

Curso Auxiliar Enfermería

Módulo 10

Nociones de Farmacología

La **farmacología** es la ciencia biomédica que estudia el origen, las propiedades fisicoquímicas de los fármacos y las interacciones fármaco-organismo. Se considera de manera general como el estudio de los fármacos, y tiene una connotación clínica cuando dichos fármacos son utilizados para el diagnóstico, prevención y tratamiento de una enfermedad.

Un **fármaco**, entonces, es aquella sustancia que produce efectos medibles en los organismos vivos y que se absorbe, es susceptible de transformarse, almacenarse o

eliminarse de dicho organismo, y lo más importante, que desencadena una actividad biológica en el mismo.

Cuando hablamos de **medicamentos**, nos referimos a la manera en que estos fármacos llegan al individuo, conteniendo uno o la combinación de varios fármacos junto con otras sustancias denominadas excipientes, estos últimos son compuestos inertes que facilitan su administración.

Cabe mencionar que, se entiende por **droga** -desde el punto de vista farmacológico-, a aquella sustancia de abuso de origen natural o sintética, que introducida en el organismo por cualquier vía de administración, produce una alteración de algún modo, del natural funcionamiento del sistema nervioso central del individuo y es, además, susceptible de crear dependencia, ya sea psicológica, física o ambas. Muchos fármacos pueden caer en el rubro anterior y ser considerados una droga.

Farmacocinetica

Es la rama de la farmacología que se encarga de estudiar los mecanismos de liberación, absorción, distribución, biotransformación y excreción de los medicamentos. Es decir, estudia los procesos a los que es sometido el fármaco, por acción del organismo vivo.

La **liberación** es la primera etapa de los procesos por los que pasará el fármaco en el organismo, y con base en ésta generalmente se determinará el inicio de la acción, la velocidad de absorción y la biodisponibilidad. Constituye la separación del principio activo de los componentes de la forma farmacéutica que le

sirve como vehículo. Por lo general, implica la desintegración, disgregación y disolución del fármaco.

La **absorción** es el paso del fármaco desde el sitio de administración hasta el compartimiento central. Generalmente, es necesario que el fármaco atraviese varias membranas biológicas para así llegar a la circulación general y posteriormente a su sitio de acción. Estas membranas tienen una función de barrera, representando cierto grado de selectividad al momento de permitir el paso de los fármacos a través de ellas, facilitando el de ciertos fármacos o impidiendo el de otros.

La absorción afecta a la biodisponibilidad, es decir, a la cantidad y la velocidad con que un fármaco alcanza su lugar de acción.

Los factores que afectan a la absorción (y por tanto a la biodisponibilidad) incluyen

- La forma en la que un fármaco está diseñado y fabricado
- Sus propiedades físicas y químicas
- Los otros componentes que contiene
- Las características fisiológicas de la persona que toma el fármaco
- Cómo se almacena el fármaco

Cuando administramos un fármaco, los factores que determinan el tiempo en que éste alcanza el sitio de acción y la cantidad del principio activo que se requerirá para lograr el efecto deseado, van de la mano de la presentación del fármaco, su vía de administración y las condiciones fisiopatológicas del paciente. La *biodisponibilidad* nos hace referencia a la fracción de la dosis administrada de un fármaco que se encuentra disponible, ya sea en el sitio de acción o en la circulación sistémica. Esto permite valorar la eficacia e interacción entre los tres factores antes mencionados y

que dependen así mismo de la absorción, distribución y eliminación del mismo.

La absorción y la biodisponibilidad del fármaco pueden resultar afectadas por los alimentos, por otros fármacos y por trastornos digestivos. Por ejemplo, los alimentos con un alto contenido en fibra y los suplementos de calcio pueden unirse a un fármaco y evitar su absorción. La absorción del fármaco puede reducirse debido a la diarrea y a la administración de laxantes, que aceleran el paso de las sustancias por el tracto gastrointestinal. También puede afectar la absorción de un fármaco la extirpación quirúrgica de partes del tracto digestivo (como el estómago o el colon).

Por otra parte, la biodisponibilidad puede verse afectada por la duración y la forma en que se haya almacenado un fármaco. El principio activo de algunos productos se deteriora y se vuelve ineficaz o nocivo en caso de un almacenaje inapropiado o demasiado prolongado. Por eso algunos productos deben ser guardados en el frigorífico o en un lugar fresco, seco y oscuro. Las indicaciones de

almacenamiento y las fechas de caducidad deben cumplirse estrictamente en todo momento.

Distribución - Se entiende por distribución de un fármaco al movimiento de este hacia y desde la sangre y diversos tejidos del cuerpo (por ejemplo, tejido adiposo, muscular y cerebral), y las proporciones relativas del fármaco en los tejidos.

Tras el proceso de absorción o aplicación en el torrente sanguíneo, las moléculas de un fármaco se distribuye en el plasma y en el líquido intracelular, y su posterior cinética dependerá tanto de las propiedades químicas del fármaco, así como de las características intrínsecas del organismo (pH, procesos enzimáticos, velocidad metabólica, etc.).

Generalmente los fármacos viajan a través del plasma de manera libre, por medio de la fijación a proteínas plasmáticas (como la albúmina) o incorporados en células (principalmente eritrocitos). Posteriormente, comenzará a distribuirse a través de la circulación y llegará primero a aquellos órganos que tengan mayor aporte sanguíneo.

Su acción en las células dianas dependerá de su concentración, su afinidad por los sitios de unión y el número de éstos, así como por su capacidad de unión a proteínas plasmáticas, que es reversible y se comportará de acuerdo a las características físico-químicas del mismo fármaco.

Metabolismo - Una vez que los xenobióticos entran al organismo son absorbidos y distribuidos a través de la sangre para alcanzar a sus tejidos diana, donde ejercerán su acción farmacológica específica. Sólo una ínfima parte del fármaco alcanzará su célula diana mientras que el resto será metabolizado y finalmente eliminado.

El sitio principal del metabolismo de los fármacos es el hígado.

Los fármacos pueden ser metabolizados por oxidación, reducción, hidrólisis, hidratación, conjugación, condensación o isomerización; sea cual fuere la vía elegida, el objetivo es facilitar su excreción. Existen enzimas metabólicas en muchos tejidos, pero son especialmente abundantes en el hígado.

La velocidad del metabolismo de los fármacos no es igual en todos los individuos. En algunos, el metabolismo puede ser tan rápido como para impedir que se alcancen concentraciones sanguíneas y tisulares terapéuticamente eficaces; en otros puede ser muy lento, con lo cual dosis normales pueden provocar efectos tóxicos. La velocidad del metabolismo de los fármacos en los distintos individuos depende de factores genéticos, enfermedades concomitantes (especialmente las enfermedades hepáticas crónicas y la insuficiencia cardíaca avanzada) e interacciones farmacológicas (sobre todo las que implican inducción o inhibición del metabolismo).

En muchos casos, el metabolismo de los fármacos comprende dos fases. En las reacciones de fase I se forma, modifica o elimina (oxidación, reducción o hidrólisis) un grupo funcional; estas reacciones no son de carácter sintético. Las reacciones de fase II consisten en la conjugación con sustancias endógenas (p. ej., ácido glucurónico, sulfato, glicina); estas reacciones son de carácter sintético.

Los metabolitos que se forman en las reacciones sintéticas son más polares y por lo tanto más fáciles de excretar por vía renal (en la orina) o hepática (en la bilis) que los que lo hacen en las reacciones no sintéticas. Algunos fármacos sólo experimentan reacciones de fase I o de fase II; por lo tanto, la numeración de las fases es una clasificación funcional, no secuencial.

Excreción - Los riñones son los órganos principales para la excreción de sustancias hidrosolubles. El sistema biliar colabora también en la excreción siempre y cuando el fármaco no sea reabsorbido a partir del tubo digestivo. En general, la contribución del intestino, la saliva, el sudor, la leche materna y los pulmones a la excreción es pequeña, excepto en el caso de la exhalación de los anestésicos volátiles. La excreción a través de la leche materna puede afectar al lactante que es amamantado.

La excreción renal de fármacos disminuye con el envejecimiento; a los 80 años, la depuración suele encontrarse reducida a la mitad del valor a los 30 años. La excreción renal de fármacos también puede cambiar con diversas condiciones de salud. En pacientes críticos, la lesión renal puede disminuir temporalmente la excreción renal de fármacos; en cambio, la depuración renal aumentada (por ejemplo, en pacientes críticos que pueden ser más jóvenes y tener función renal intacta) puede aumentar la excreción renal de fármacos, lo que resulta en concentraciones plasmáticas subterapéuticas de ciertos fármacos, especialmente antibióticos, tanto en niños como en adultos.

Excreción biliar: Algunos fármacos pasan por el hígado inalterados y son excretados con la bilis. Otros son convertidos en metabolitos en el hígado antes de que sean excretados con la bilis. En ambas situaciones la bilis entra en el tracto gastrointestinal, y a partir de ahí los fármacos son eliminados con las heces o bien son reabsorbidos en el torrente sanguíneo y, por lo tanto, reciclados. Se denomina ciclo enterohepático a la reabsorción intestinal hacia el torrente circulatorio de un fármaco secretado en la bilis. El sistema de excreción biliar elimina sustancias del organismo sólo si el ciclo enterohepático no es completo, es decir, si parte del fármaco excretado no es reabsorbido en el intestino.

Si el hígado no funciona con normalidad, y si el fármaco se elimina principalmente por metabolismo hepático, deberá ajustarse la dosis del fármaco. Sin embargo, no existen procedimientos simples, similares a los que se utilizan para valorar la función renal, que permitan establecer la capacidad del hígado para metabolizar (y en consecuencia eliminar) los fármacos.

Vías de Administración

Podemos clasificar las vías de administración dependiendo de la manera en que el fármaco llega al sitio de acción. De esta forma, encontramos dos grupos: las vías de administración que atraviesan barreras fisiológicas —como la piel o las mucosas—, las cuales se denomina mediatas o indirectas y las vías de administración inmediatas o directas, las cuales requieren de un medio que deposite el fármaco directamente sin tener que atravesar estas barreras por sí mismo.

Además se pueden clasificar en Enterales o Parenterales dependiendo del uso o no del tracto digestivo para la administración del medicamento.

Veamos a continuación algunos ejemplos de las principales vías de administración:

Enteral (digestiva)

Oral

La absorción por medio de esta vía se lleva a cabo en la mucosa estomacal e intestinal por difusión pasiva, determinado por la naturaleza química del fármaco así como las variables condiciones de pH que se presenten en el medio.

Algunos factores pueden condicionar la absorción de los fármacos por esta vía, como el tiempo en que se pone en contacto el fármaco en las mucosas gastrointestinales, la forma farmacéutica y el tamaño de las partículas, algunos excipientes, la presencia o ausencia de comida, la edad, el embarazo, algunas anomalías hereditarias o trastornos congénitos, la utilización de otros fármacos etcétera

Sublingual

La absorción por esta vía se ve beneficiada por una amplia vascularización del epitelio, el cual es aún mayor en la base de la lengua y en la pared interna de las mejillas, y se da principalmente por difusión pasiva. El fármaco será absorbido por la mucosa sublingual accediendo por las venas maxilares y sublinguales, pasa a las yugulares y por último llega a la vena cava superior que desemboca en la aurícula derecha. Debido a que el pH de la saliva es ácido, la absorción de ácidos débiles y bases muy débiles es mejor y, en general, las sustancias liposolubles son absorbidas rápidamente.

Rectal

Esta vía se emplea para administrar fármacos que irritan la mucosa gástrica, que se destruyen por el pH o enzimas digestivas, o ya sea por su mal sabor u olor, su uso también es conveniente en niños o en pacientes inconscientes. El problema de esta vía es que no se puede asegurar una exposición directa y continua con la mucosa, ya que el fármaco suele mezclarse con el contenido rectal, provocando con

esto que su absorción sea irregular y disminuya (se pueden utilizar enemas para disminuir estas variaciones). Los supositorios usan vehículos como la gelatina, glicerina o manteca de cacao para no irritar las mucosas, los cuales disminuyen aún más su absorción.

Parenteral (no digestiva)

Subcutánea

El fármaco se inyecta bajo la piel y se difunde a través del tejido conectivo penetrando en el torrente circulatorio. La absorción se da principalmente por difusión simple o a través de poros de la membrana endotelial.

Intramuscular

El líquido se disemina a través del tejido conectivo que se encuentra entre las fibras musculares, por lo que su absorción es más rápida que la vía subcutánea y menos dolorosa. Es ideal para fármacos que no se absorben por vía oral o que pueden modificarse en este medio, así como para aquellos en los que se desea evitar el primer paso hepático

Intravenosa

Es la vía más rápida para la administración de un fármaco porque lo deposita directamente al torrente sanguíneo y evita alteraciones del mismo. Es muy útil en emergencias. El ritmo de administración puede ser regulado, al igual que la dosis, y la regulación de la concentración, evaluando frecuentemente las concentraciones plasmáticas.

Intraarterial

Es menos utilizada porque su aplicación resulta más complicada. Es útil en el tratamiento de neoplasias localizadas o administración de vasodilatadores en embolias arteriales. Sin embargo, su principal uso es con fines diagnósticos para realizar arteriografías mediante la aplicación de medios de contraste o tomas de muestra para la realización de gasometrías.

Otras:

Vía respiratoria

Los fármacos administrados por esta vía son principalmente anestésicos generales, broncodilatadores, antibióticos, corticoides, etcétera, su absorción es rápida gracias a la extensa superficie de la mucosa traqueal y bronquial (80-200 m²) y la proximidad que existe entre los vasos pulmonares y la mucosa, alcanzando así rápidamente la circulación general y, por tanto, su efecto se da en todo el organismo

La velocidad de absorción dependerá de: la concentración de la sustancia en el aire inspirado, la frecuencia respiratoria, la perfusión pulmonar y la solubilidad de estas partículas en la sangre. Estos medicamentos pueden ser de dos tipos:

líquidos, que se administran con ayuda de nebulizadores, o partículas sólidas que son aplicadas con aerosoles. Los beneficios de esta vía incluyen: • Absorción casi instantánea. • Eliminación de las pérdidas por el efecto de primer paso. • Aplicación local del fármaco en el sitio de acción buscado para neumopatías. Existen algunos inconvenientes para aplicar fármacos por esta vía, principalmente la imposibilidad de regular la dosis de administración así como las molestias e irritabilidad de las mucosas que causan algunas sustancias

Vía Dérmica

Debido a las características de las células que componen estas estructuras, la absorción de los fármacos es deficiente y su uso se extiende cuando nuestro interés radica en llevar al principio activo a esta zona específicamente, es decir, cuando el efecto que buscamos es local.

Ciertas condiciones —como la inflamación y el aumento de la vascularidad— favorecen la absorción del fármaco. Estos fármacos utilizan vehículos grasos para su aplicación, que se clasifican de acuerdo a su consistencia

Farmacodinamia

Rama de la farmacología encargada de estudiar las acciones y los efectos de los fármacos sobre los distintos aparatos, órganos, sistemas y su mecanismo de acción bioquímico o molecular.

Acción: denota el resultado de la interacción entre el fármaco y las estructuras moleculares en las que actúa, desencadenando cambios estructurales y funcionales que modifican los procesos bioquímicos y fisiológicos del organismo.

Efecto o respuesta: es la expresión de los cambios estructurales y funcionales que genera un fármaco en su sitio de acción, que se manifiestan de manera macromolecular y que pueden ser observados y cuantificados, sean estos químicos y/o fisiológicos. Los efectos pueden ser terapéuticos o colaterales.

Terapéuticos	Colaterales
<ul style="list-style-type: none"> • Modifican el curso normal de la enfermedad. • Restablecer la función normal del organismo. 	<ul style="list-style-type: none"> • Efectos producidos por el fármaco, que no favorecen o empeoran el curso de la enfermedad • Aparición indeseable durante la aplicación del medicamento

Órgano blanco: también conocido como “célula diana”, es la célula o componente orgánico que tiene los receptores específicos para el fármaco en sus

componentes estructurales, y que permiten que se generen los cambios físico-químicos para desencadenar el efecto del fármaco.

La **acción de los fármacos** puede clasificarse dependiendo el sitio donde se manifiesten sus efectos en el organismo, ya sea local o sistémica.

Así mismo, la acción de éste puede clasificarse dependiendo si las modificaciones estructurales o químicas son de carácter reversible o irreversible.

Acción local

Se refiere a la acción del fármaco que tiene lugar en el sitio de aplicación directa sin que ingrese a la circulación sistémica.

Acción sistémica

Para que el fármaco pueda alcanzar su célula diana debe ser primeramente absorbido hacia la circulación sistémica. Cabe mencionar que al viajar un fármaco por el torrente sanguíneo, cualquier célula que presente receptores con los cuales pueda interactuar el fármaco, pueden ser susceptibles de sus efectos y generar efectos colaterales

Reversible

Un fármaco cuya acción es reversible, se refiere a todo aquel cuyo efecto depende de la presencia continua del fármaco en el sitio de acción, ya que al inactivarse o eliminarse, las moléculas con las que interactuaba retoman sus funciones o estructuras originales. Así mismo, las células que fueron afectadas por su acción regresaran a su estado funcional normal.

Irreversible

Los fármacos tienen una unión muy fuerte con el receptor, lo que evita que se separen y perpetúa la acción del fármaco. Algo importante con respecto a esta unión es que al ocuparse todos los receptores, el efecto será el mismo aunque se aumente la dosis.

Farmacometría

La farmacometría es la rama de la farmacología que establece cuánto y cada cuándo es necesario administrar un fármaco para obtener el efecto deseado, además de que permite evaluar y comparar la seguridad y efectividad de los fármacos.

En las fases experimentales se cuantifica el efecto farmacológico realizando las llamadas curvas “dosis-respuesta o dosis-efecto”, mientras que en la fase clínica se utilizan ensayos clínicos que comparan al fármaco en estudio con otra sustancia o

procedimiento vigente para el tratamiento de un problema de salud específico, deben ser realizados de manera preferente con asignación aleatoria de los pacientes y con la técnica de doble ciego.

A fin de obtener un efecto farmacológico útil se requiere mantener la concentración del fármaco en un nivel tal que garantice, por una parte, la respuesta de la unidad biológica y, por la otra, que no produzca efectos tóxicos

La *potencia de un fármaco* relaciona la cantidad o dosis administrada y la acción que produce. De esta forma, diríamos que un fármaco es tanto más potente que otro cuanto menor sea la dosis administrada en comparación con el segundo para conseguir la misma acción, es decir: es más potente aquel que requiera la menor dosis para un mismo efecto deseado.

La *eficacia de un fármaco* se mide a través del efecto máximo que es capaz de alcanzar en un organismo, sin llegar a tener relación proporcional a la dosis administrada; es decir: una vez que se logró un efecto máximo, el incremento del fármaco y su concentración no aumentará su efectividad, por lo tanto entre mayor efecto máximo en relación a lo deseado logre un fármaco será considerado más efectivo.

La obtención de estos datos a través de la farmacometría nos permite entender que el efecto máximo depende principalmente del número de receptores que existan en la membrana, y de los mecanismos de amplificación que existan en el citoplasma, limitando la dosis específica del fármaco con utilidad terapéutica evitando que se sobrepasen dosis que por el contrario podrían producir efectos tóxicos o incluso letales.

En contraparte, *la dosis mínima* es la menor cantidad de fármaco que produce el efecto terapéutico, pudiendo reflejarse como el punto que se logra cuando comienzan los efectos del fármaco que pueden o no detenerse ahí según el deseo clínico.

Posología

La posología es una rama de la farmacología que se encarga del estudio de la dosificación de los fármacos (dosis terapéutica). En materia de medicamentos, la posología de un medicamento es la dosis (cantidad del medicamento medida en grageas o por ml por ejemplo) que debe administrarse al paciente en cada toma diariamente. Las recetas médicas deben indicar la posología en lenguaje claro para el paciente.

Farmacología

Es el campo de estudio de las reacciones adversas o indeseables que se espera puedan ser provocadas de manera simultánea al efecto principal del fármaco, incluso cuando es administrado de forma adecuada.

Con la finalidad de no causar confusión en el análisis de esta rama de la farmacología general, resulta importante aclarar algunos términos:

El efecto principal (deseado) de un medicamento consiste en disminuir o suprimir toda molestia producida por una determinada enfermedad, mediante la modificación de las funciones biológicas.

Un *efecto tóxico* es el resultado perjudicial que causa un medicamento a un determinado individuo o sociedad. Tomando en cuenta que todo fármaco puede producir un efecto tóxico, es imprescindible asumir una actitud de vigilancia y responsabilidad en el momento de la prescripción de medicamentos, así como durante la administración el mismo.

La *sobredosificación* hace referencia a la intensidad en la que se producen los efectos farmacológicos debido a una mayor concentración del fármaco a nivel del sitio de acción, particularmente, en el receptor. La sobredosificación absoluta se ocasiona cuando la dosis que se administra es superior a los límites de la dosis permitida, mientras que la sobredosificación relativa se debe a un incremento de la biodisponibilidad del principio activo a nivel del receptor pese a que la dosis administrada es la establecida.

Un *evento adverso* es cualquier acontecimiento médico desfavorable (que puede ir desde uno o varios signos o síntomas, alteración en las pruebas de laboratorio, o incluso el establecimiento de una enfermedad o síndrome), producido por la administración de un fármaco, el cual está siendo sometido a estudios de investigación clínica, o que es utilizado como tratamiento de la enfermedad del paciente.

El *efecto colateral* es aquel que resulta de forma consustancial al efecto de la acción farmacológica propia del medicamento pero que es indeseable durante su administración.

El *efecto secundario* surge como consecuencia de la acción o efecto principal del medicamento, sin formar parte del mismo. Es difícil distinguir entre un efecto colateral y otro secundario, por lo que la mayoría de las veces su distinción es meramente académica.

Reacción alérgica: es una reacción inmunológica, producida por el carácter antigénico que adquiere un fármaco o sus metabolitos, independientemente de si son o no proteínas. Este tipo de reacciones pueden ser causadas por cualquier sustancia química; sin embargo, se requiere de un primer contacto sensibilizante (previo) con ese mismo medicamento u otro de estructura similar (sensibilidad cruzada) y un contacto desencadenante (nuevo) que induzca la reacción antígeno-anticuerpo.

La *reacción idiosincrásica* es la respuesta anormal que tienen algunas personas frente a la administración de un medicamento bajo dosis normales. Dicha reacción se debe, generalmente, a una particular dotación enzimática del individuo, de forma tal que si un organismo determinado presenta o carece de una determinada enzima encargada del metabolismo de un fármaco, la reacción consistirá en una exageración o disminución del efecto terapéutico o tóxico; sin embargo, si la enzima está relacionada con otro aspecto de la biología su afectación inducirá un nuevo efecto, independiente de su acción terapéutica normal.

El término reacción adversa a medicamentos (ram) se define, según la oms, como todo aquel efecto nocivo o indeseado que se presente posterior a la administración de un fármaco a las dosis utilizadas normalmente para la profilaxis, diagnóstico o tratamiento de una enfermedad o para la modificación de una función fisiológica.

Por lo tanto, esta definición rechaza toda aquella reacción o efecto producido por errores terapéuticos, intoxicaciones intencionales o accidentales, abuso en el consumo de drogas o medicamentos, así como errores en la administración del fármaco o por incumplimiento de las indicaciones terapéuticas.

La *tolerancia* es la disminución de la sensibilidad del organismo a la respuesta farmacológica, condicionada por la exposición previa al fármaco y manifestada únicamente durante la administración subsecuente del mismo; es decir, una resistencia exagerada al medicamento para que un individuo responda a una dosis habitual.

La *intolerancia* es una reacción o efecto que obedece a la hipersusceptibilidad del organismo a una determinada sustancia o fármaco, sin que exista un componente antígeno-anticuerpo. En otras palabras, se puede explicar como la existencia en personas susceptibles, de un umbral más bajo para los efectos farmacológicos normales de un medicamento, que determinarán un estado en el que el organismo responda de forma exagerada ante la administración de un fármaco.