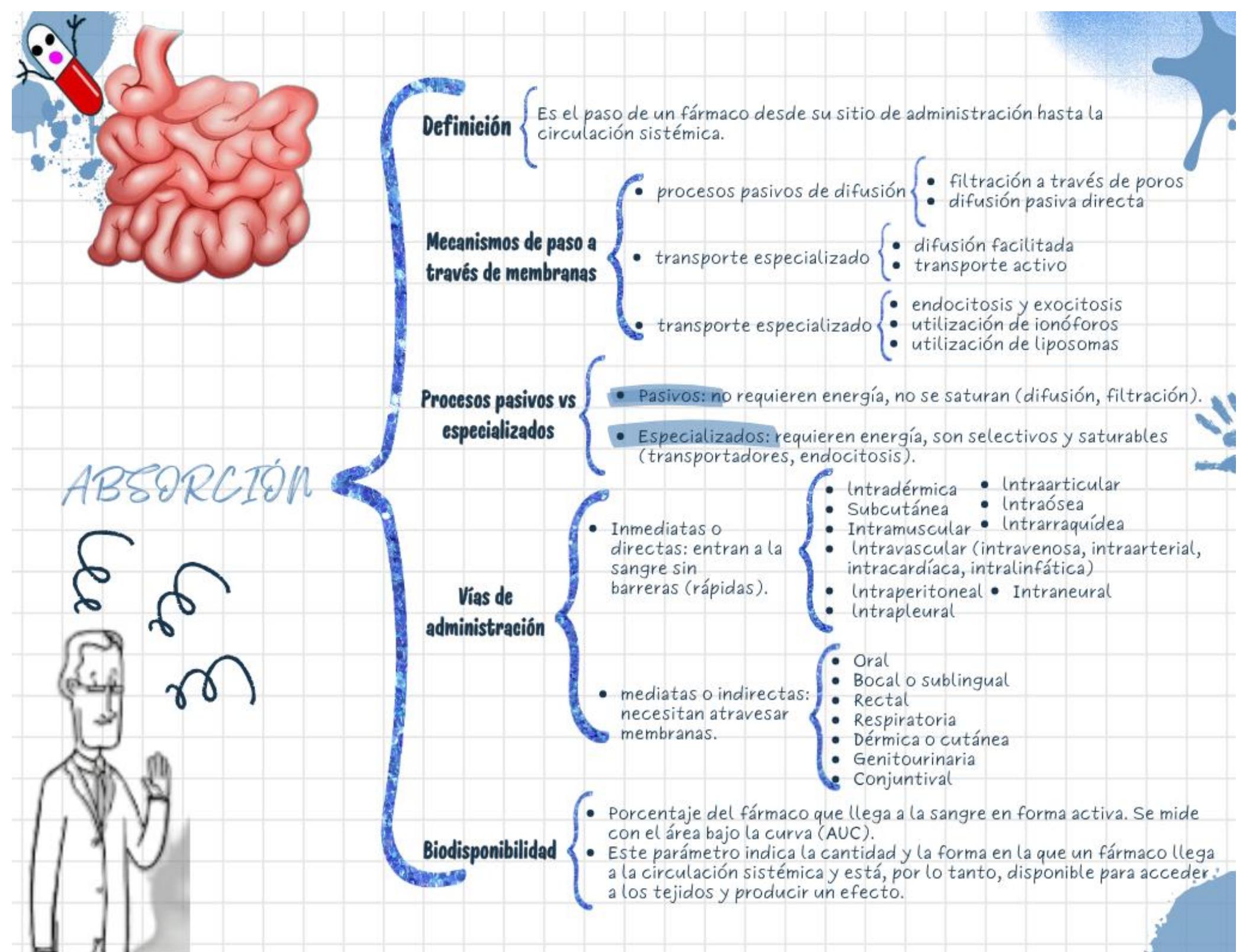
- Propiedades fisicoquímicas del fármaco: solubilidad, lipofilia, ionización.
- Forma farmacéutica: soluciones, absorción más rápida; comprimidos y cápsulas, dependen de desintegración y disolución.
- Excipientes: algunos favorecen o retrasan la liberación (recubrimientos entéricos, liberación prolongada).
- 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

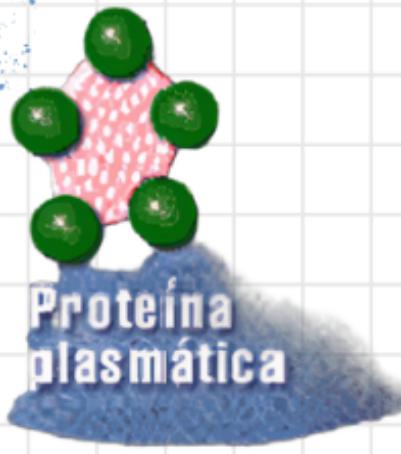
- Determina la velocidad con la que el fármaco estará disponible para absorberse.

- 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.



# DISTRIBUCIÓN



# DISTRIBUCIÓN



## Cinética de distribución

- Compartimentos
- VD

conjunto de tejidos donde un fármaco se distribuye uniformemente.

1. Central
2. Periférico superficial
3. Periférico profundo

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

## 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

- Barrera HEC

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

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

## Transporte de los fármacos en la sangre

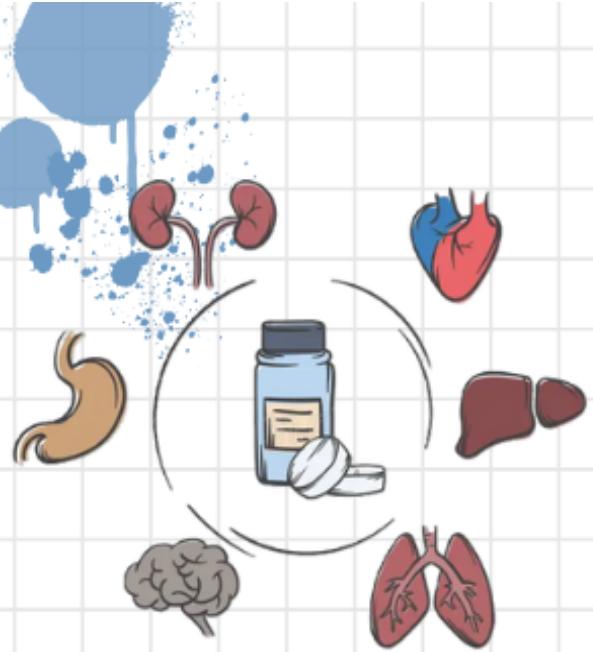
Los fármacos viajan en plasma en dos formas:

- 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.

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



# METABOLISMO



## Fases del metabolismo

### 1. Fase I (funcionalización)

- Reacciones: oxidación, reducción e hidrólisis.
- Introducen o exponen un grupo funcional en la molécula (-OH, -NH<sub>2</sub>, -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.

## 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.



# EXCRECIÓN



## Excreción renal (principal vía)

## Excreción por otras vías

### Definición

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

### Órganos principales

- Hígado
- Riñón
- Pulmón
- Otros

### 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).

### Secrección tubular

- Proceso activo en el túbulo proximal.
- Usa transportadores específicos para ácidos orgánicos y bases orgánicas (morphina, aminas).
- 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 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.