



Claudia Araya
Paz Bahamonde

Formas de administración de fármacos

2003 - Reservados todos los derechos

Permitido el uso sin fines comerciales

**Claudia Araya
Paz Bahamonde**

Formas de administración de fármacos

1. ADMINISTRACIÓN LOCAL: El F. se coloca directamente en el tejido blanco. No es la sangre la que lo lleva. Ej: inyección de anestésicos locales.

LA INTENSIDAD DEL EFECTO DEPENDE DIRECTAMENTE SÓLO DE LA DOSIS. No depende de la concentración sanguínea, ni de los procesos de la farmacocinética.

2. ADMINISTRACIÓN GENERAL O SISTEMICA; El F. es llevado por la sangre (circulación general) al tejido blanco.

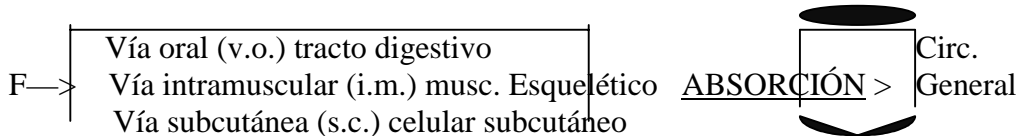
LA INTENSIDAD DEL EFECTO DEPENDE DE LA CONCENTRACIÓN SANGUINEA. Y LOS PROCESOS DE LA FARMACOCINÉTICA.

SE PUEDE REALIZAR POR:

a) INTRODUCCIÓN DIRECTA DEL F. EN LA SANGRE:

Ej: Vía endovenosa (e.v.), intra-arterial (i.a.) e intra-cardíaca (i.c.).

b) INTRODUCCIÓN DEL F. EN UNA ZONA DEL ORGANISMO LLAMADA RECEPTÁCULO.



CLASIFICACIÓN VIAS DE ADMINISTRACIÓN .

1.-VIAS NATURALES : Más empleada

vía oral

sub-lingual

rectal

Menos empleadas

pulmonar

piel

2.-VIAS ARTIFICIALES

PARENTERALES O INYECTABLES

INTRODUCCIÓN A LA FARMACOLOGÍA

Clase 12 - 03 - 01

FARMACOLOGÍA: Ccia. q' estudia los Fármacos.

FARMACO (F.) : "Sust. extraña al org. que modifica la función de un determinado órgano o sistema";pero no siempre son sustancias extrañas, porque tb. hay sust. fisiológicas como la adrenalina, hormona que tb. existen como Fs. al hablar de F. nos referimos más bien a medicamentos...

MEDICAMENTO: "Toda sust. natural o sintética, o mezcla de ellas , que se destine a la administración al hombre, con fines de curación, atenuación, tratamiento, prevención específica y diagnostico de las enf.s y/o sus síntomas". Por lo tanto se refiere a una sust. Beneficiosa para que cure una enf. , pero no hay sust. Que no produzca una **R.A.M.** (reacción adversa medicamento). El conjunto de estudio de reacciones adversas controlado en Chile por el instituto de salud pública se llama FARMACO VIGILANCIA (se avisa si un medicamento tiene R.A.M. y cuales son).

DROGA: Se refiere a fármacos más tóxicos, beneficiosos y no ; pero en Chile es un grupo de sust. Sujetas a control generalmente de uso ilegal como cocaína , marihuana, LSD, etc.

TÓXICOS Y VENENOS: Con efectos totalmente indeseables para el ser humano como los pesticidas que son medicamentos para las plantas no para el hombre.

Hoy en día casi todos los Fs. son sintéticos pero la mayoría nacieron de Fs. naturales, donde una vez que se obtiene la estructura química se forman los sintéticos. Ej.: Antibióticos del hongo Penicilinum, analgésicos como el ac. Salicílico de la corteza del sauce, antiinflamatorios como la morfina que se obtienen de un exudado lechoso de una planta, relajantes musculares del curare, glucósidos cardiacos a partir de la planta digitalis, etc.

Los medicamentos tienen diferentes denominaciones:

- a) Nombre Químico: que corresponde a lo que químicamente es, ej. Paraaminobenzoato de dietil etanol.
- b) Nombre genérico: Que es el mas importante, ej. Procaína
- c) Nombre comercial: ej, novocaina

Los principales medicamentos utilizados en odontología son: Anestésicos locales, antibióticos, antiinflamatorios, compuestos fluorados, relajantes musculares, antisépticos, analgésicos, hemostáticos, corticoides y ansiolíticos.

La importancia de la farmacología en odontología radica en que el cirujano dentista utiliza Fs todos los días y en que los pacientes pueden que estén bajo tratamiento con distintos Fs y hay que conocer las posibles interacciones no deseadas entre los diferentes Fs.

Cuando se estudia un nuevo medicamento, se estudia primero en animales en una FARMACOLOGÍA EXPERIMENTAL, para hacer estudios de toxicidad, ver sus efectos, etc. y luego se pasa a una FARMACOLOGÍA CLÍNICA en el hombre, donde no se puede hacer estos estudios, ni en embarazadas ni en niños. En hombre se ven las R.A.M. y se avisa a fármaco vigilancia.

FARMACO-CINÉTICA: "Estudio de los cambios q' el F. sufre en el recorrido por el organismo y que le hace el F. al cuerpo "

FARMACO-DINÁMICA: "Cambio que el F. produce en el organismo". El lugar donde se produce el efecto es el tejido blanco o susceptible, y para esto primero el F. tiene que unirse a un receptor y f. + receptor van a dar un efecto farmacológico en tejido blanco a través de segundos y terceros mensajeros.

Para que un fármaco llegue al tejido blanco, generalmente (90%) tiene que hacerlo por la sangre pero primero tiene que introducirse a la sangre y lo hace a través de otros tejidos llamados receptáculos que pueden ser el tubo digestivo, pulmón, músculo, tjdo. subcutáneo. Hay un porcentaje que llega directamente a la sangre, por una intravenosa por ejemplo, porque el F. no tiene otra vía.

También hay un porcentaje mínimo que llega directamente al tejido blanco como los ungüentos, cremas, gotas para los ojos, anestésicos locales que son Fs. que nunca deben pasar a la sangre y que se colocan al lado de su tjdo. blco. que son las terminaciones nerviosas.

Los Fs. llegan a la sangre por Absorción. La sangre es el transporte que lo va a distribuir a todo el organismo.

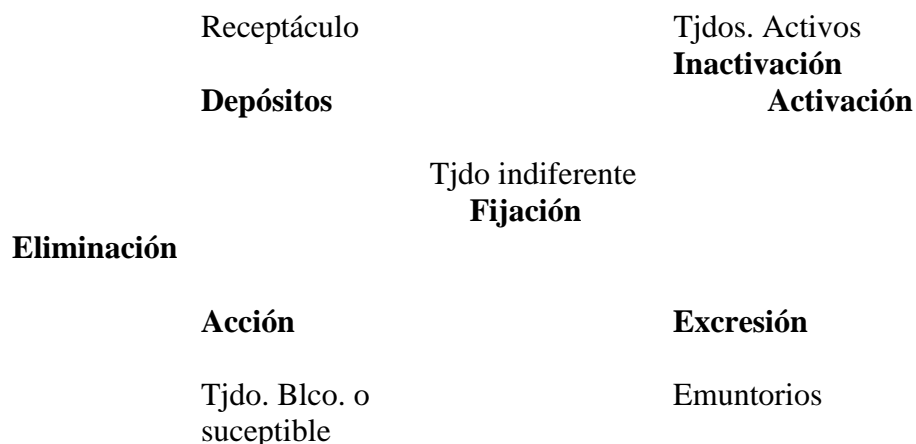
Hay Fs. que por su estructura qca. O naturaleza físico-qca. No pasan algunas barreras fisiológicas, por lo tanto no llegan a todos los órganos.

Los fármacos se fijan en distintos porcentajes a las proteínas plasmáticas, siendo la parte activa la que queda libre de unirse a estas proteínas. Este es un mecanismo activo de unión y desunión de F. a proteínas plasmáticas; también hay fijación en tjdo. graso . Por lo tanto la fijación es un proceso de amortiguación de los niveles de F. en la sangre, dejando una menor concentración por mas tiempo evitando las reacciones adversas.

Posteriormente desde la sangre puede pasar al hígado donde produce enzimas que biotransforman el F., lo inactivan o disminuyen su actividad por la formación de metabolitos que tienen menor actividad .- También se pueden activar en el hígado sobretodo los fármacos que se toman como pro fármacos.

Luego deben ser excretados y el órgano ppal. De excreción es el riñón pero también se excretapor saliva, orina, sudor, los gases por pulmón.

La eliminación es la unión de excreción e inactivación, son los dos procesos pero su eliminación puede estar dominado por uno de los dos.



FARMACOCINÉTICA

Es el estudio de los cambios que el fármaco sufre en el organismo.

Para que el F. ejerza su función se debe llegar a una concentración crítica al tejido blanco donde va a ejercer el efecto. Esta concentración va a depender de la dosis y de la magnitud y tasa de los procesos de Farmacocinética, de la Absorción, Distribución, Biotransformación y Excreción.

Absorción		Efecto Farmacológico
Fijación	Sangre	Reacciones Adversas
Biotransformación	[F Libre	Efectos Laterales
Excreción		

FARMACOCINETICA **NIVEL SANGUÍNEO**

FARMACODINÁMICA

El F. debe pasar muchas barreras, membranas para llegar al tejido blanco para poder ser excretado y usa los mismos procesos que una sustancia endógena.

La Membrana (MB) Biológica es un mosaico fluido, bicapa lipídica (Hidrofílica exterior, Hidrofóbica interior), y tiene proteínas que pueden actuar como receptor donde pueden llegar el F. y producir su efecto.

Existen 3 procesos por los que el F. puede pasar:

1°.- DIFUSION PASIVA O SIMPLE. Es la más importante porque la mayoría de los F. son liposolubles con un alto coeficiente de partición Lípido/Agua (Son Lípidos en agua), y difunden muy fácil a través de la Mb. en forma pasiva y a favor de la gradiente de concentración. *“Mientras más liposoluble el F. más fácil difunde por la Mb.”*

Otra característica para difundir es el tamaño y el peso molecular. Finalmente difunden los que tienen un Peso Molecular de 200-1000.

2°.- DIFUSION PASIVA O FILTRACION. Para los F. hidrosolubles que pasan por poros que se van formando cuando la Mb. se mueve lateralmente, y es a favor de la gradiente de concentración.

Filtran los f. de bajo Peso molecular, de no más de 200.

3°.- POR PROTEÍNAS TRANSPORTADORAS, a la cual se une el F. y pasa al otro lado de la Mb.

Hay dos tipos:

- 1) Activo, contra la gradiente de concentración (de menos concentración a mayor concentración), y el transportador utiliza ATP (hidrólisis de ATP). Este tipo existe en el riñón para poder excretar algunos F.
- 2) Difusión facilitada, que es a favor de la gradiente de concentración y no requiere Energía. Es el sistema que utiliza la glucosa y los aminoácidos que por sus características es difícil que atraviesen la Mb., por lo tanto los Fs. con características similares utilizan este transporte que es específico y saturable (Como todo sistema de transporte).

Absorción.-

Es el estudio del proceso desde que uno coloca el F. en el receptáculo o sitio de administración hasta que llega a la sangre, por lo tanto se puede medir determinando la concentración del F. en la sangre.

“Mientras más rápido se absorbe más rápido tiene efecto y más rápido se ve en la sangre”

3 Fármacos distintos con distintas velocidades de absorción. MEC: mínima concentración efectiva.

Fármaco “A” rápidamente aumenta su nivel sanguíneo y por lo tanto tiene su efecto más rápido que el F. “B”. Fármaco “C” no pasa la MEC y bajo este nivel no hay efecto.

FACTORES QUE REGULAN LA ABSORCION.

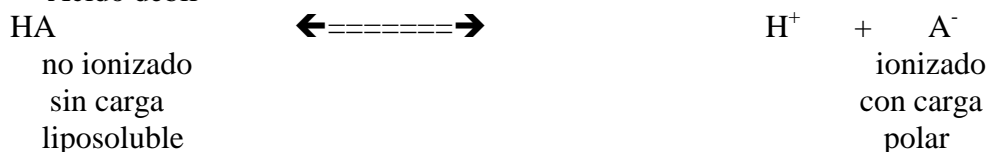
1) Factores propios de los Fs.:

a) Concentración o dosis: Si administramos un F. más concentrado vamos a tener más partículas de F. disuelto que pueden estar en contacto con la Mb. biológica para poder llegar a absorberse, por lo tanto *“a más concentración más rápido se absorbe.”*

b) Solubilidad: es importante porque si el F. no se disgrega no puede absorberse si se da por vía oral, pero acá lo más importante es que el F. sea liposoluble, porque *“a más liposoluble más fácilmente atraviesan las Mbs. y a la sangre”*.

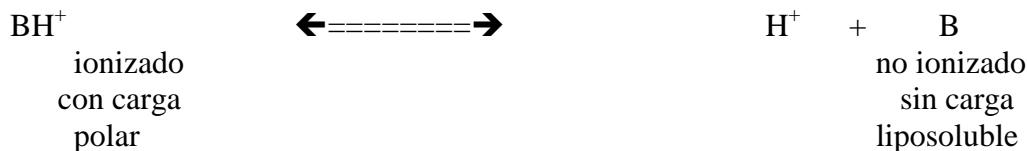
c) Ionización: tiene cierta importancia porque es el F. no ionizado el que se puede absorber. Muchos fármacos son electrolitos débiles que al estar disueltos se disocian.

■ Ácido débil



La ecuación va a depender del pH y pKa. Cuando el pH=pKa hay un 50% no ionizado y 50% ionizado.

■ Base débil



Si el ácido débil está en pH ácido hay muchos H⁺, por lo tanto la ecuación se desplaza hacia la formación de ácido no ionizado, por lo tanto la absorción es muy buena.

Si la base débil está en pH ácido, la ecuación se desplaza hacia la formación de base ionizada, por lo tanto tiene mala absorción, por lo tanto la base débil en pH básico se absorbe muy bien.

Concepto de pKa es derivado de la ecuación de Henderson-Hasenbach.

- Para ácidos

$$pK_a = pH + \log \left(\frac{F. \text{ no ionizado}}{F. \text{ ionizado}} \right)$$

- Para bases

$$pK_a = pH + \log \left(\frac{F. \text{ ionizado}}{F. \text{ no ionizado}} \right)$$

Ej.: Para ácido Acetilsalicílico

pH	% no ionizado
1	90 %
3	50 %
6	0,1%

Por lo tanto el pH ideal para encontrar más ácido acetilsalicílico no ionizado es con un pH muy ácido.

d) Forma farmacéutica (F.-F.), que es como viene el F. en el comercio. La F.-F. influye en la forma de absorción, por tanto en un mismo F. con distintas formas, la absorción es más rápida en líquido que en suspensión, cápsula o tableta.

La tableta es más lenta porque tiene que desintegrarse y luego diluirse, por lo tanto el proceso de absorción es con una velocidad menor.

1) Factores Propios del sitio de administración.-

- a) Superficie que existe en contacto con el F., es la más importante. El intestino tiene una gran superficie de contacto, por eso la mayoría de los F. se absorben en el intestino, a pesar que por el pH y pKa se debieran absorber mejor en el estómago, como la Aspirina. Por lo tanto la superficie es más importante que cualquier otra característica.
- b) Irrigación; mientras más irrigada la zona más rápidamente se absorbe, y por eso hay fármacos que se colocan en zona Sublingual, que aunque la superficie sea poca la irrigación es mucha.

Por esto para aumentar la absorción después de una inyección endovenosa se hacen masajes para dilatar y aumentar el flujo sanguíneo; y cuando uno no quiere que un anestésico local se absorba tanto se asocia con un Vasoconstrictor (N. Del T.: Vasoconstrictor periférico es un fármaco que produce contracción del músculo liso arteriolar, disminuyendo así el paso hacia la sangre del anestésico inyectado en el tejido intersticial y que éste continúe haciendo su efecto de bloqueo nervioso periférico)

- c) pH; que va a favorecer la ionización o no-ionización del F.

Para saber Si el F. se absorbió se puede ver la concentración sanguínea, pero para saber cuanto se absorbe se ve la **Biodisponibilidad**.

La BIODISPONIBILIDAD es la fracción o porcentaje del F. administrado por cualquier vía que llega a la circulación general en forma inalterada. También indica el grado de Absorción.

Absorción es el paso del F. a la sangre, y en ABC oral está indicada por el área bajo la curva.

La Biodisponibilidad se relaciona con el área bajo la curva cuando es por vía endovenosa porque no hay absorción.

Por lo tanto cuando relacionamos ambos ABC tenemos la Biodisponibilidad del F. (porque tenemos al F. con y sin proceso de absorción).

$$B(F) = \frac{ABC \text{ oral}}{ABC \text{ I-V}} \times 100 = \%$$

Ej.: Si un F. tiene una Biodisponibilidad de 40% quiere decir que sólo este porcentaje es el que tiene efecto, lo que llega a la sangre, y que el 60% restante se perdió.

Causas de una baja Biodisponibilidad

- a) baja Solubilidad del F. , y se puede deber a la falta de desintegración (que se ve mucho en tabletas donde el F. no se suelta de la tableta), o formación de complejos con los alimentos, P.Ej.: la tetraciclina no se debe tomar con leche porque forma un complejo que no se absorbe. También los forma con otros F. como los antiácidos que tienen Ca^{+2} , etc.
- b) Inactivación del F. cuando pasa por el tracto digestivo, y puede ser por acidez gástrica, enzimas bacterianas, enzimas intestinales, o primer paso hepático. La Penicilina se inactiva en gran parte por la acidez del estómago.

Efecto Primer Paso Hepático: En el intestino, con gran superficie, pasa el F. a la sangre y por la vena Porta va a una Primera Pasada por el hígado, donde se inactiva gran cantidad de Fs. por Biotransformación.

La Morfina no es administrada por vía oral porque es rápidamente biotransformada en el hígado, por tanto habrá que aumentar la dosis.

La eficiencia de un F. cuando uno sólo administra una sola dosis, es función de la velocidad de la magnitud de absorción.

No siempre la Biodisponibilidad de un mismo producto es igual, depende del laboratorio aunque sea la misma dosis y la misma forma farmacéutica; depende de la forma en que se haya preparado, porque cada F. tiene un principio activo y excipientes, y son estos los que deben favorecer la disolución, desintegración y absorción del F., y cambian según la forma en que se prepare.

2 Fs. con el mismo principio activo, misma forma farmacéutica, misma evolución a nivel sanguíneo, misma biodisponibilidad, misma administración y misma dosis, se dice que son **Bioequivalentes** porque llega a la misma concentración del F. a la sangre en el mismo tiempo.

T max → Tiempo al que aparece el efecto máximo.

Cuando T max es igual en dos Fs. y las Concentraciones máximas son iguales, los fármacos son bioequivalentes.

VIAS DE ADMINISTRACIÓN

Objetivo: Lograr que llegue el F. al tejido blanco a una Concentración que produzca un efecto adecuado.

Existen distintas formas de administrar un F. para lograr este objetivo:

1.- Administración Local: que va directamente en el tejido blanco, no es la sangre la que lo lleva. Ej.: los anestésicos locales.

La intensidad del efecto depende directamente de la dosis (si el anestésico no funciona se aumenta la dosis).

No depende de la concentración sanguínea ni de los procesos de farmacocinética.

2.- Administración Sistémica o General: Porque es la sangre la que lleva el F. al tejido blanco.

La intensidad del efecto depende directamente de la concentración sanguínea (por tanto cuando hay mayor intensidad del efecto, p. Ej.: más contracción del útero, es porque hay mayor concentración en la sangre del f. que contrae el útero), y como la concentración en la sangre depende de todos los procesos de la farmacocinética se dice que la intensidad depende indirectamente de los procesos de la farmacocinética.

Esta administración general o sistémica se puede realizar de 2 formas:

- a) introducir el F. directamente en la sangre, intravenosa, intra-arterial, o intracardíaca, y en este proceso no hay absorción.
- b) Introducir el F. en una zona del organismo llamado receptáculo, y desde aquí pasa por absorción a la circulación general.

En la vía oral, →receptáculo es el tracto digestivo

Vía intramusc. → “ es el músculo esquelético

Vía Subcutánea → “ es el tejido celular subcutáneo.

P. Ej.: por vía oral, desde el receptáculo, desde aquí el f. se va a moler y va a pasar a la circulación general, y el proceso del paso de un lado a otro se llama ABSORCIÓN.

CLASIFICACIÓN DE LAS VÍAS DE ADMINISTRACIÓN (Local y General)

a) Vías naturales, que son zonas que están comunicadas con el medio exterior.

- 1) más empleadas →vía oral
- 2) menos empleadas →vía sublingual
rectal
pulmonar
piel

b) Vías Artificiales, Parenterales o Inyectables, porque el F. se coloca en un lugar del cuerpo no comunicado con el medio exterior, y por tanto hay que romper tejido mediante una aguja.

- 1) Más empleadas →vía endovenosa
Vía subcutánea

Vía intramuscular

- 2) menos empleadas → Vía Intra-arterial
Vía cardíaca
Vía peritoneal

I.- VIAS NATURALES

1) VÍA ORAL

- Factores que influyen en la absorción de un F.:

1.1.- Peso molecular: a menor tamaño mayor absorción por filtración. El receptáculo por esta vía

es el estómago y/o el intestino delgado, y desde aquí se mueve por sí solo atravesando membranas hasta llegar a la circulación general. La 1ª membrana que atraviesa es la mucosa gástrica o la mucosa intestinal, y luego el endotelio capilar para llegar a la sangre de la vena porta, que no es circulación general, y por tanto la absorción no termina cuando llega a la vena porta, y al F. le queda pasar por el hígado que es un tejido evidentemente metabólico, donde se pierde F. por biotransformación, y este efecto se llama 1º paso hepático, y el F. que queda va a la circulación general. Todo el camino que recorre el F. desde la vía de administración hasta llegar a la circulación general es la absorción.

Cuando el F. se administra por vía sublingual o rectal no hace la Primera pasada por el hígado y pasa directamente a la circulación general.

El F. es llevado al hígado muchas veces más por medio de la arteria hepática, que corresponde a la circulación general, por tanto todas las vías una vez que tienen el f. en la circulación general van a pasar por el hígado.

P. Molecular → para que ingresen los F. deben tener un tamaño pequeño y por esto se absorben bien los de menor P.M., por *tanto a menor tamaño mayor mayor absorción por Filtración*.

Son pocos los F. con P.M. pequeño, la mayoría tiene P.M. intermedio o alto y pasan por difusión simple siempre y cuando sean liposolubles, que son los F. sin carga eléctrica, no ionizados, que se absorben por la vía oral.

Si toda la dosis está no ionizada su absorción va a ser muy buena, y si toda la dosis está ionizada, no va a haber absorción. Pero no todos los Fs. se comportan así, la mayoría se comportan como ácidos y bases débiles que al disolverse sólo una parte de ellos se ioniza.

La ionización de ácidos y bases débiles depende del pKa, que es distinto para cada F. y en 2º lugar del pH del medio gastrointestinal

Estómago PH 3,0 (ácido)	Intestino PH 5,3 (más alcalino)
ASPIRINA (ácido débil)	

$\text{HA} \rightleftharpoons \text{A}^- + \text{H}^+$	$\text{HA} \rightleftharpoons \text{A}^- + \text{H}^+$
Liposoluble Absorbido	hidrosoluble excretado
BASE DÉBIL	
$\text{B} + \text{H}^+ \rightleftharpoons \text{BH}^+$	$\text{B} + \text{H}^+ \rightleftharpoons \text{BH}^+$
Liposoluble Absorbido	hidrosoluble excretado
Liposoluble Absorbido	hidrosoluble excretado

El pH en el estómago es ácido con alto contenido de H^+ y un ácido débil es una sustancia que cede H^+ al medio, por tanto como el pH es ácido, hay H^+ en el medio y la ecuación se va a desplazar a la formación de ácido, forma no ionizada, y por tanto la absorción del F. ácido débil en el estómago va a ser buena porque ese pH favorece la forma no ionizada.

Como el pH del intestino es más alcalino, va a ocurrir lo contrario, y un ácido débil se va a disociar y va a ir a la forma ionizada, y en el caso de bases débiles a la forma no ionizada.

Sin embargo al comparar en que parte se absorbe más ácido débil uno diría que en el estómago porque el pH es más ácido, pero existe otro factor que influye y que es la superficie de absorción que es mucho mayor en el intestino que en el estómago, y por tanto hay mayor absorción de ácidos y bases débiles en el intestino que en el estómago (de la forma no ionizada), y esto se debe a que en el intestino (habiendo menos ácido no ionizado) se absorbe todo, y como la ecuación tiende a estar en equilibrio (dado por la Constante de Ionización), la ecuación se desplaza hacia la formación de ácido no ionizado y por tanto todos los ácidos se absorben mucho más en el intestino por una mayor superficie de absorción.

Otros factores importantes:

1.2.- Velocidad de vaciamiento gástrico

A menor velocidad de vaciamiento, menor absorción.

A mayor velocidad de vaciamiento, mayor absorción.

Como la mejor zona para absorber el F. es el intestino, una llegada tardía del F. desde el estómago al intestino con una velocidad baja de vaciamiento retarda la absorción, porque llega más lento al sitio donde se absorbe.

1.3.- Forma farmacéutica.

Las soluciones acuosas se absorben más rápido que las suspensiones, y éstas más rápido que las cápsulas, que se absorben más rápido que las tabletas.

Las soluciones acuosas son más rápidas porque el F. viene completamente disuelto, por tanto llega y se absorbe.

VENTAJAS VÍA ORAL:

- a) Vía más cómoda y económica (porque no se necesita un profesional para administrarla), permitiendo la autoadministración.
- b) Presenta poco riesgo porque su absorción es más lenta, por tanto si alguien ingiere una sobredosis por accidente, se pueden hacer lavados estomacales para sacar el F.
- c) Útil en tratamientos crónicos, en pacientes que toman por años Fs., ya que no es muy cómodo estar inyectándose.

DESVENTAJAS respecto a la vía E-V/ I-M y SC:

- Vía lenta, período de latencia mayor (porque la absorción es más lenta).
- No se aconseja usarla en emergencia porque es una vía lenta.
- No se puede usar en pacientes inconsciente ni con vómitos.
- No se puede usar en gastroenteritis aguda.
- Es la vía que presenta más factores que disminuyen la biodisponibilidad del F. (que es la parte de la dosis que llega a la circulación general).

FACTORES QUE DISMINUYEN LA BIODISPONIBILIDAD POR VÍA ORAL:

- ➔ Acidez gástrica, porque destruye algunos Fs. como por ejemplo la Penicilina G.
- ➔ Presenta enzimas digestivas que inactivan algunos Fs. como por ej.: la Insulina que es inactivada por la Pepsina.
- ➔ Presencia de alimentos de 2 formas:
 - d) porque se interponen entre el F. y la mucosa impidiendo la absorción.
 - e) Porque algunos alimentos forman complejos insolubles con algunos Fs. como p. Ej.: el Ca^{+2} de la leche.
- ➔ La disgregación incompleta de la Forma farmacéutica en el estómago o intestino.
 TABLETA ➔ TROZOS ➔ LIBERACIÓN DEL F. ➔ SOLUBILIZACIÓN DEL F.

Si la disgregación es incompleta, ya sea porque los excipientes no son de buena calidad, no se va a liberar el F. y la absorción va a ser mala.

- ➔ Pérdida que ocurre cuando el F. tiene un efecto de primer paso hepático importante, y sufren una biotransformación muy alta en el hígado y por tanto gran parte de la dosis se pierde (Ej.: la morfina).

2.- VÍA SUBLINGUAL.-

La superficie de absorción es muy pequeña pero con una gran irrigación y por tanto el F. tiene que disolverse muy rápido, como en la vía rectal (para que no se pierda en la saliva que se iría por la vía oral).

No se pueden dar Fs. irritantes o con sabor desagradable.

VENTAJAS de la sublingual con respecto a la oral:

- 1) Posible administración de Fs. que se destruyen en medio gastrointestinal.
- 2) No hay pérdidas por primer paso hepático.
- 3) El efecto comienza más rápido que por vía oral, por esto se usa esta vía para administrar Trinitrina en la Angina de Pecho.

3.- VÍA RECTAL.-

El receptáculo es la porción terminal del intestino grueso, la ampolla rectal.

Se utiliza cuando no es posible administrar el F. por la Vía Oral, como cuando el paciente tiene vómitos ó incapacidad para tragar, ó cuando el F. es destruido por enzimas digestivas ó tiene olor ó sabor desagradables.

Como la ampolla rectal tiene una superficie de absorción pequeña, la absorción desde la mucosa rectal es irregular e incompleta.

Las formas farmacéuticas empleadas son:

- 1.- Supositorios.
- 2.- Enemas (Soluciones Acuosas).

La administración por vía oral es para tener efecto tanto local como sistémico, como algunos antibióticos que no se absorben y que tienen efecto sobre las bacterias del estómago e intestino, al igual que los antiácidos que también tienen un efecto local.

4.- VÍA PULMONAR O RESPIRATORIA.-

La administración de fs. se diferencia de las otras porque los Fs. tienen Forma farmacéutica de gases, vapor ó suspensión en aerosol (como son los broncodilatadores).

Se administra el F. para tener un efecto general o sistémico, ó efecto local.

La absorción ocurre a nivel de los alvéolos pulmonares, el F. llega junto con el aire inspirado, y entra por difusión simple por el epitelio alveolar hacia la circulación general, sólo si es liposoluble.

DESVENTAJAS:

- 1.- Dificultad para regular la dosis.
- 2.- algunos Fs. irritan el tracto respiratorio.

5.- PIEL.-

Antiguamente se aplicaban algunos Fs. en piel para tener un efecto local, porque existe como barrera la capa córnea que impide que el F. se absorba.

Formas farmacéuticas más comunes para efecto local:

- A.- Cremas con corticoides.
- B.- Ungüentos con antibióticos.

Hoy en día existen algunos Fs. que se aplican en la piel para tener efecto general ó sistémico. La Forma farmacéutica empleada para este objeto son los **Parches Tópicos de Liberación Controlada, o Sistemas Terapéuticos Transdérmicos**, y son Fs. muy liposolubles y por esto pueden atravesar la capa córnea.

Tiene 3 Mbs. Y la microporosa
{ libera el F. a la piel en forma controlada.

La Mb. Microporosa tiene poros de distinto tamaño, dependiendo de la cantidad de F. que se quiere liberar.

VENTAJA:

- 1.- Liberan el F. en forma continua y controlada, por largos períodos (hasta 15 días).
- 2.- El F. llega a la circulación general sin pasar antes por el hígado. (Ej.: parches tópicos de escopolamina contra los mareos, y es un F. muy liposoluble).

F. liposoluble quiere decir que el F. es de alto **C.P. (Coeficiente de Partición) Lípido - Agua**, que es la relación que existe entre la solubilidad del F. en lípidos con respecto a la solubilidad en agua, y es una característica físico-química, que quiere decir que ese F. es más soluble en soluciones lipídicas que acuosas, pero no quiere decir que el F. sea insoluble en agua, por tanto F. liposoluble se puede administrar en solución acuosa.

Fs. en solución oleosa es una F.-F. donde el F. tiene como vehículo un solvente lipídico, y el F. tiene que pasar de una sustancia lipídica a una acuosa, y por tanto va a demorar más que si fuera una solución acuosa.

Por lo tanto, las soluciones oleosas se absorben más lento que las acuosas.

II.- VIAS ARTIFICIALES O PARENTERALES.-

1.- VIA ENDOVENOSA

No existe un proceso de absorción y se puede clasificar en dos formas de administración:

- f) *Émbolo ó inyección única a la vena pura*. El efecto es corto porque su nivel en la sangre va disminuyendo rápidamente:

Al poco tiempo de inyectado su concentración está en lo máximo, por tanto su efecto va a aparecer en pocos minutos, pero baja rápidamente.

- g) *Inyección endovenosa lenta*, donde la solución de F. entra a la vena por goteo, a una velocidad controlada, durante horas ó días. Este sistema de administración lenta se denomina **Fleboclisis**.

Debido a que se infunde por largo tiempo, el efecto es largo porque el nivel del F. en la sangre se mantiene constante.

Ventajas:

Se pueden administrar grandes volúmenes de F. y mantener constante en el tiempo.

Formas farmacéuticas para inyección endovenosa:

- 1.- Solución acuosa sin burbujas de aire ni partículas.
- 2.- soluciones acuosas ligeramente ácidas, alcalinas ó irritantes.
- 3.- No se pueden inyectar vía E-V, por provocar *Embolias*, Fs. en soluciones oleosas, suspensiones acuosas ni suspensiones oleosas (por ser partículas en líquidos).

Ventajas:

- a.- Inyección émbolo es útil en emergencia por inicio rápido del efecto y además la biodisponibilidad es del 100%.
- b.- La infusión lenta, a diferencia de cualquier otra vía, permite obtener el nivel sanguíneo que se desea sólo ajustando la velocidad de goteo, lo que permite dosificar mejor.
- c.- por la razón anterior, la infusión lenta es ideal para administrar Fs. de **estrecho margen terapéutico** (aquellos que tienen el nivel sanguíneo útil muy cerca del nivel sanguíneo tóxico.)

De la concentración tóxica hacia arriba tiene nivel tóxico, y hacia abajo no hay niveles tóxicos.

d.- se pueden administra Fs. irritantes siempre y cuando sea administración lenta.

e.- permite administrar grandes volúmenes.

DESVENTAJAS:

- Pueden formarse trombos por burbujas ó partículas.
- Reacciones anafilácticas más generales que por otras vías porque es más brusco el shock con las vísceras.
- Crisis nitriiloide, que consiste en una reacción adversa que se produce cuando la inyección se realiza muy rápidamente.
- Alteración local de pared venosa por mala técnica de administración del F. (N.del T.: *Flebitis*)

- Riesgo de infección por mala condición de asepsia.

2.- VIA SUBCUTÁNEA.-

La solución se inyecta en el receptáculo que es el celular subcutáneo, y se pueden administrar entre 1 a 2 cc3.

Es más rápida que las vías oral y rectal, porque se inyecta en contacto directo con los capilares, siempre y cuando sea en solución acuosa.

Se pueden inyectar:

- 1) Solución acuosa u oleosa, además de suspensión acuosa u oleosa, y cristalinas para que el efecto dure más.
- 2) Implantar **Pellets** que es *F. aglutinado en cilindros*, como a los alcohólicos que se les implanta un pellet de disulfiram para que al tomar alcohol les venga una reacción tóxica y el efecto dure bastante tiempo.

Por esta vía no se pueden administrar Fs. irritantes porque producen necrosis.

3.- VIA INTRAMUSCULAR.-

La solución se inyecta en el glúteo, o deltoides, hasta 10 cc3. La gran irrigación de estos músculos hace que esta vía sea más rápida que la subcutánea, rectal y oral, pero todo se fundamenta en su gran irrigación (por capilares).

Para que este efecto comience rápido el flujo sanguíneo debe ser normal, si está en shock el efecto ya no es rápido, en el hemofílico se contraindica porque puede producir hemorragia, al igual que en paciente tratados con anticoagulantes se puede producir hemorragia.

Se pueden administrar en soluciones acuosas y oleosas, y además suspensiones acuosas, oleosas y microcristalinas (N.del T.: ej. De suspensión microcristalina es la Penicilina- Benzatina).

El efecto se inicia más rápido con las soluciones acuosas.

Las suspensiones cristalinas Pueden durar días porque se van disolviendo más lentamente (N. Del T.: Penicilina - benzatina se libera en 30 días)

Orden de las Vías de Administración de Mayor a Menor período de Latencia

Vía Endovenosa → Intracardíaca → Respiratoria → Sublingual → Intraperitoneal
→ Intramuscular → Subcutánea → Oral = Rectal.

Todo esto en una respuesta sistémica, y no local.

La vía rectal no es muy buena porque la superficie es muy pequeña.-

[Facilitado por la Universidad de Chile](#)

Súmesese como [voluntario](#) o [donante](#) , para promover el crecimiento y la difusión de la [Biblioteca Virtual Universal](#).

Si se advierte algún tipo de error, o desea realizar alguna sugerencia le solicitamos visite el siguiente [enlace](#).

