

# *Apuntes de Farmacoquímica*

*Luis Capitanache, ISC.*

Versión web de este documento: <https://lcapitanache.github.io/cun/notebooks/farmacoquimica/>

---

## *Generalidades*

### *Qué es*

Es la ciencia que estudia las propiedades fisicoquímicas de los fármacos en cuanto a sus propiedades biológicas y que explica la relación que existe entre la estructura química y su acción farmacotóxica.

En síntesis, la Farmacoquímica:

1. *Se ocupa del diseño, síntesis y desarrollo de nuevos compuestos bioactivos* - Para la prevención, tratamiento y curación de enfermedades.
2. *Es el estudio de las bases químicas y farmacológicas* - Para determinar e interpretar la relación existente entre la estructura química, las propiedades fisicoquímicas y la actividad biológica.
3. *Es esencial para entender la LADME* - La liberación, absorción, distribución, metabolismo y excreción.

### *Relación con otras ciencias y disciplinas*

La Farmacoquímica se relaciona con otras ciencias y disciplinas, como por ejemplo: la *Bioquímica* y la *Biología Molecular*, la *Biotecnología*, la *Farmacología*, la *Fisicoquímica*, la *Matemática*, la *Química Analítica*, la *Química Orgánica* y la *Tecnología Farmacéutica*, entre muchas otras.

### *Antecedentes históricos*

Los inicios de la Farmacoquímica se remontan a los inicios de la civilización humana, e incluso antes, cuando se descubrieron las propiedades medicinales de las plantas, así como de algunos minerales, sales y productos de origen animal. Los inicios de la Farmacología son tan antiguos como la humanidad misma.

### *Conceptos relevantes*

1. *Biodisponibilidad* - Porcentaje del fármaco que llega intacto a la circulación sistémica.

2. *Efecto de primer paso* - El metabolismo hepático que sufre un agente farmacológico antes de su llegada a la circulación sistémica.
3. *Farmacodinamia* - El estudio de las acciones y efectos de los fármacos.
4. *Farmacocinética* - El estudio de los procesos y factores que determinan la cantidad de fármaco.
5. *LADME* - Abreviatura mnemotécnica de liberación, absorción, distribución, metabolismo y excreción.
6. *Lugar diana* - Sistema, órgano o célula al cual el fármaco debe dirigirse para realizar su acción farmacológica.

## *Medicamentos*

### *Qué son*

Es toda preparación o producto farmacéutico que modifica los sistemas fisiológicos en beneficio de la persona a quien se le administra.

Los medicamentos se componen de *uno o más principios activos*, *uno o más excipientes*, y de una *forma galénica o farmacéutica*.

### *1. Principio activo*

Es el componente que hace la acción propia del medicamento y que alcanza el lugar diana. Puede tener origen humano, animal, químico o de otro tipo. Un mismo medicamento puede contener uno o más principios activos.

### *2. Excipiente*

Es toda aquella sustancia que se añade al medicamento a fin de facilitar su administración, servirles de vehículo, proteger su integridad, garantizar su **biodisponibilidad**, etc.

Los excipientes pueden ser de distinto tipo.

1. *Agentes de recubrimiento* - Regulan el sabor y protegen al medicamento de la humedad y el aire. Ayudan a controlar el momento de la liberación.
2. *Antioxidantes* - Evitan la oxidación de los principios activos, permitiendo que su actividad dure más tiempo.
3. *Aromatizantes* - Enmascaran las propiedades organolépticas de los medicamentos, mejorando su olor y sabor.
4. *Colorantes* - Añaden o cambian el color del medicamento, haciéndolo más atractivo, especialmente para los niños pequeños. Además, ayudan a crear una identidad de imagen asociada a una determinada marca o producto.

5. *Conservantes* - Inhiben el crecimiento de microorganismos en el medicamento, protegiéndolo y prolongando su vida útil. Algunos de ellos pueden producir efectos secundarios.
6. *Desintegradores* - Aceleran la disgregación del principio activo, facilitando su disolución y absorción.
7. *Estabilizantes* - Protegen al medicamento de la radiación solar, de la temperatura y de los fenómenos oxidativos.
8. *Saborizantes* - Modifican el sabor del medicamento, haciéndolos agradables o menos desagradables. Son especialmente frecuentes en medicamentos pediátricos.

### 3. *Forma galénica o farmacéutica.*

Es la disposición que adoptan los principios activos y sus excipientes para constituir un medicamento. Es la presentación del medicamento por el fabricante y la forma en que es administrada.

Las formas farmacéuticas pueden ser:

1. *Sólidas* - Comprimidos o tabletas, cápsulas, grageas, granulados, liofilizados, óvulos, píldoras, polvos y supositorios.
2. *Semisólidas* - Cremas, geles, pastas dérmicas, pomadas y ungüentos.
3. *Líquidas* - Gotas, elixires, emulsiones, enemas, inyecciones, jarabes, linimetos, lociones, soluciones, suspensiones y tinturas.
4. *Gaseosas* - Aerosoles, espumas, gases medicinales, inhaladores, nebulizadores.
5. *Dispositivos transdérmicos* - Implantes subdérmicos, filmes y parches adhesivos.

### *Tipos de medicamentos*

1. *Que no necesitan receta médica* - Los que no requieren de un diagnóstico preciso, y, por tanto, de prescripción médica.
2. *Que necesitan receta médica* - Los que requieren de un diagnóstico realizado por un profesional de la salud que, en ocasiones, es avalado por exámenes clínicos, por lo que requiere de prescripción médica.
3. *De uso hospitalario* - Los que necesitan ser prescritos y administrados bajo la responsabilidad de un hospital, ya sea por sus principios activos o indicaciones específicas.
4. *De especial control médico* - Los que se administran a pacientes ambulatorios y que pueden producir efectos adversos graves, por lo que su administración ha de realizarse bajo observación.
5. *Genéricos* - Los que demuestran su bioequivalencia con respecto a otros previamente autorizado y cuya patente ha expirado o ha sido

liberada.

### *LADME*

Se refiere al proceso que realiza el medicamento dentro del organismo, desde que es introducido hasta que es excretado. Se compone de las siguientes fases:

1. *Liberación* - Es la liberación del principio activo en el organismo.
2. *Absorción* - Es la absorción del principio activo a través de los distintos órganos del organismo, como en el intestino delgado.
3. *Distribución* - Es el viaje que realiza el PA en el torrente sanguíneo hasta el lugar diana, lugar al que ingresa por receptores especializados.
4. *Metabolismo* - Es la inactivación de los agentes residuales. Se lleva a cabo en el hígado.
5. *Excreción* - Es la expulsión de los agentes residuales del medicamento que hace el organismo. Esta expulsión puede realizarse mediante micción, sudoración, lagrimeo, heces, leche y epitelios descamados.

### *Efectos secundarios*

#### *Qué son*

Son los problemas que se presentan cuando un tratamiento afecta de forma indeseada a tejidos u órganos sanos. Todos los medicamentos tienen el potencial de causar efectos secundarios.

#### *Ejemplos*

Algunos ejemplos de efectos secundarios más comunes son:

- Alergia.
- Dolor de estómago.
- Erupciones cutáneas.
- Mareo.
- Urticaria.
- Vómito.

#### *Medidas de prevención*

- Administrar los medicamentos según las indicaciones de un profesional de la salud.
- Evitar compartir medicamentos.

### *Qué medicamentos no mezclar*

- Analgésicos, sedantes y pastillas para dormir.
- Antibióticos.
- Jarabes para la tos.
- Medicamentos para el tratamiento de coágulos.
- Medicamentos para la artritis.
- Medicamentos para la diabetes.

### *El dolor*

#### *Qué es*

Proviene del latín *doloris*, que es una conjugación del verbo *dolere*. Según la Asociación Internacional para el Estudio del Dolor (IASP, por sus siglas en inglés), el dolor es:

«Una experiencia sensorial y emocional aversiva típicamente causada por, o similar a la causada por, daño tisular real o potencial»<sup>1</sup>.

Por lo tanto, puede decirse que el dolor es *una sensación y una experiencia individual*.

La ciencia que estudia al dolor recibe el nombre de **Algología**.

<sup>1</sup> Stevens, B., Sullivan, M. D., Tutelman, P. R., Ushida, T., & Vader, K. (2020). The revised International Association for the Study of Pain definition of pain: concepts, challenges, and compromises. *Pain*, 161(9), 1976–1982. DOI. PubMed. PDF.

#### *Clasificación*

El dolor puede clasificarse de distintas formas según su criterio, a saber:

- Según el origen:
  - Somático.
  - Visceral.
- Según los mecanismos neurofisiológicos:
  - Nociceptivo.
  - Neuropático.
- Según su duración:
  - Agudo.
  - Crónico.
    - \* Oncológico.
    - \* No oncológico.
- Por su intensidad.
  - Leve.
  - Moderado.
  - Severo.

### *Componentes*

El dolor tiene distintos componentes, los cuales son:

1. Cognitivos.
2. Emocionales.
3. Fisiológicos.
4. Sociales.

### *Medicamentos y el dolor*

Con respecto al dolor, los medicamentos pueden clasificarse como:

1. AINEs.
2. Opiáceos menores.
3. Analgésicos opioides.
4. Fármacos adyuvantes.

#### *1. Antiinflamatorios no esteroideos (AINEs)*

Son un grupo variado y químicamente heterogéneo de fármacos, principalmente antiinflamatorios, analgésicos y antipiréticos, que reducen los síntomas de la inflamación, el dolor y la fiebre, respectivamente.

### *Diarrea*

Aumento de las heces por encima de 200 gr/día acompañada por el aumento del número de deposiciones y la disminución de consistencia.

Aumento de la frecuencia: más de 3 veces/día.

### *Pseudodiarrea*

Aumento del número de deposiciones sin aumento del peso de las heces.

### *Clasificación*

1. Clínica.
  - Aguda.
  - Crónica.
    - Fisiopatológica.
      - \* Osmótica.
      - \* Secretora.
      - \* Inflamatoria.
      - \* Trastornos de motilidad.
      - \* Ficticia.

2. Con lesión o sin lesión.

- Funcional.
- Orgánica.

3. Origen.

- Intestino delgado.
- Intestino grueso.

*La diarrea según su evolución.*

1. Aguda.

- Menos de 2 semanas.
- Más de 90% de los casos se deben a agentes infecciosos.
- Otras causas:
  - Fármacos.
  - Toxinas.
  - Reinicio alimenticio tras un periodo prolongado de ayuno.
- Transmisión:
  - Vía fecal-oral.
  - Persona a persona.
- Clínica:
  - Pacientes con diagnóstico de origen infeccioso.
  - Náuseas.
  - Vómito.
  - Dolor abdominal.
  - Fiebre.

2. Crónica.

- Más de 4 semanas.
- Continua o intermitente.
- Causas no infecciosas.

*La morfina*

- El alcaloide principal del opio.
- Es un analgésico opiáceo.
- Sustancia controlada.
- Opioide agonista.
- Usos:
  - Dolor intenso.
  - Tratamiento de dolor.
  - Disnea asociada a fracaso ventricular izquierdo agudo.
  - Ansiedad ligada a procedimientos quirúrgicos.

- Dosis:
  - Depende de la severidad del dolor.
  - Rango de 20-200 mg/día.
- Reacciones adversas:
  - Somnolencia.
  - Desorientación.
  - Euforia.
  - Cefalea.
  - Alucinaciones.
  - Náuseas.
  - Vómitos.
  - Estreñimiento.
  - Sequedad ocular.
  - Miosis.
  - Diplopia.

### *La aspirina*

- Alivia el dolor moderadamente fuerte.
- Es un AINE.
- Puede causar:
  - Cefalea.
  - Náuseas.
- Se comercializó en España en 1991 por Joseph Muchowski.
- Es un tratamiento a corto plazo.
- Se emplea para:
  - Dolor de cabeza.
  - Fiebre.
  - Cefalea.
- Reacciones adversas:
  - Urticaria.
  - Sarpullido.

### *El naproxeno*

- Es un fármaco sintético.
- Propiedades antiinflamatorias y antipiréticas.
- A la venta desde 1976 bajo receta.
- Prolonga el tiempo de protombina.
- Efectos secundarios:
  - Constipación.



- Diarrea.
- Gases.
- Sed excesiva.
- Cefalea.
- Somnolencia.
- Insomnio.
- Sapullido.
- Aumento de peso.
- Disfunción renal.
- En pacientes con disfunción renal, cirrosis.
- Debe evitarse durante el embarazo.
- El aluminio y el magnesio rechazan la absorción del naproxeno.

### *El dexketoprofeno*

- Es un AINE.
- Investigado y desarrollado por Menarini. Silanes en México.
- Usos:
  - Dolor de muscular y de espalda.
  - Cólicos.
  - Postoperatorios.
- Dosis:
  - 23 mg tres veces al día. Sólo adultos.
- Puede producir:
  - Náuseas.
  - Vómitos.
  - Cefalea.
  - Diarrea.

### *El ibuprofeno*

- Analgésico y antiinflamatorio.
- vía oral. Con comidas.
- No requiere receta médica.
- Presentaciones:
  - Cápsulas.
  - Comprimidos.
  - Suspensiones.
- Desarrollado por Antonio Rivera Blancafort en 1960.
- De venta libre.
- Usos:

- Bajar la fiebre.
- Alivio del dolores leves.
- Tratamiento para la artritis.
- Cólicos.
- Con receta:
  - Dolor.
  - Sensibilidad.
  - Inflamación.
- Efectos secundarios:
  - Estreñimiento.
  - Diarrea.
  - Mareo.
  - Sapullido.
  - Urticaria.
  - Cansancio.
  - Náuseas.

### *El ketorolaco*

- Es un AINE.
- Usos:
  - Dolor moderadamente fuerte.
  - Postoperatorio.
  - Tratamiento a corto plazo.
- Se comercializó en España a finales de 1991.

### *El fentanilo*

- Es un opioide sintético similar a la morfina.
- 100 veces más potente que la morfina.
- Se prescribe a pacientes con dolores intensos.
- Tratamiento del dolor crónico.
- Sintetizado por el dr. Paul Janssen.
- Se introdujo en 1963 en Europa.
- Disponible para su uso desde 1972.
- Efectos secundarios:
  - Euforia.
  - Aletargamiento.
  - Náuseas.
  - Confusión.
  - Estreñimiento.

- Sedación.
- Disnea.
- Pérdida del conocimiento.