

INTRODUCCIÓN A LA FARMACOLOGÍA: FARMACOCINÉTICA Y FARMACODINAMIA

Departamento de Farmacología y Terapéutica
EUTM
Dr. Stefano Fabbiani

INTRODUCCIÓN

Farmacología: ciencia que estudia las acciones y propiedades de los fármacos en el organismo

FÁRMACO: toda sustancia química utilizada en el tratamiento, la curación, la prevención o el diagnóstico de una enfermedad, o para evitar la aparición de un proceso fisiológico no deseado.



INTRODUCCIÓN

FARMACOCINÉTICA: medición temporal de la concentración plasmática del fármaco en su paso por el organismo

FARMACODINAMIA: estudio de los efectos bioquímicos y fisiológicos de los fármacos en el organismo.

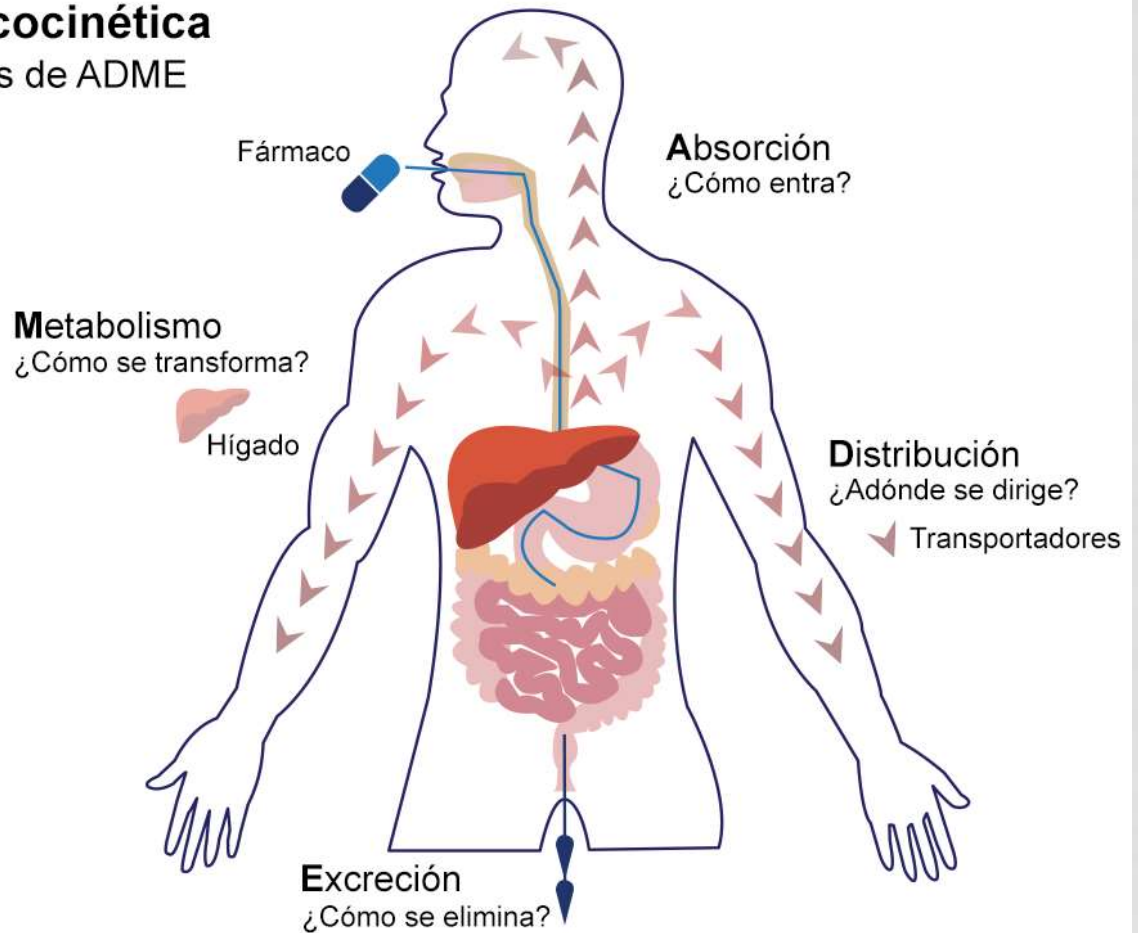
Valora la interacción fármaco-receptor.

FARMACOCINÉTICA

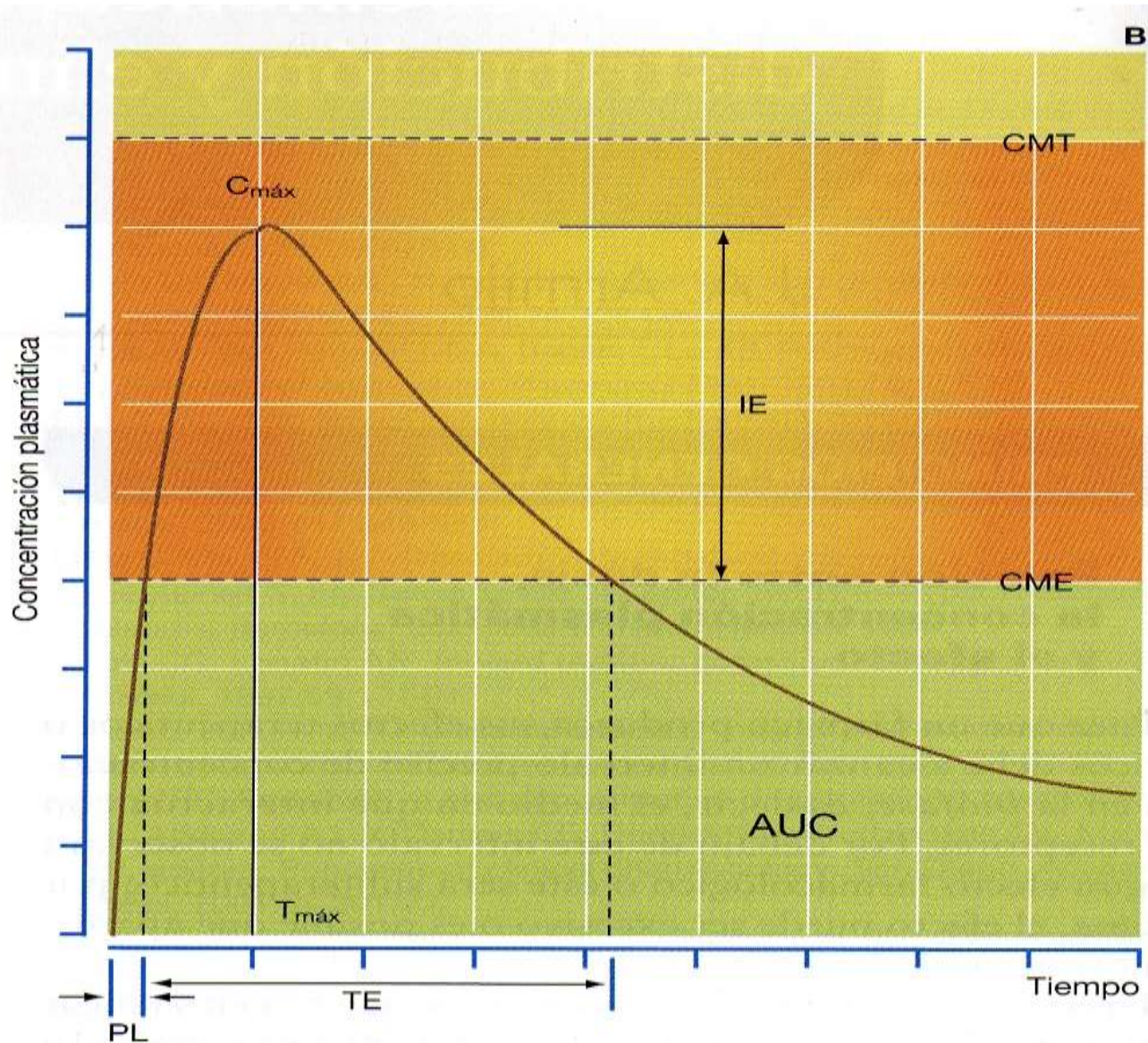
- 4 PROCESOS
 - ABSORCIÓN
 - DISTRIBUCIÓN
 - METABOLISMO
 - ELIMINACIÓN

Farmacocinética

Principios de ADME

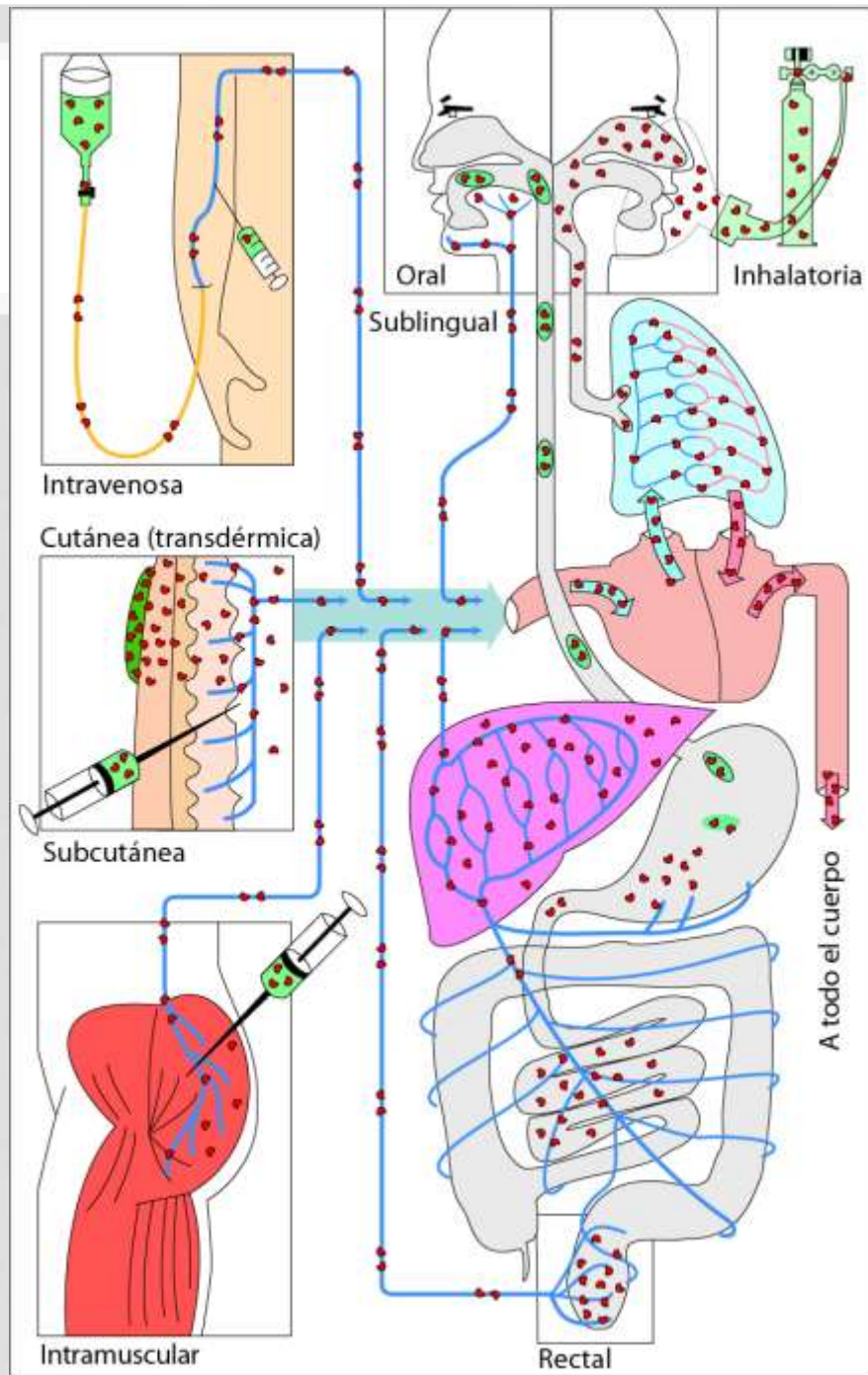


Curva concentración - tiempo



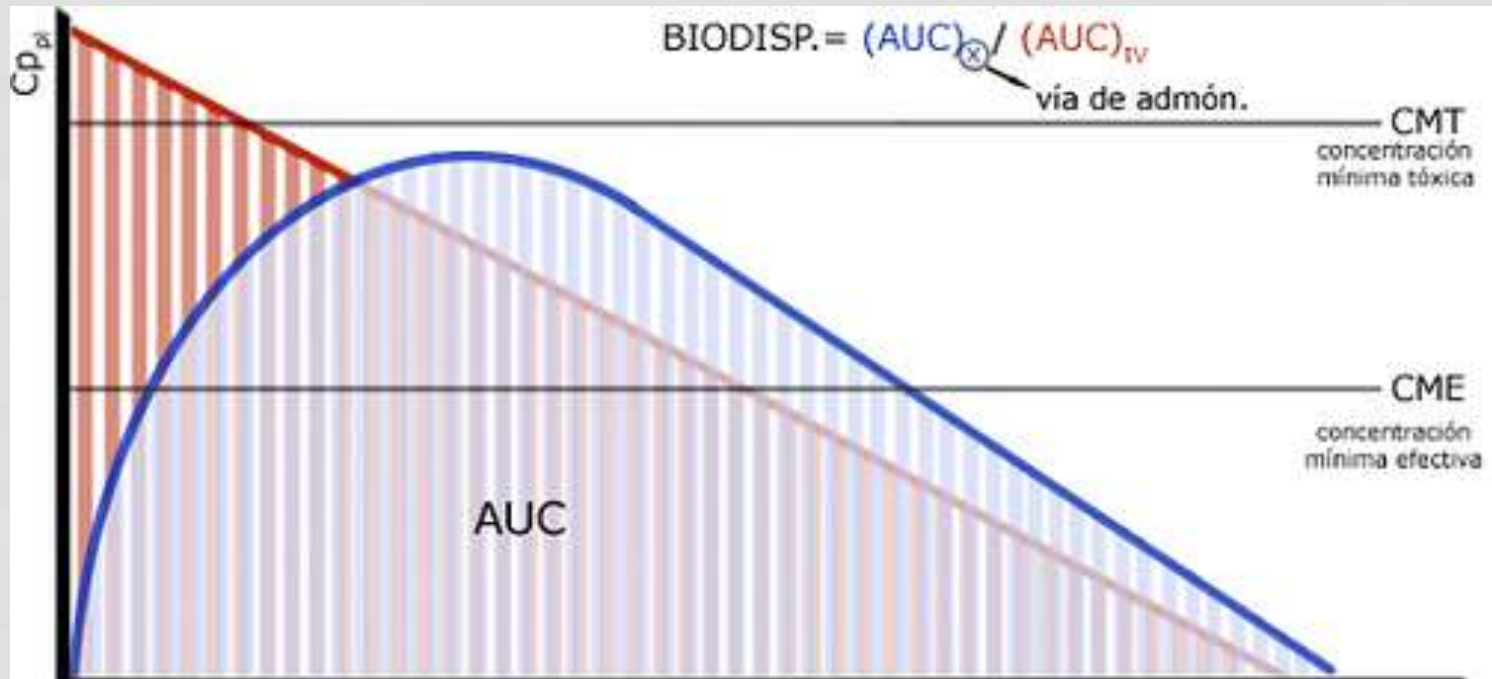
ABSORCIÓN

- Paso del fármaco desde el sitio de administración hacia la sangre
- Factores que influyen en la absorción
 - Dosis, forma farmacéutica y propiedades físico-químicas, vía de administración.
 - Edad, flujo local, embarazo, alimentos, vómitos, diarrea



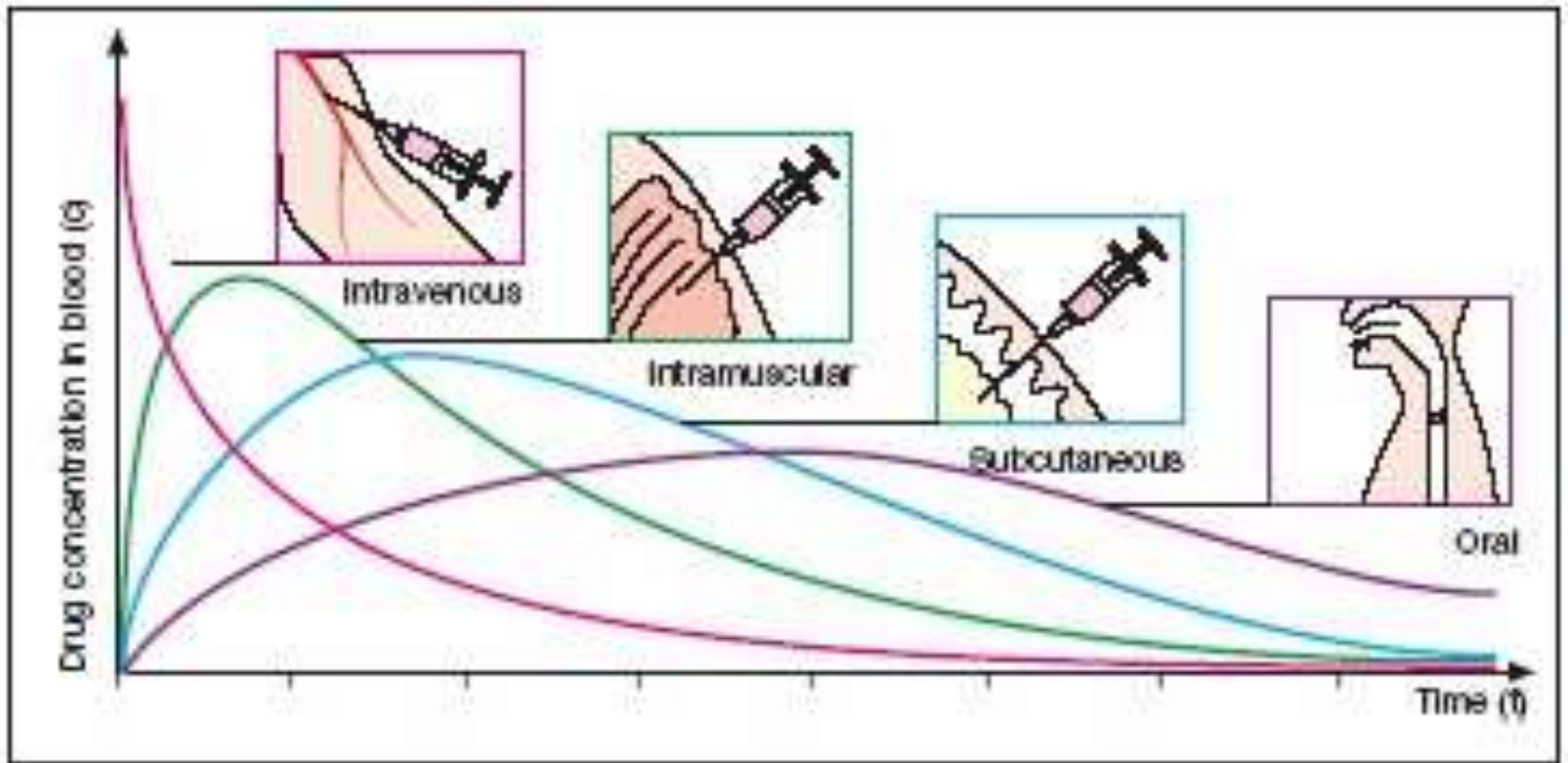
ABSORCIÓN

- BIODISPONIBILIDAD: parámetro que mide la absorción
 - Fracción inalterada del fármaco que llega a la circulación sistémica en condiciones de producir efecto



EFECTO DE PRIMER PASO

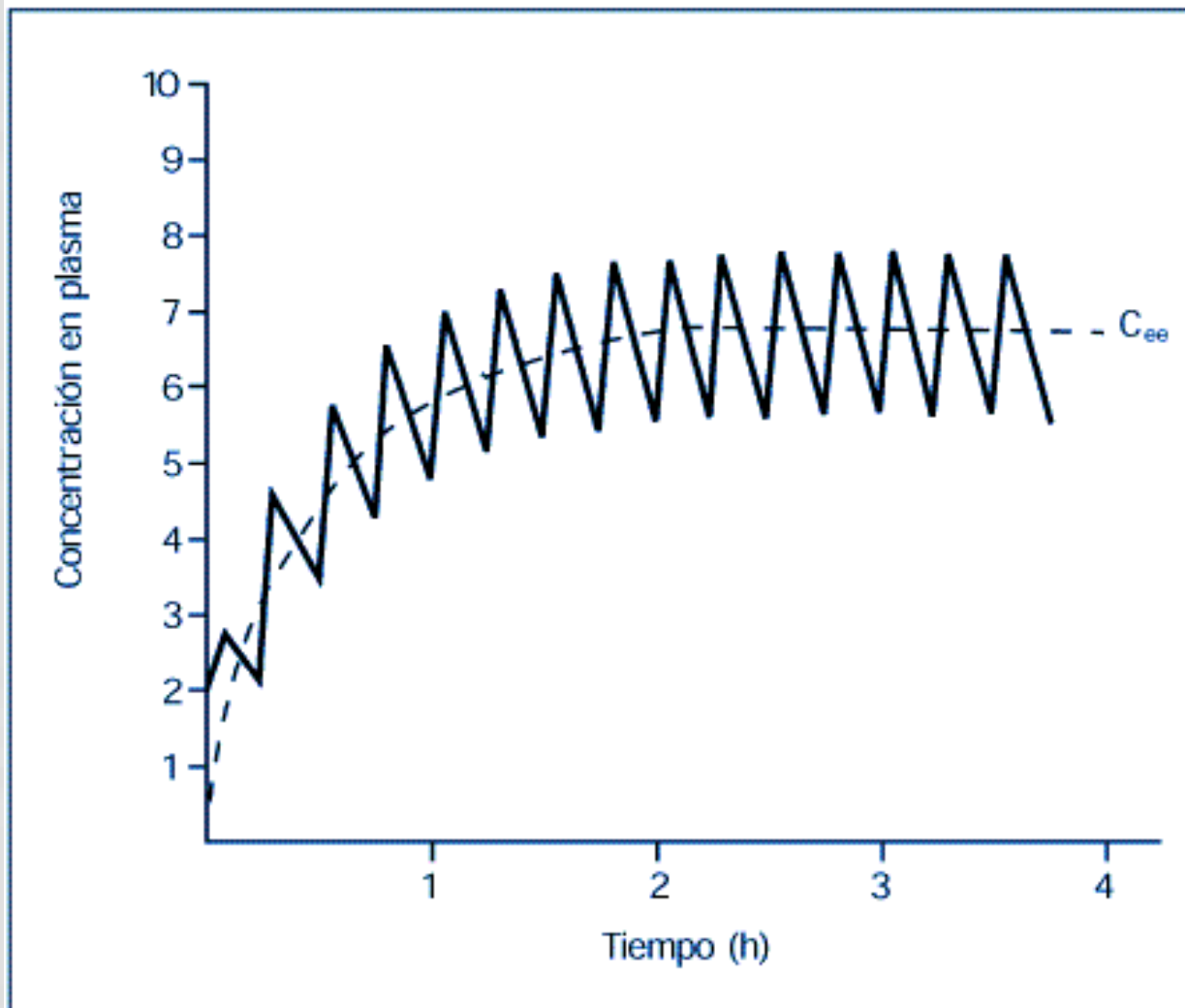
- Se entiende por fenómeno de primer paso la metabolización del fármaco, tanto en la pared del tracto gastrointestinal como en el hígado a donde llega a través de la vena porta, de modo que una fracción del fármaco queda metabolizada antes de llegar a la circulación sistémica.



DISTRIBUCIÓN

- Distribución del fármaco por el torrente sanguíneo a los distintos tejidos, por lo que determina las concentraciones que alcanzará en ellos (fracción libre)
- Se puede cuantificar mediante el volumen de distribución
- Depende de
 - Propiedades físico-químicas, peso y proporción de agua por kg de peso, unión a proteínas plasmáticas y unión a los tejidos

DOSIS CARGA



METABOLISMO

- La concentración de un fármaco disminuye por 2 procesos: metabolismo y excreción
- Metabolismo: biotransformación a metabolitos activos, inactivos o tóxicos, que tiende a favorecer la excreción, principalmente se da en el hígado

METABOLISMO

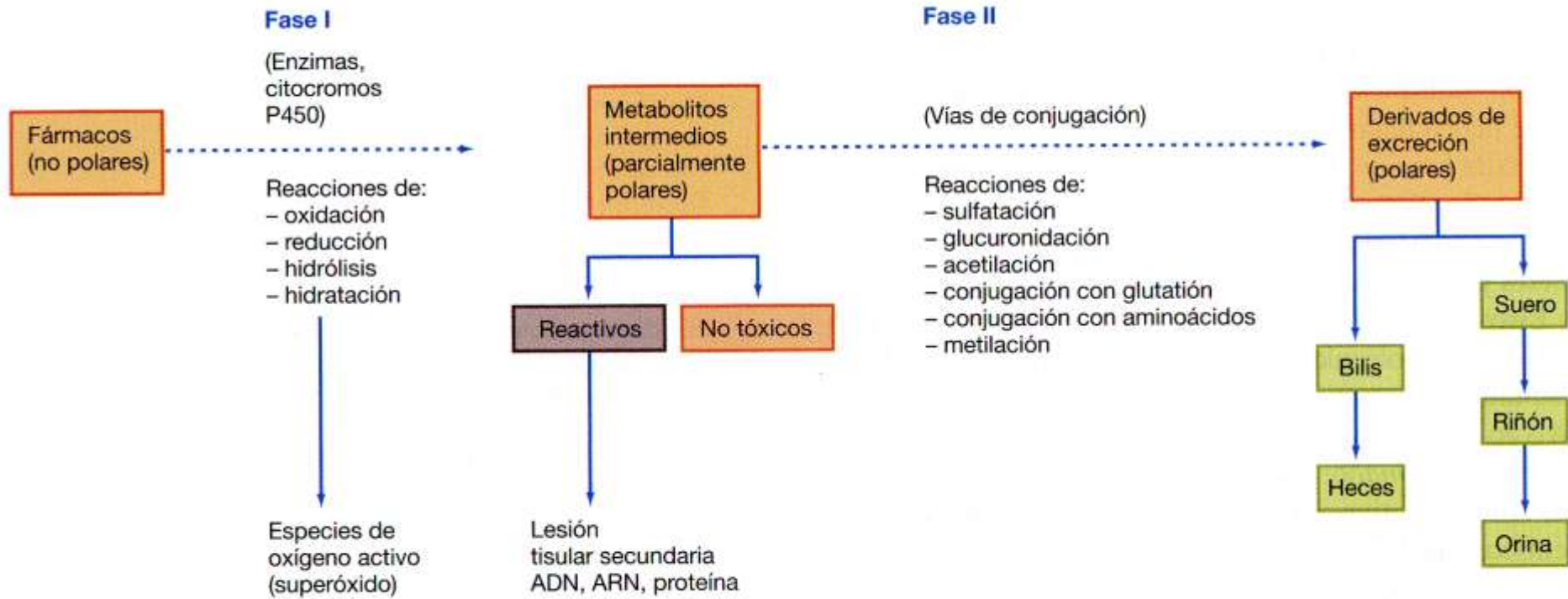


Figura 5-1. Fases del metabolismo de los fármacos.

CITOCROMO P450 (CYP)

- Familia de isoenzimas de oxidorreducción, cuya expresión fenotípica está genéticamente determinadas y es posible **de modificación ambiental** por diversos xenobióticos (fármacos, carnes asadas, jugo de pomelo, sustancias químicas, etc)
- Fuente de importante **variabilidad interindividual** e intraindividual en la respuesta a los fármacos.
- Fuente de múltiples **interacciones** con alimentos, medicamentos, productos herbarios.

EXCRECIÓN

- Salida del fármaco del organismo
- Vías de excreción
 - Renal
 - Biliar e intestinal
 - Otras: saliva, sudor, leche, diálisis
- Influye en la duración del efecto; determinante fundamental de la duración del fármaco en el organismo

ELIMINACIÓN

- Parámetros
 - Clearance: mililitros de plasma que el órgano aclara, es decir, de los que elimina totalmente del fármaco. Importante para calcular la dosis
 - Vida media de eliminación ($t_{1/2}$): tiempo que tarda la concentración plasmática en reducirse a la mitad

FARMACODINAMIA

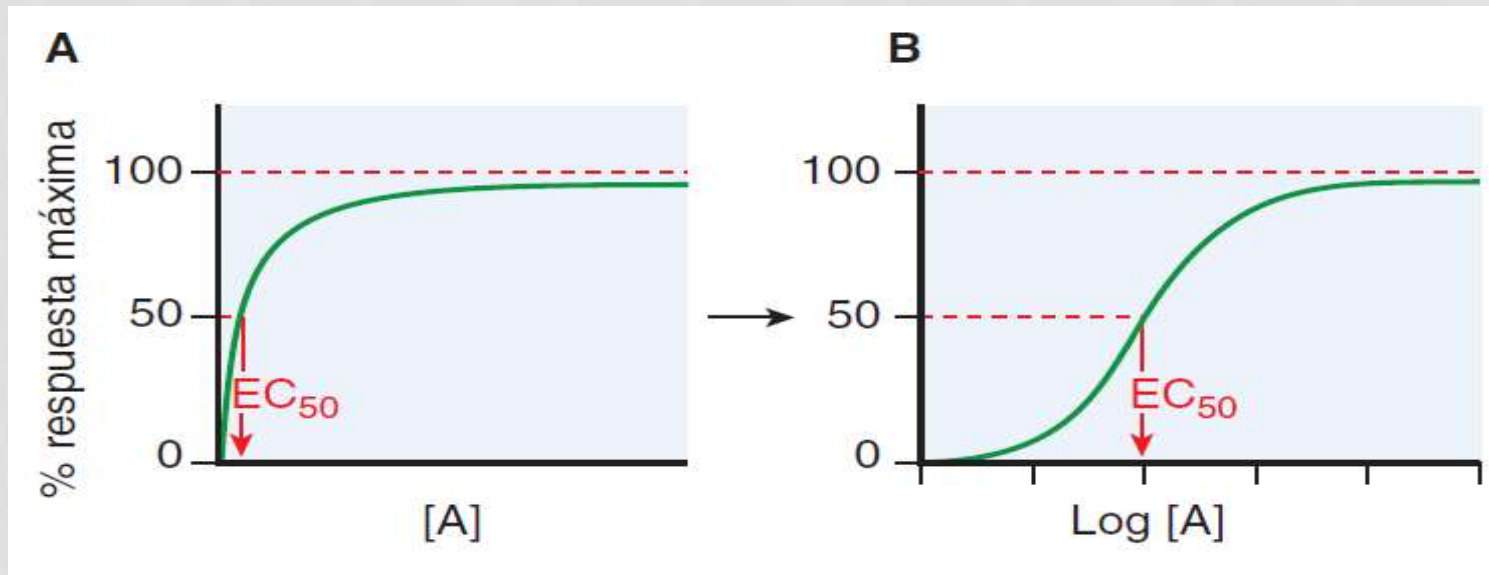
- Receptores farmacológicos: macromoléculas con las cuales los fármacos son capaces de interaccionar para generar sus efectos
 - El fármaco no crea nuevos efectos, sino que modula las funciones fisiológicas
- Determina la magnitud de la respuesta

INTERACCIÓN FÁRMACO-RECEPTOR

- Características de la interacción F-R
 - Afinidad: capacidad de unión del fármaco al receptor
 - Especificidad: capacidad de discriminar una molécula de otra, gracias a su configuración estructural
 - Actividad intrínseca: capacidad de producir el efecto tras la unión

CURVA DOSIS-RESPUESTA

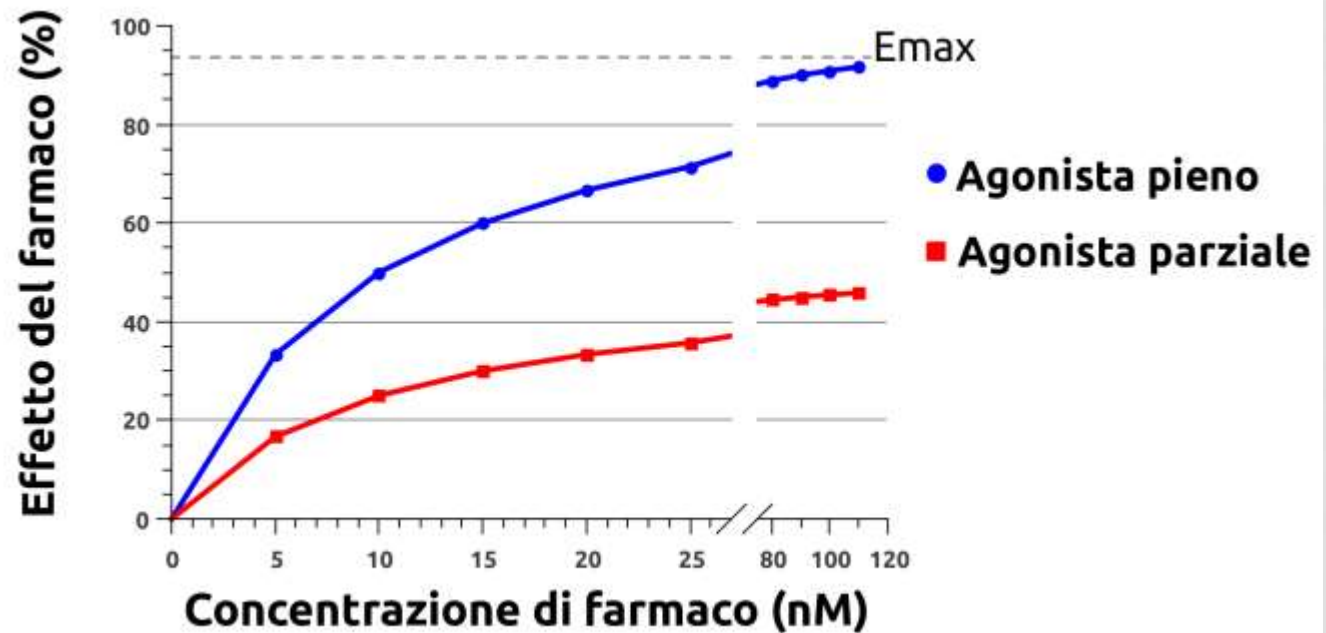
- Ilustración de un efecto observado de un fármaco en función de su concentración en el compartimiento de receptores. (Se estudia en órgano aislado)



- **POTENCIA:** dependencia que muestra el efecto respecto de su concentración. Es la dosis capaz de generar una respuesta. Depende de la afinidad. Un fármaco es más potente si para generar la misma respuesta debe administrarse una dosis menor.
- **EFICACIA MÁXIMA o ACTIVIDAD INTRÍNSECA:** Propiedad del agonista. Es la máxima respuesta capaz de observarse con una dosis determinada en un órgano aislado. Se observa en la curva como la fase de asíntota máxima.

TIPOS DE FÁRMACOS

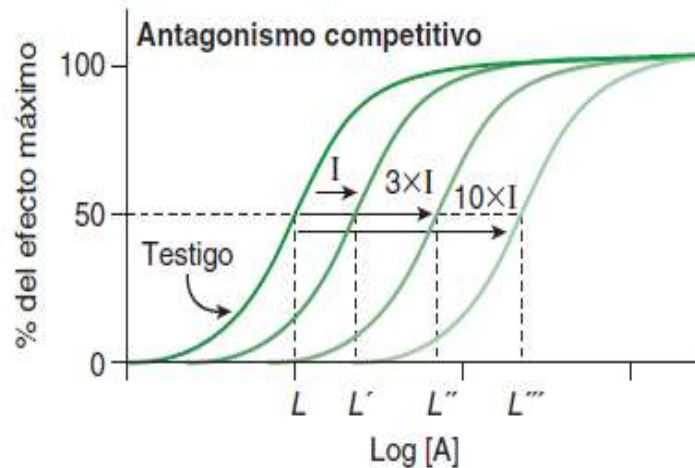
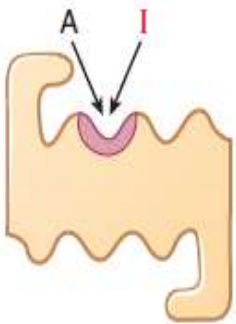
- AGONISTAS
 - Total
 - Parcial



TIPOS DE FÁRMACOS

- ANTAGONISTAS
 - Competitivos

Competitivo



- No competitivo
- Alostérico

Alostérico

