

Facultad de Ciencias Médicas de Sagua La Grande.

Asignatura: Farmacología General.

Profesor que imparte la asignatura:

Dra. Yaquelin Martínez Chávez. Profesor asistente.

Dra. Yaima García Milera. Profesor asistente.

Correo electrónico: yaquelinmc@infomed.sld.cu

yaimagm@infomed.sld.cu

Tema 1: Introducción a la Farmacología.

FARMACOLOGÍA (Concepto): Es aquella ciencia que estudia las respuestas de los seres vivos a los medicamentos o drogas, buscando como meta final el mecanismo biológico que está detrás de esa respuesta.

Abarca el estudio del origen, propiedades físico-químicas, asociaciones de los fármacos así como sus efectos bioquímicos y fisiológicos, mecanismos de acción, absorción, distribución, metabolismo y excreción de los medicamentos (A.D.M.E.), los usos (con fines terapéuticos o no) y las dosis de dichas drogas.

Para el médico y el estudiante lo más importante es conocer las drogas útiles en el tratamiento, prevención o diagnóstico de enfermedades así como de aquellos medicamentos utilizados en la prevención del embarazo. También se ocupa del estudio de aquellos agentes químicos que son causa frecuente de envenenamientos domésticos o industriales, o de contaminación industrial. Finalmente, el médico comparte la responsabilidad social de ayudar a resolver el problema del abuso de drogas que puede llegar a constituir un grave problema en cualquier sistema de salud. Gracias a las medidas y la atención de nuestro gobierno esto no constituye un problema grave en nuestro país, elevándose así el nivel de salud de nuestra población, objetivo básico y fundamental de nuestro Sistema de Salud.

Concepto de fármaco o Droga: Es toda sustancia que puede utilizarse en la prevención, mitigación o curación de una enfermedad. También se utiliza para el diagnóstico de enfermedades y para prevenir el embarazo.

También se considera fármaco toda sustancia, cualquiera que sea su origen, con características apropiadas para constituir un medicamento, es decir, también se le llama fármaco al **principio activo** del medicamento.

Medicamento: Es la **sustancia medicinal y sus combinaciones** o asociaciones destinadas al uso humano o animal.

Especialidad Farmacéutica: Es el medicamento de composición e información definida, de forma farmacéutica y dosificación determinada, preparado para su uso medicinal inmediato, dispuesto y acondicionado para ser entregado al paciente; o sea, que constituye la **forma envasada o preparada que se obtiene en la farmacia.**

Respuesta Farmacológica: Es la respuesta que se produce por parte del organismo o tejido cuando se pone en contacto con determinada sustancia o droga y puede ser variable según la célula, el individuo o el fármaco. Está dado por la interacción de la droga con la célula.

Posología: Es la rama que trata sobre la dosificación de los medicamentos.

Dosis: Es una determinada cantidad de medicamentos. Ej. 5 mg. 1 gr. 250 mg.

TIPOS DE DOSIS:

Dosis mínima: Aquella dosis menor con la que se obtiene un efecto terapéutico.

Dosis máxima: Es la mayor cantidad de medicamento aceptada por el organismo y con la cual se obtiene un efecto terapéutico importante.

Dosis terapéutica: Es la que produce el efecto deseado en el paciente.
Ejemplo: Amoxicilina: en niños 40 mg/kg/día dividido en 3 subdosis (máximo 3 g/día).

Dosis letal media (DL50): Es la dosis capaz de producir la muerte en el 50% de los individuos tratados.

Dosis efectiva media (DE50): Es la dosis requerida para producir un efecto con una intensidad especificada en el 50% de los individuos a que se administra.

Margen de seguridad o índice terapéutico: Es la relación que existe entre la seguridad de una droga para producir los efectos deseados y los indeseables, (relación entre la DL50 y DE50).

RAMAS DE LA FARMACOLOGÍA:

a) **Farmacocinética:** Estudia la absorción, distribución, metabolismo y excreción de las drogas, estos factores junto con la concentración de una droga en sus sitios de acción y por ende la intensidad de sus efectos.

b) **Farmacodinámica:** Es el estudio de cómo actúan las drogas sobre los seres vivos, en sus procesos fisiológicos y bioquímicos, así como el mecanismo por el cual los realiza; su conocimiento es esencial para su uso en la clínica.

c) **Farmacología molecular:** Tiene su origen en la biología molecular, ciencia que surge en 1953, cuando se descifra el funcionamiento y la naturaleza de una molécula compleja: el DNA, que regula la vida y está presente en el núcleo de cada célula. Estudia la relación entre estructura química y actividad biológica.

d) **Farmacognosia:** Ciencia que describe las acciones de las sustancias naturales sobre los seres vivos, así como su origen y características físicas y químicas. En países en desarrollo o en estados de emergencias, la farmacognosia tiene un lugar destacado.

e) **Farmacogenética:** Ciencia que estudia las influencias hereditarias sobre las respuestas del organismo a la administración de sustancias químicas (medicamentos). También está interesada en el problema opuesto, o sea, como las drogas o medicamentos pueden influenciar o modificar el material hereditario causando mutaciones.

Ej.: La isoniacida es un medicamento antituberculoso que es metabolizado en el hígado en un tiempo no mayor de 1-2 horas en la mayoría de los individuos, pero aquellos que no poseen los genes para sintetizar la ACETILASA que metaboliza la isoniacida demoran de 3-6 horas para metabolizarla. Los primeros son llamados metabolizadores "rápidos" y los segundos, metabolizadores "lentos", los cuales pueden sufrir efectos indeseables al utilizar este medicamento en el tratamiento de la tuberculosis.

Esta misma situación es válida para otros medicamentos como la hidralacina y las sulfas.

Existen muchos medicamentos, entre ellos los citostáticos, como grupo de drogas más importante en este sentido. Además están los barbitúricos, los corticosteroides, las vitaminas, la cafeína, la nicotina, etc.

f) Farmacometría: Rama de la Farmacología que se encarga del estudio de las drogas determinando la concentración de principios activos.

g) Toxicología: Es la rama de la Farmacología que estudia los efectos adversos de las drogas. Se ocupa no solamente de las drogas usadas en la terapéutica, sino también de muchos otros productos químicos que pueden ser responsables de intoxicaciones domésticas, industriales y ambientales.

h) Farmacología Clínica: Estudia la acción de las drogas sobre los seres humanos sanos y enfermos y como el organismo afecta los factores farmacocinéticos de dichas drogas.

i) Farmacía: Estudia los procesos relacionados con la obtención de los medicamentos y su comercialización.

j) Terapéutica. Es el arte de aplicar los medicamentos y otros medios físicos, dietéticos y psíquicos al tratamiento de las enfermedades. En el caso de la farmacología solo es de interés la farmacoterapia, la cual aparece comprendida bajo el epígrafe de indicaciones terapéuticas o simplemente indicaciones. Todas las indicaciones deben estar basadas en conocimientos científicos, lo que constituye la base racional de la terapéutica.

k) Farmacoepidemiología. Se puede definir como la ciencia que estudia el impacto de los medicamentos en poblaciones humanas, utilizando métodos epidemiológicos, lo cual resulta entonces de la conjunción de la farmacología y la epidemiología. La farmacoepidemiología se ha desarrollado a partir de la farmacovigilancia, muy ligada a la etapa posterior de la comercialización (ensayos clínicos fase IV).

L) Farmacovigilancia. Está dada por el conjunto de métodos, que tienen como objetivo la identificación y valoración cuantitativa del riesgo que representa el uso agudo o crónico de un medicamento, en el conjunto de la población o en subgrupos específicos de ella.

CLASIFICACIÓN DE LAS DROGAS SEGÚN SU MÉTODO DE OBTENCIÓN:

- 1.- Naturales
- 2.- Semisintéticas
- 3.- Sintéticas

Ejemplos:

1.- **Naturales:**

- a) **Vegetal:** alcaloides de la belladona, del opio, del cornezuelo del centeno, de la Rauwolfia, glucósidos cardiotónicos, vinblastina, vincristina. Además, las drogas vegetales como la caña santa, guayaba, llantén, tilo, etc.
- b) **Animal:** extracto de hígado, de tiroides, insulina.
- c) **Mineral:** azufre, sales de hierro, zinc, calcio, sodio, etc.

De acuerdo al origen Independiente del reino que procedan en sintéticas y no sintéticas.

2.- **Semisintéticas:**

Se producen a partir de las fuentes naturales mediante procesos industriales. Ej. Penicilinas semisintéticas, metilmorfina (codeína), etilmorfina (dionina), diacetilmorfina, apomorfina, dihidrocodeína, etc.

3.- **Sintéticas:**

Proviene de la síntesis orgánica, que permite, mediante la modificación de la estructura química de un compuesto, obtener otros de mayor actividad farmacológica y menores reacciones secundarias. Ej. Ácido acetil salicílico, Propranolol, Guanetidina, Propantelina, Cimetidina, etc.

MECANISMOS FUNDAMENTALES DE ACCIÓN DE LAS DROGAS:

- 1.- Interacción con estructuras específicas (receptores).
- 2.- Interacción con enzimas.
- 3.- Interacción con corrientes iónicas.
- 4.- Interacción con transportadores.

1.- **Interacción con receptores:**

Las drogas están constituidas por moléculas y sus acciones resultan de la interacción entre las mismas y ciertas moléculas de la célula que constituyen los receptores y que se refieren a las drogas de acción específica. Los receptores son estructuras moleculares situadas en la superficie o en el interior de la célula efectora con las que reaccionan las drogas para producir una respuesta determinada. No son estructuras anatómicas visibles sino estructuras moleculares.

Ejemplos:

- Bloqueadores de receptores adrenérgicos:
 - Butoxamina.
 - Fentolamina.
 - Propranolol.
 - Labetalol.
 - Atenolol.

- Agonistas de receptores adrenérgicos:
 - Adrenalina.
 - Isoproterenol.

- Bloqueadores histaminérgicos:
 - Difenhidramina. ➤ Dimenhidrinato.
 - Clorciclicina.
 - Cimetidina.
 - Ranitidina.

2.- Interacciones con enzimas:

Muchos medicamentos deben su acción a interacciones con enzimas. Generalmente se produce inhibición enzimática por parte del fármaco, aunque pueden producirse estimulaciones de dichas enzimas.

Ejemplos:

- **Antiasmáticos:** Aminofilina: Inhibidor de la fosfodiesterasa.
- **Analgésicos, antipiréticos y antiinflamatorios:** Aspirina y drogas afines inhiben la ciclooxigenasa.
- **Hipotensores:** IECA: Inhibe la enzima convertora de Angiotensina.

3.- Interacciones con corrientes iónicas:

Algunos medicamentos interfieren con corrientes iónicas y debido a esto se deben sus acciones en el organismo.

Ejemplos:

- **Cromoglicato disódico:** (Intal) parece bloquear los canales de calcio de la membrana.
- **Anticálcicos:** Nifedipina, Verapamilo: bloquean los canales de calcio, útiles en patologías cardiovasculares.
- **Anestésicos locales:** Procaína, lidocaína, tetracaína: bloquean la conducción del impulso porque disminuyen o impiden el aumento de la permeabilidad de la membrana a los iones de sodio.

4.- Interacción con transportadores:

Omeprazol: Inhibe la bomba de H^+ - K^+ (célula parietal).
Digoxina: : Inhibe la bomba de Na - K (célula cardiaca).

CRITERIOS PARA LA SELECCIÓN DE UN MEDICAMENTO:

1. Eficacia.
2. Seguridad.
3. Conveniencia
4. Costo.

Eficacia: El efecto máximo producido por una droga se denomina eficacia o eficacia máxima.

Si los efectos indeseables de una droga limitan su dosificación, su eficacia se limita proporcionalmente, aunque tenga capacidad para producir un efecto mayor.

Ejemplo: Una de las diferencias importantes entre la morfina y el ácido acetil salicílico (ASA) es la diferencia en su eficacia y en su eficacia máxima. El opioide alivia el dolor de cualquier intensidad, mientras que el ASA es sólo efectiva frente al dolor leve y moderado.

Seguridad: Una droga tiene 1 ó 2 efectos predominantes aunque por lo general tienen varios efectos. La relación entre las dosis requeridas para producir los efectos deseables e indeseables de una droga se denomina margen de seguridad o índice terapéutico.

El margen de seguridad se define como la relación entre la dosis letal media (DL50) y la dosis efectiva media (DE50). Estas dosis ya fueron definidas.

Conveniencia: se refiere a la pauta de dosificación, por ejemplo la eritromicina se administra 4 veces al día y la azitromicina 1 vez al día, es más conveniente por tanto esta última.

Costo: Con el surgimiento de un gran número de drogas y su potencialidad de producir efectos indeseables, han aparecido legislaciones para la distribución de nuevos fármacos. Esas legislaciones han obligado a una serie de investigaciones que producen un aumento en el costo y en el tiempo necesario para venderse en el mercado, ya que es necesario realizar ensayos en animales para determinar la eficacia, seguridad, determinar los efectos indeseables a corto y a largo plazo, así como sus características farmacocinéticas.

Luego se ensaya en un número reducido de personas normales e individuos enfermos por determinado plazo de tiempo.

Sólo después de estas investigaciones será aprobada su distribución.

Bibliografía:

Básico:

- Farmacología general. Morón-Levy Cap. 1 Pág. 1-8. Y Cap. 6 Pág. 55-58.

Complementaria:

- Temas de Farmacología Miguel García. Tomo I.
- Bases Farmacológicas de la Terapéutica. Goodman y Gilman. Tomo I. Cap. 1.