

Administración de medicamentos por vía bucal



Tema 7

Índice de contenidos

- ❑ Anatomía y fisiología de la cavidad bucal:
 - ❑ Zonas de administración
 - ❑ Mucosas y secreciones
- ❑ Absorción
 - ❑ Mecanismos
 - ❑ Factores
- ❑ Formas farmacéuticas
 - ❑ Tópicas
 - ❑ Sistémicas:
 - ❑ Sublingual
 - ❑ Bucal
- ❑ Ventajas e inconvenientes de la vía bucal
- ❑ Métodos de estudio de la absorción bucal
 - ❑ In vitro
 - ❑ In vivo

Anatomía y fisiología

1. Zonas de administración

- a. Entre la mejilla y la encía (bucal)
- b. Debajo de la lengua (sublingual)
- c. Entre la lengua y el paladar

2. Mucosa

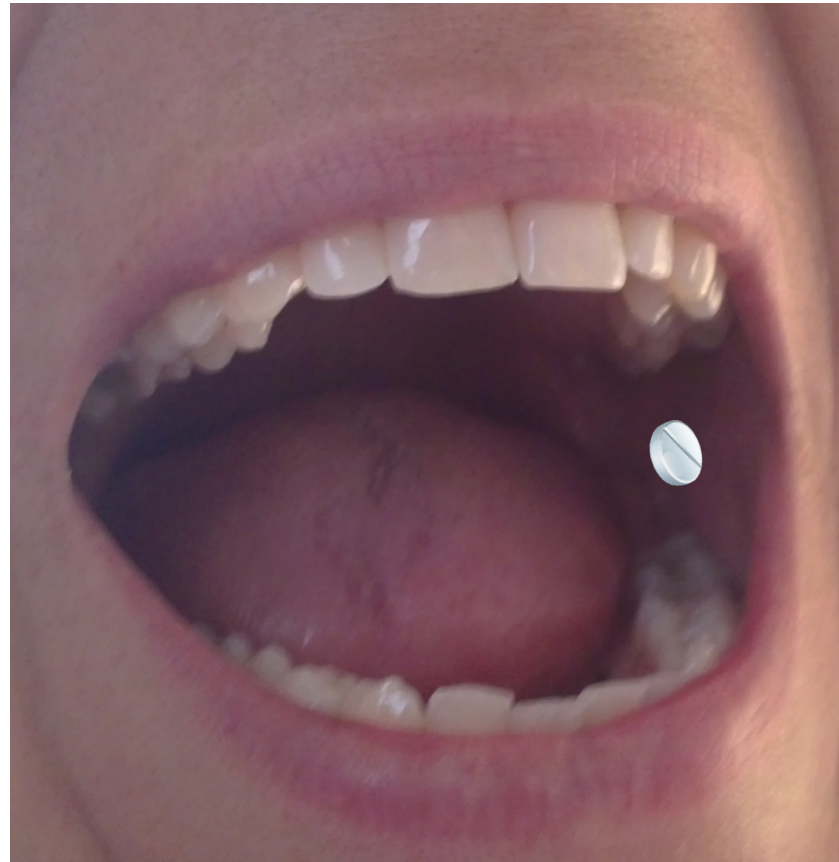
- a. Mucosa (epitelio):
 - Poliestratificado
 - Zonas queratinizadas
- b. Membrana basal
- c. Lámina propia
- d. Submucosa:
 - Arterias
 - Venas (ranina)

3. Secreciones

- a. Saliva (pH 6,7-7)
- b. Mucina

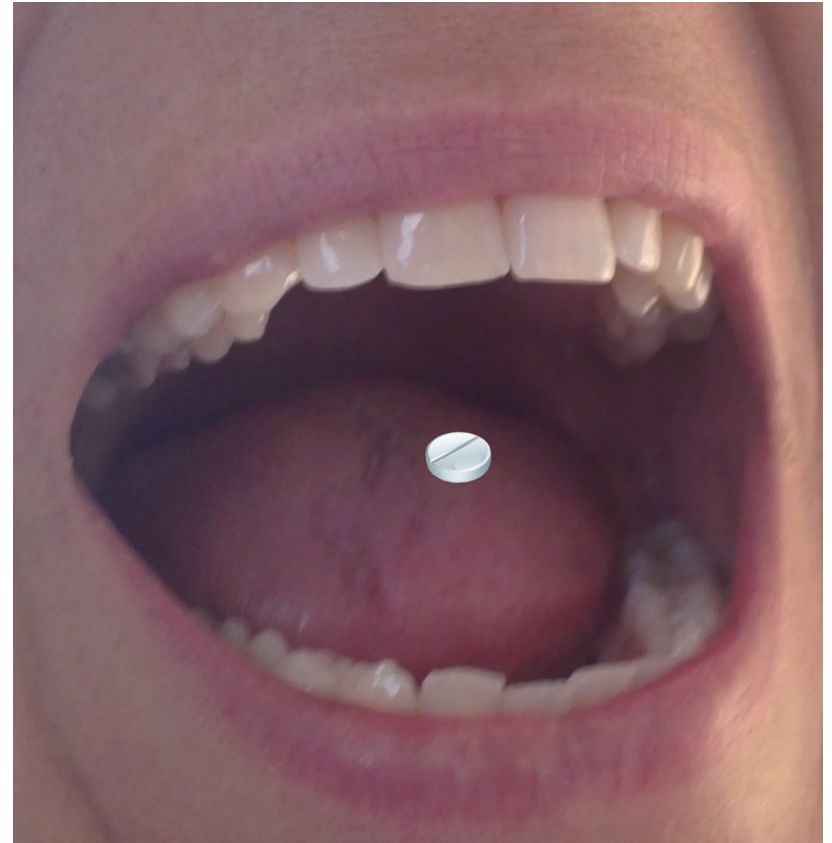
Anatomía y fisiología

Administración bucal



Anatomía y fisiología

Administración sobre la lengua



Anatomía y fisiología

Administración sublingual



Anatomía y fisiología

1. Zonas de administración

- a. Entre la mejilla y la encía (bucal)
- b. Debajo de la lengua (sublingual)
- c. Entre la lengua y el paladar

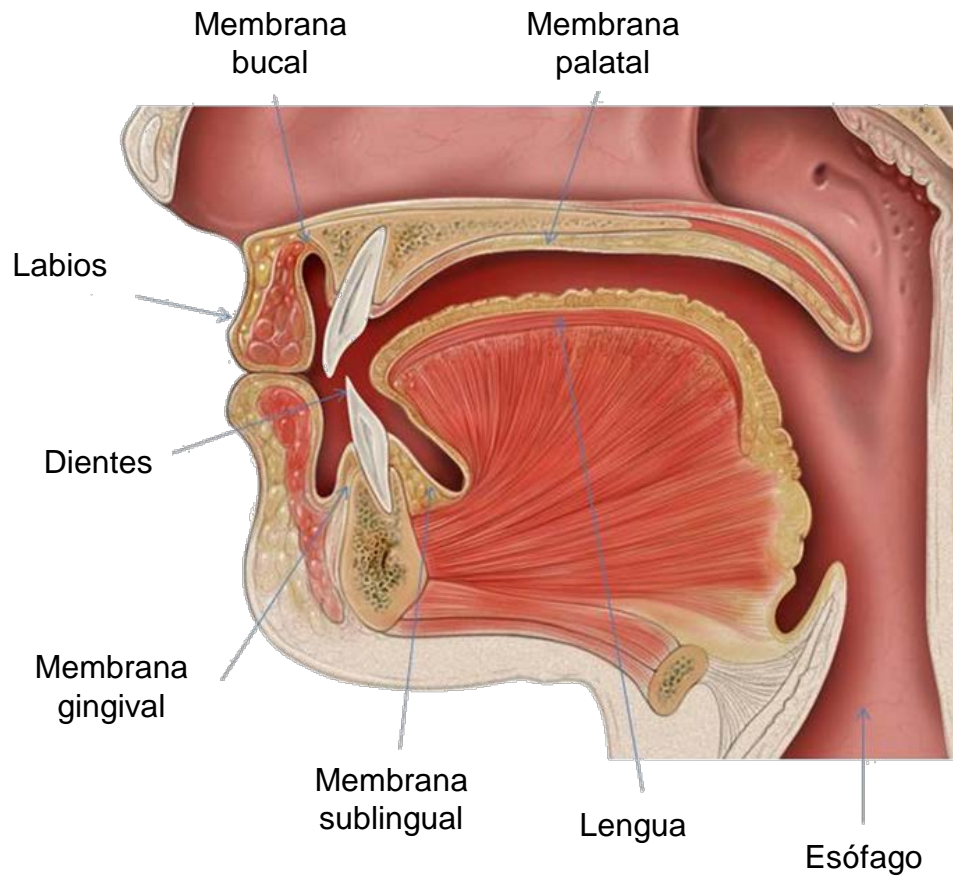
2. Mucosa

- a. Mucosa (epitelio):
 - Poliestratificado
 - Zonas queratinizadas
- b. Membrana basal
- c. Lámina propia
- d. Submucosa:
 - Arterias
 - Venas (ranina)

3. Secreciones

- a. Saliva (pH 6,7-7)
- b. Mucina

Anatomía y fisiología

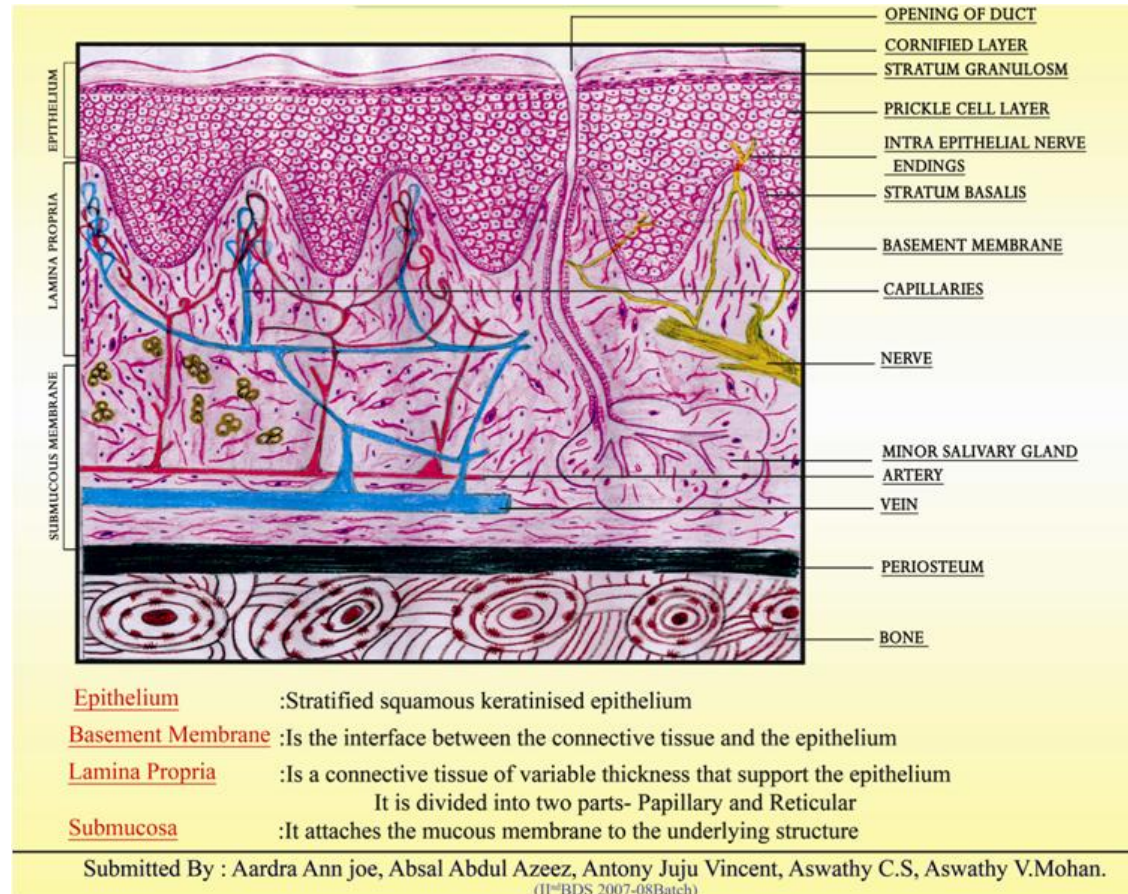


Esquema de la cavidad bucal

Adaptado de Patrick J. Lynch, C. Carl Jaffe. Publicada en Wikimedia Commons con licencia creative Commons Attribution 2.5 License 2006

http://commons.wikimedia.org/wiki/File:Head_lateral_mouth_anatomy.jpg#file

Anatomía y fisiología



Sección transversal de la mucosa oral

Adaptado de Aardra Ann joe, Absal Abdul Azeez. Antony Juju Vincent, Aswathy CS, Aswathy V Mohan. Publicada en wikimedia con licencia creative Commons Attribution CC-BY-SA-3.0
http://commons.wikimedia.org/wiki/File:Oral_mucosa.jpg

Absorción

1. Mecanismos:

1. Difusión pasiva (el más importante, ej. fentanilo)
2. Difusión facilitada
3. Transporte paracelular (ej. morfina)

2. Factores que afectan a la absorción:

1. **Propiedades físico-químicas:**

- Solubilidad
- Peso molecular
- pKa

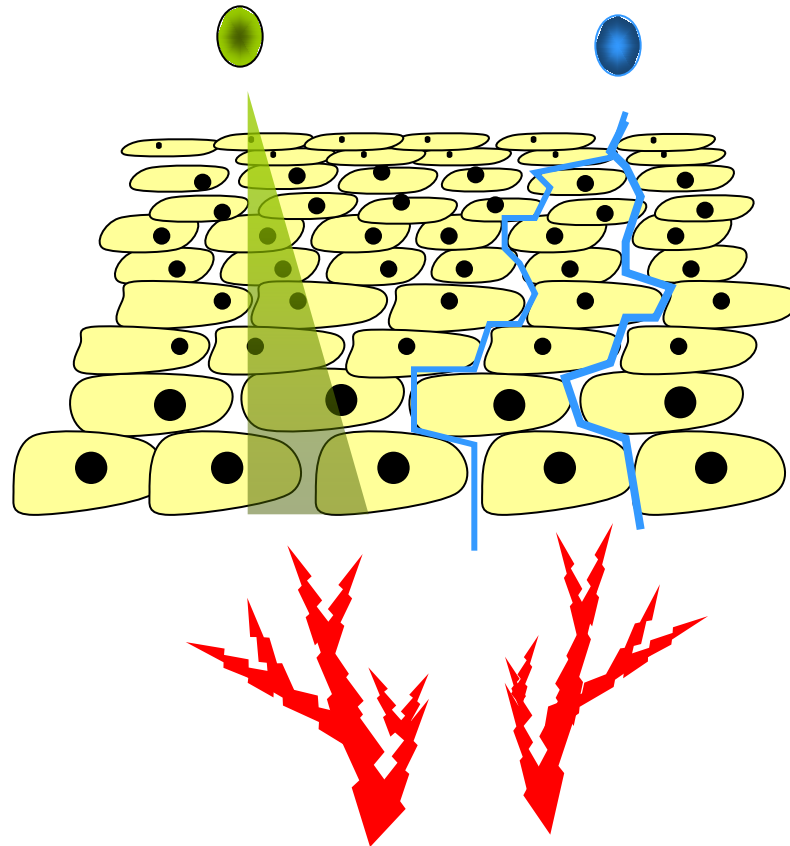
2. **Permeabilidad de la mucosa:**

- Bidireccional
- Depósito
- Zona

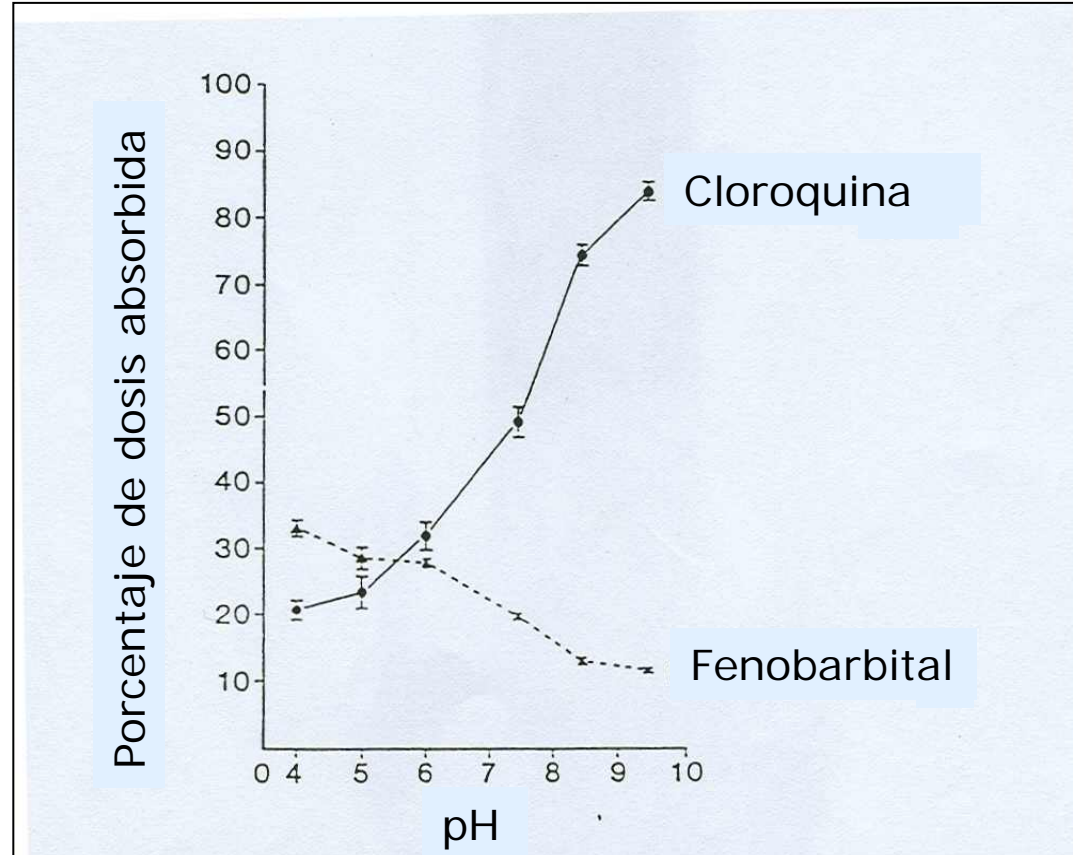
Absorción

fármaco lipófilo
(fentanilo)

fármaco hidrófilo y de
bajo peso molecular
(morfina)



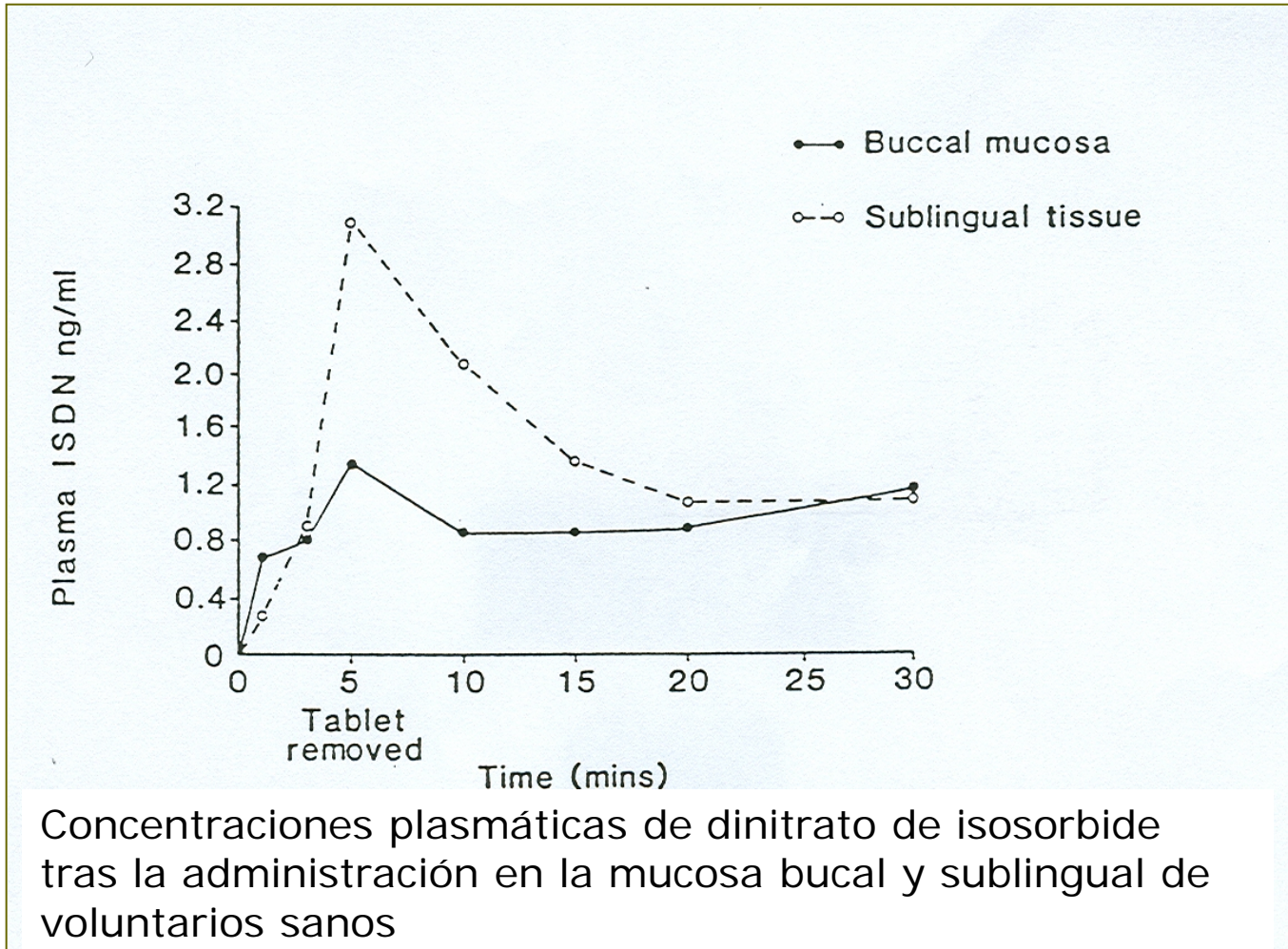
Administración bucal



Efecto del pH sobre la absorción de fármaco ácido (fenobarbital) y de un fármaco básico (cloroquina) en la cavidad bucal de voluntarios sanos.

McElnay, JC Sidahmed AM, D'Arcy PF. In J Pharm 1986;31: 107-111

Administración bucal



Formas farmacéuticas de administración bucal

1. TÓPICAS:

- Las más utilizadas
- Afecciones buco-faríngeas

2. SISTÉMICAS:

- Sublingual (inmediata)
- Bucal (alternativa a la vía oral)

Formas farmacéuticas de administración bucal

1. SOLUCIONES-SUSPENSIONES (L)
 1. Soluciones para gargarismos
 2. Soluciones para enjuague bucal
 3. Soluciones gingivales
 4. Soluciones y suspensiones bucales (aplicador)
2. SEMISÓLIDAS (L)
 1. Geles gingivales o bucales
 2. Pastas gingivales o bucales
3. GOTAS BUCALES, AEROSOLES BUCALES EN SOLUCIÓN Y AEROSOLES SUBLINGUALES (L+S)
4. SÓLIDAS
 1. Pastillas para chupar y blandas (L)
 2. Comprimidos para chupar (L+S)
 3. Comprimidos sublinguales y comprimidos bucales (S)
 4. Cápsulas bucales (S)
 5. Preparaciones mucoadhesivas (S)
 6. Gomas de mascar (L+S)

Formas farmacéuticas sistémicas

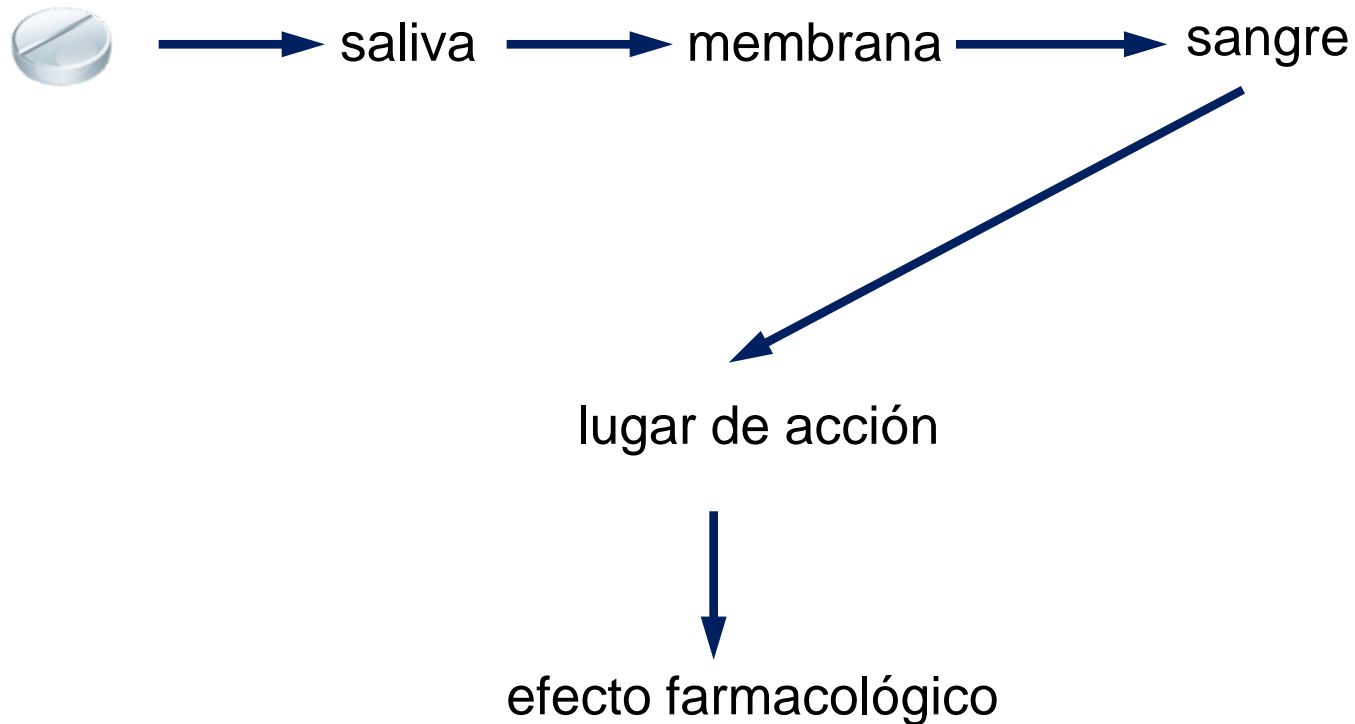
1. VIA SUBLINGUAL:

- Rápida absorción
- Comprimidos de rápida disolución (<130 mg)
- Ejemplos:
 1. Vasodilatadores coronarios (vía de elección)
 2. Chicles de nicotina

2. VIA BUCAL:

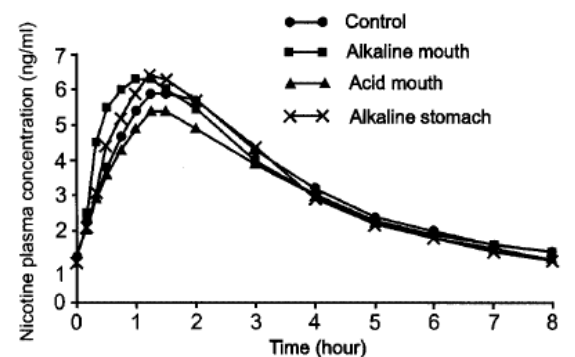
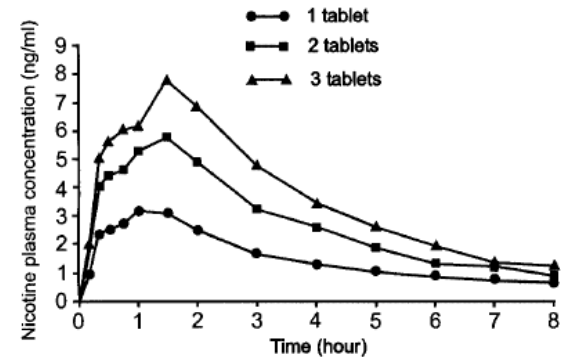
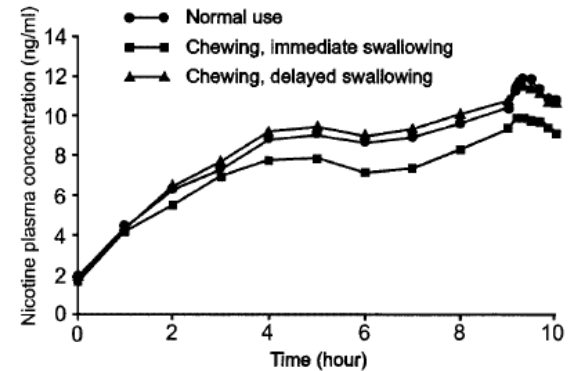
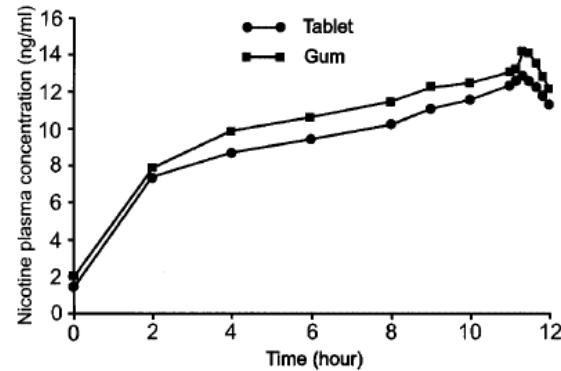
- Lenta absorción (deben permanecer durante más tiempo)
- Formas farmacéuticas más complejas
- En fase de desarrollo para péptidos y proteínas

Formas farmacéuticas de administración bucal



Formas farmacéuticas sistémicas

Fig. 1 Nicotine plasma concentrations following: multiple-dose administration (once hourly) of the sublingual tablet and the gum (*top left*); single-dose administration of one, two and three sublingual tablets (*bottom left*); multiple-dose administration (once hourly) during correct use (sublingual) and incorrect (chewing and either immediate or delayed swallowing) use of the sublingual tablet (*top right*); and single-dose administration of two sublingual tablets during acidic mouth, alkaline mouth and alkaline stomach conditions (*bottom right*)



Administración bucal

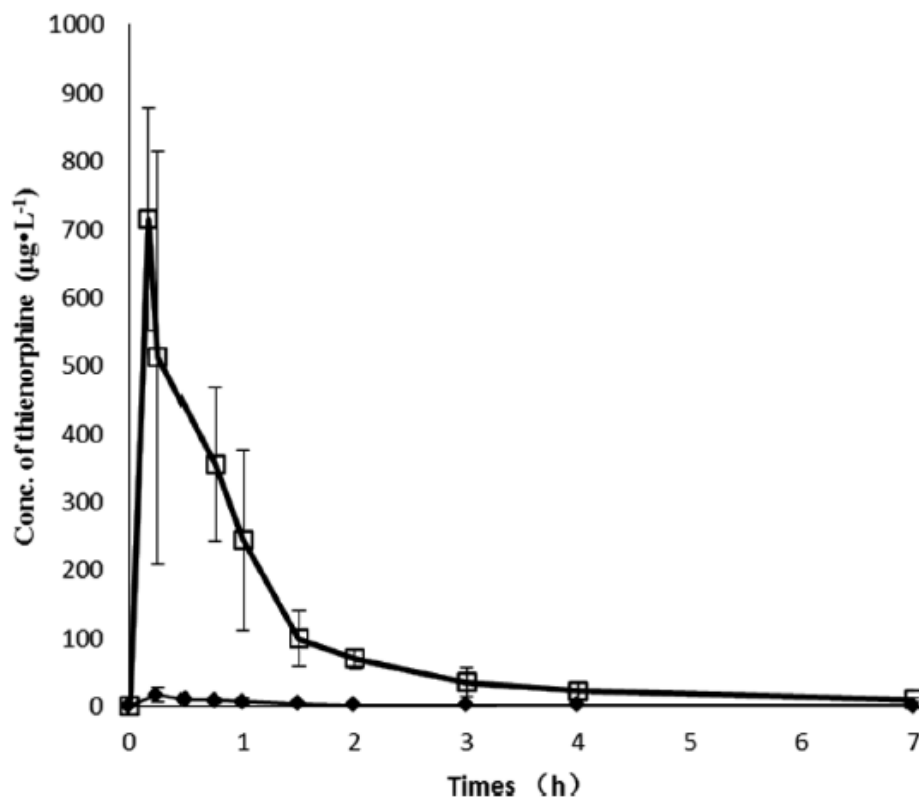
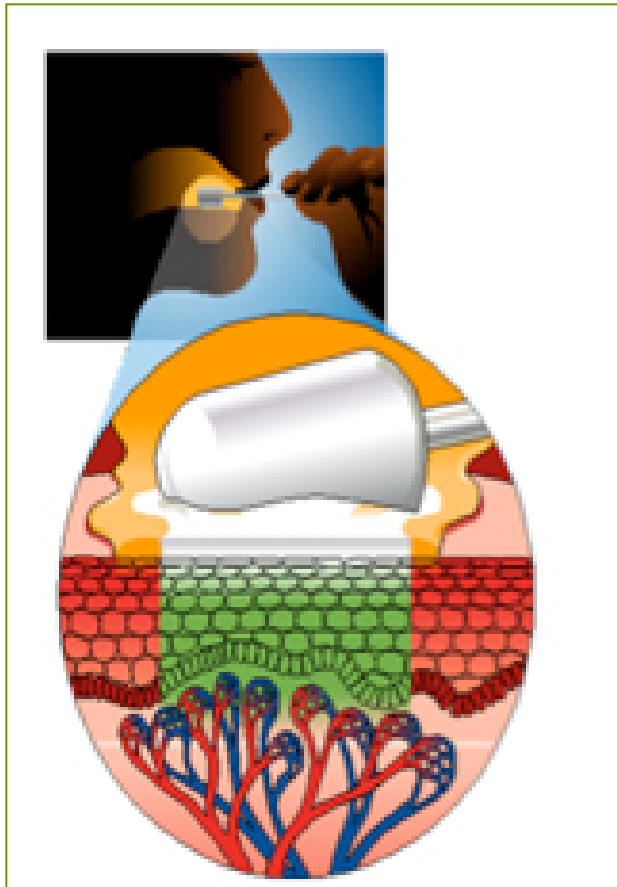


Fig. 10. Mean Plasma Concentration–Time Profile of Thienorphine after GI (◆) or Sublingual (□) Administration of ThH-DM- β -CD Complex Solution

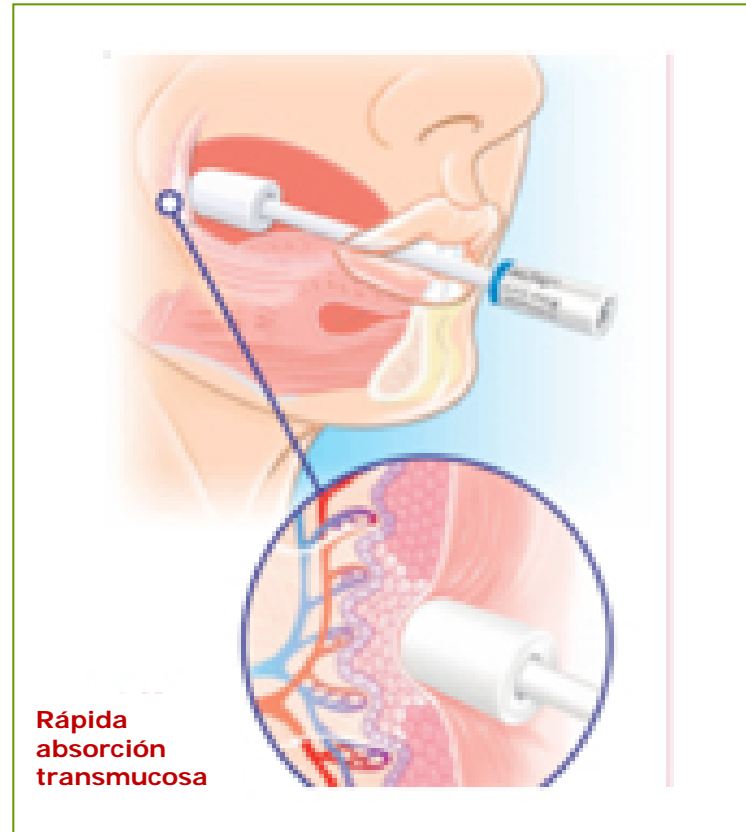
$3\text{mg}\cdot\text{kg}^{-1}$, $n=6$, mean \pm S.D.

Administración bucal



Formulación bucal de fentanilo

Administración bucal



Administración sistémica

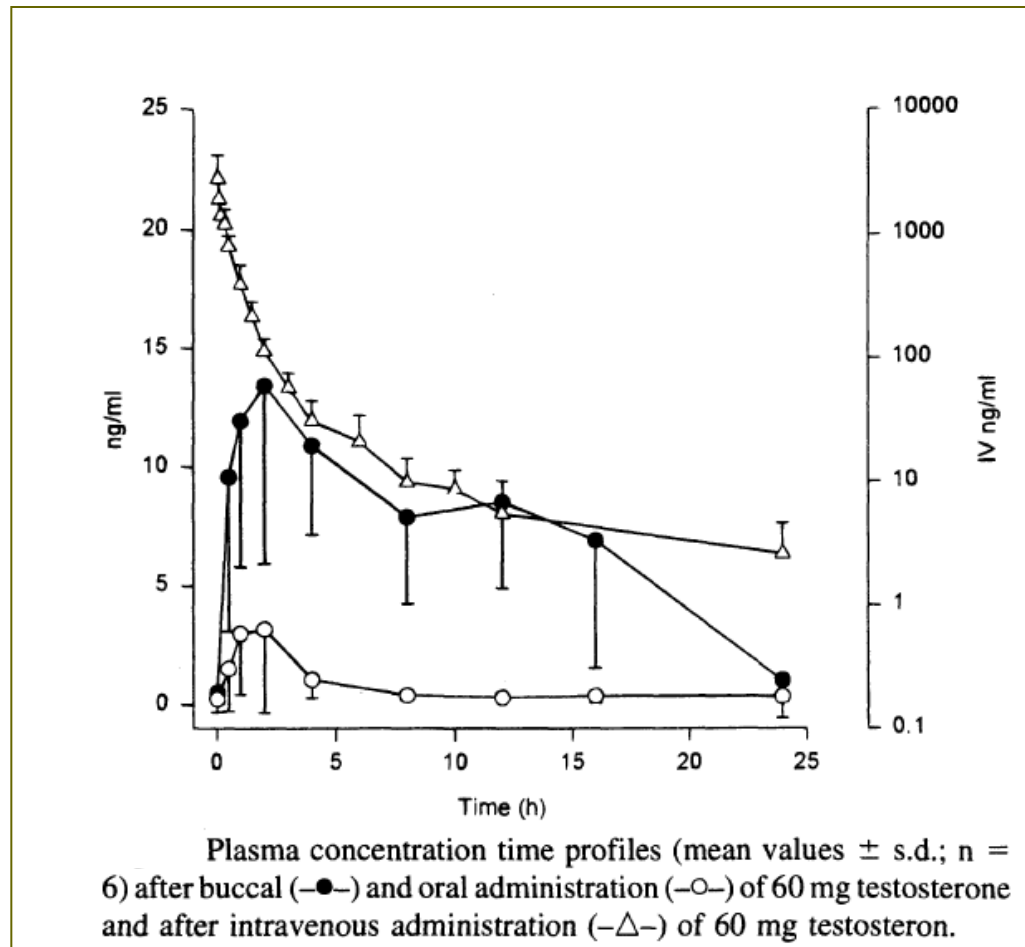
VENTAJAS

- Absorción importante
- Evita el efecto de primer paso hepático
- Evita la degradación gástrica e intestinal
- Doble acción
- Interrupción del tratamiento, si signos tóxicos

INCONVENIENTES

- Variabilidad
- Limitación de la dosis y del principio activo

Administración sistémica



Administración bucal

FÁRMACO	VÍA DE ADMINISTRACIÓN
Buprenorfina	sublingual
Fenazocina	sublingual
Nitroglicerina	
liberación rápida	sublingual
liberación sostenida	bucal
Nifedipina	sublingual

Fármacos que se utilizan por vía bucal o sublingual

Métodos de estudio de la absorción bucal

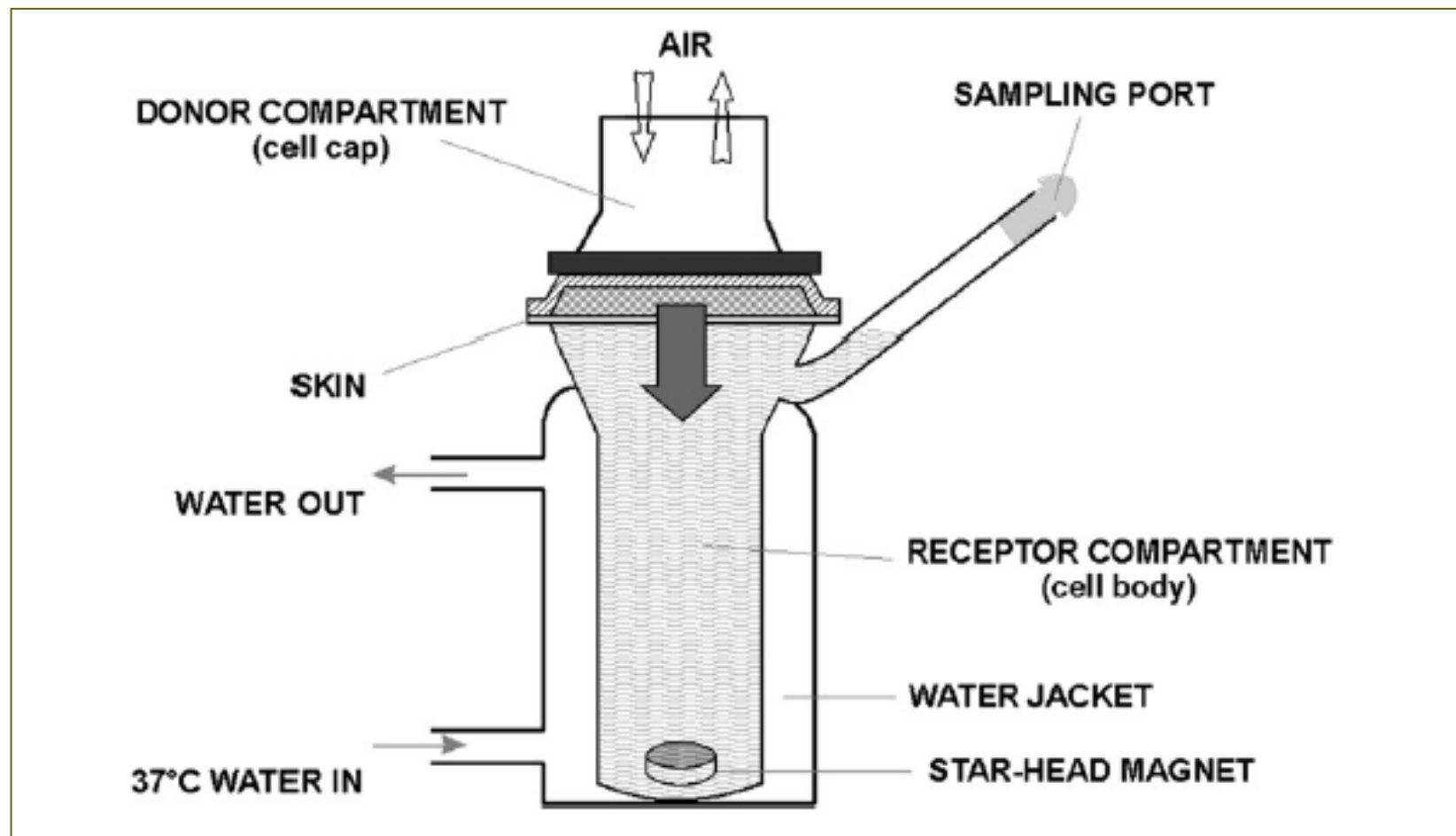
1. **IN VITRO**

1. Celdas de difusión
2. Cultivos celulares

2. **IN VIVO**

1. Sistema de circulación (parámetros físico-químicos)
2. Métodos de deposición (parámetros físico-químicos, formulaciones)

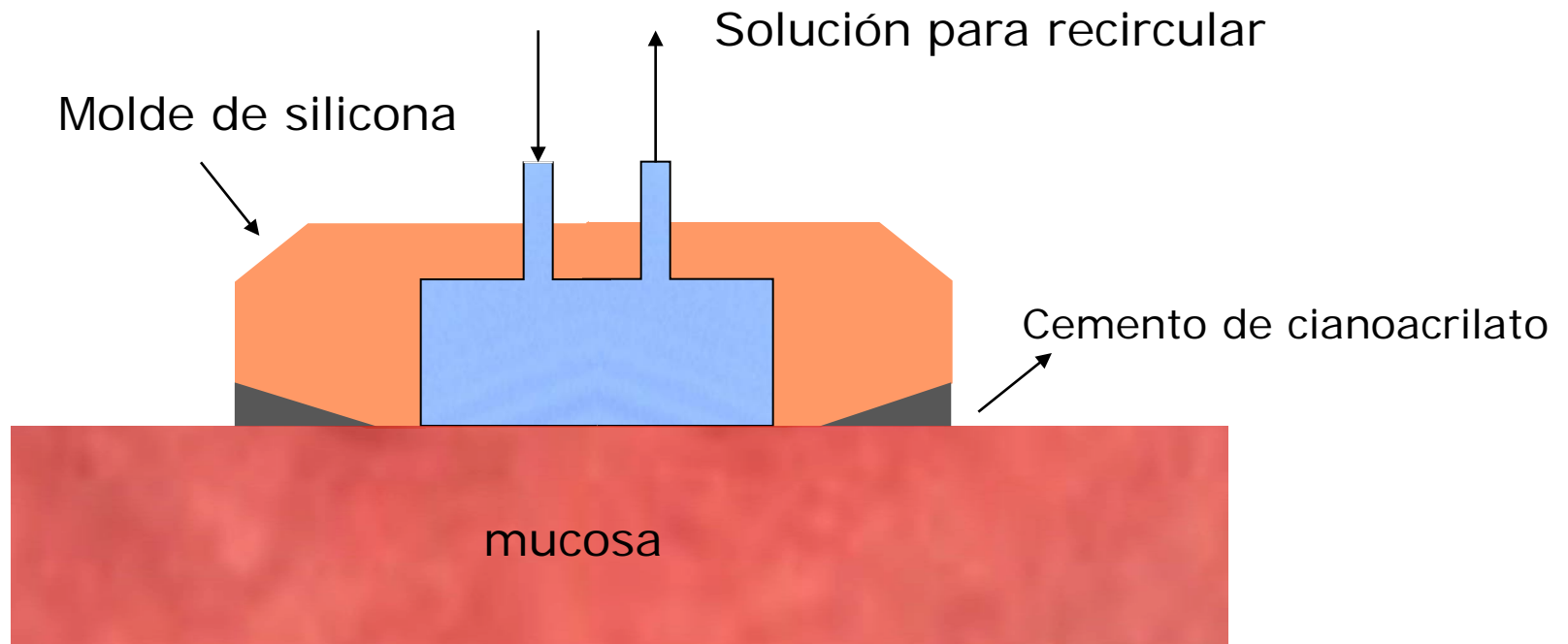
Métodos de estudio de la absorción bucal



Celda de difusión tipo Franz

Métodos de estudio de la absorción bucal

Sistema de recirculación



Métodos de estudio de la absorción bucal

Sistema de deposición

