

02. Ikasgaia

Farmakoen xurgapena eta banaketa

Farmakologia Fisioterapian

OpenCourseWare

UPV/EHU OCW-2018

OCW
OpenCourseWare

Iván Manuel
María Torrecilla Sesma
Farmakologia Saila UPV/EHU



Edukiaren laburpena

1.- Farmakoen xurgapena

1.1.-Xurgapenaren eta bioerabilgarritasunaren kontzeptuak

1.2.-Farmakoen xurgapen-mekanismoak

1.3.-Farmakoen xurgapena baldintzatzen duten faktore orokorrak (A-D)

1.4.-Farmakoen administrazio-bidea: administrazio topikoaren garrantzia fisioterapian

2.- Farmakoen banaketa

2.1.- Banaketaren kontzeptua

2.2.- Gorputzeko gune funtzionalak (urtsuak)

2.3.- Banaketa bolumenaren ageria: esangura biologikoa

2.4.- Farmakoen banaketa baldintzatzen duten faktore orokorrak

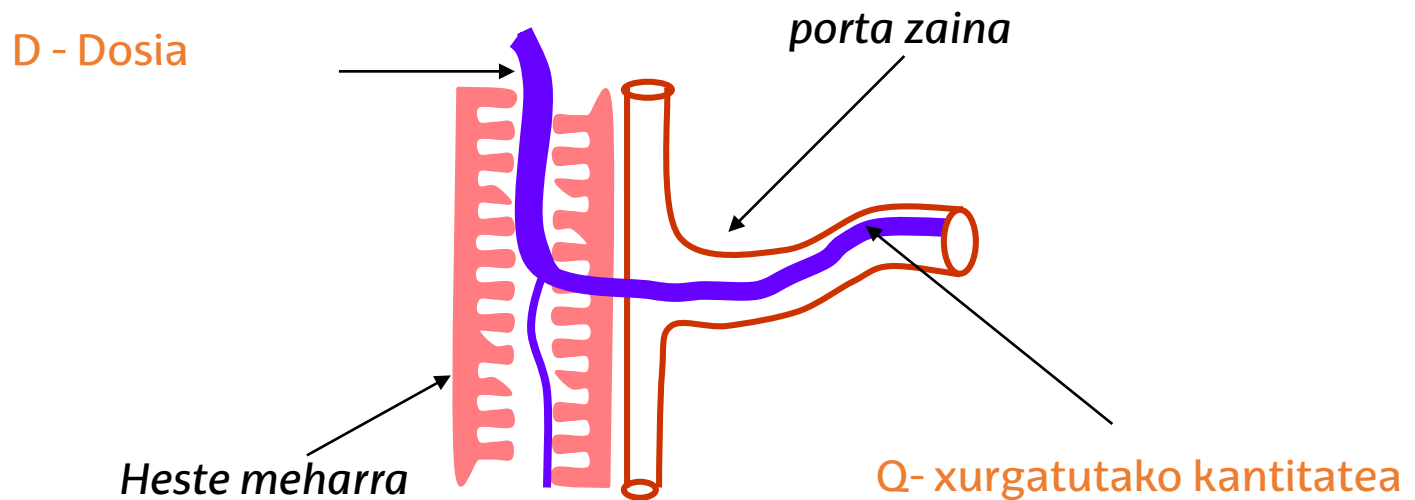
2.5.- Gorputzeko gune bereziak

PRAKTIKA: Jarduera fisikoak baldintza dezake farmakoen xurgapena edota banaketa?
(I atala- 3. ariketa)

1.- FARMAKOEN XURGAPENA

1.1.-Xurgapenaren eta bioerabilgarritasunaren kontzeptuak

Xurgapena: Farmakoaren igarotze prozesua administrazio gunetik zirkulazio sistemikora



Xurgapena baldintzatzen duten faktoreak:

- azalera
- odol fluxua (odol-hodi aberastasuna)
- mintzak zeharkatzeko gaitasuna (F-K)

1.1.-Xurgapenaren eta bioerabilgarritasunaren kontzeptuak

BIOERABILGARRITASUNA - f

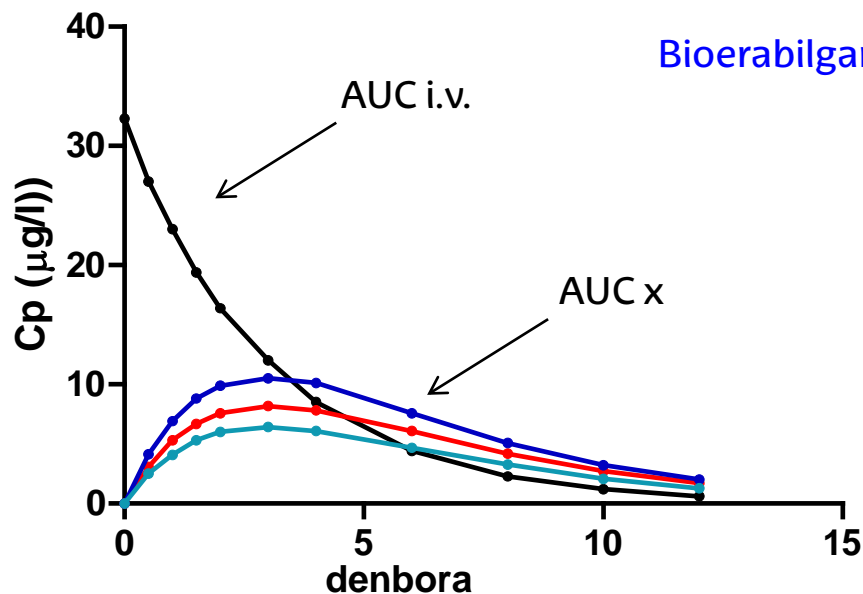
$$f = Q / D$$

f - Zirkulazio sistemikora aldatu barik heltzen den dosiaren ZATIA

Q - Z. sistemikora aldatu barik heltzen den dosiaren KANTITATEA

D - dosia

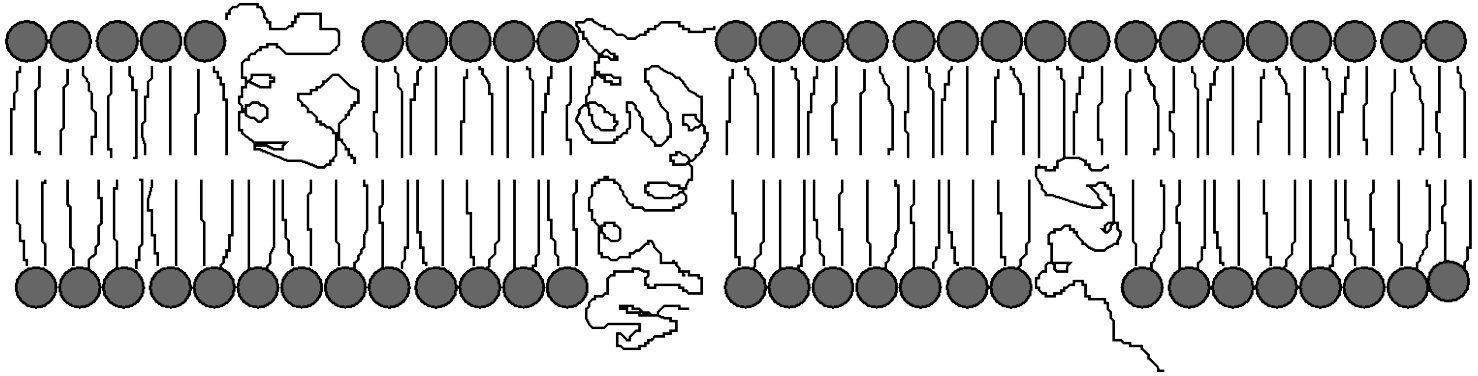
Plasma-konzentrazio (C_p) kurbekin (AUC) kalkulatu da bioerabilgarritasuna



$$\text{Bioerabilgarritasuna (f)} = \frac{\text{AUC}_x}{\text{AUC}_{i.v.}}$$

AUC- area under the curve
kurbaren azpiko area

1.2.- Farmakoen xurgapen-mekanismoa

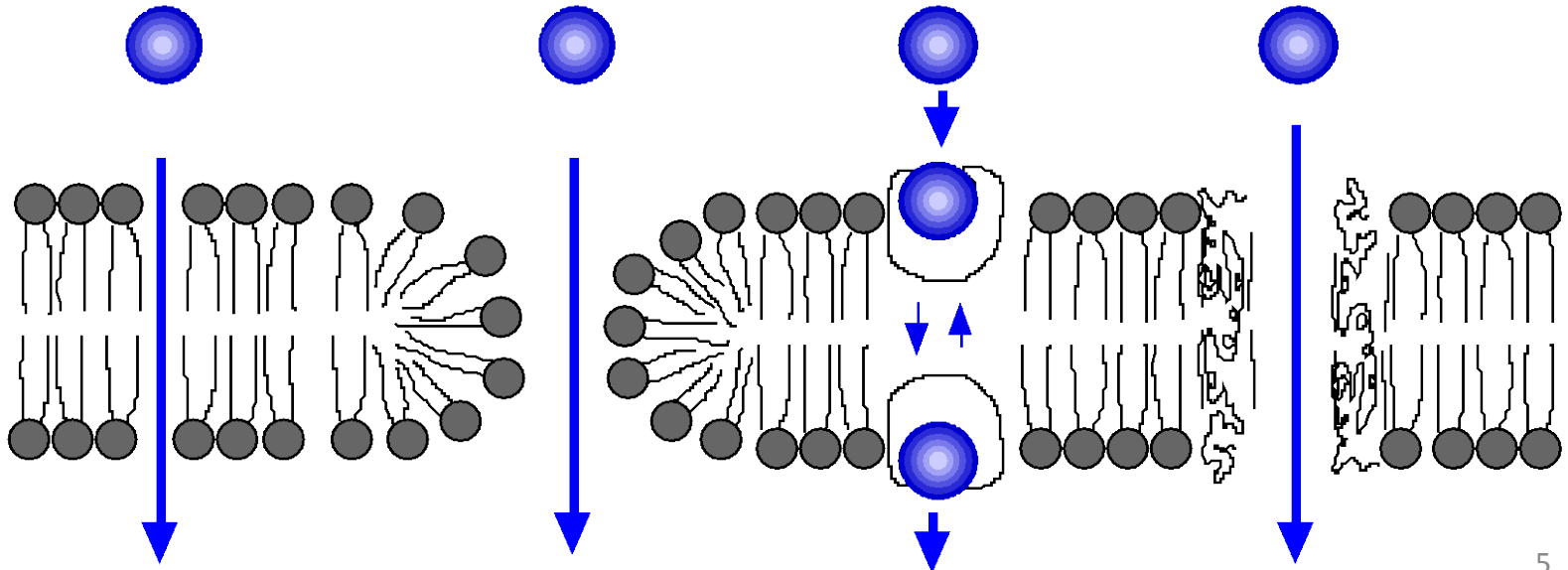


Difusio pasiboa
Lipidoen zehar
(farmako
lipodisolagarriak)

Iragazketa

Proteinak
garraiatzaileak
(aktibo edo inaktibo)

Difusio pasiboa
Ur-erreten zehar
(farmako
hidrosolagarriak)



1.3.- Farmakoen xurgapena baldintzatzten duten faktore orokorrak

1. FARMAKOEN EZAUGARRI FISIKO-KIMIKOAK
2. PRESTAKIZUN FARMAZEUTIKOAREN EZAUGARRIAK
3. XURGAPEN-GUNEAREN EZAUGARRIAK
4. ELIMINAZIO AURRESISTEMIKOA

1.3.- Farmakoen xurgapena baldintzatzten duten faktore orokorrak

FARMAKOEN EZAUGARRI FISIKO-KIMIKOAK

Faktore hauen arabera, xurgapena gertatuko da difusio pasiboz, iragazpenaz edo garraio aktiboz.

- ✓ TAMAINA (PM)
- ✓ DISOZIAZIO-GRADUA (pKa) – ez ionizatutako molekulak xurgatzen dira
- ✓ LIPODISOLBAGARRITASUNA

B). PRESTAKIZUN FARMAZEUTIKOAREN EZAUGARRIAK

Farmakoa xurgagarria izateko **disolbaturik** egon behar da

- ✓ PRESTAKIZUN-MOTA:
(hautsa, soluzioa, konprimatuak, ...)
- ✓ PARTIKULEN TAMAINA
- ✓ ESZIPIENTE ETA GEHIGARRIAK

D). XURGAPEN-GUNEAREN EZAUGARRIAK

Administrazio bidearen arabera

Heste-xurgapena

Patologikoak:

Mukosetako kaltea

Gaixotasunak: xurgapen okerra

Farmakoak: opiazeoak...

Fisiologikoak:

Urdaileko hustea

Heste mugikortasuna

Heste jariaketa (pH aldaketa)

Bakterio flora

Topikoa: fisioterapian erabiltzen diren teknikak

- masoterapia = xurgapen ↑ azalaren bitarteko prestakizunal



ZIO AURRESISTEMIKOA

Batzutan, farmakoa eliminatzen da zirkulazio sistemikora heldu baino lehen.

- ✓ URDAILEAN EDO HESTEAN (aho-bidea): farmakoa \rightarrow jarduera biologikorik gabe
 - pH
 - DIGESTIO-ENTZIMAK
 - FLORA BAKTERIANOAK
 - KELANTEAK...

- ✓ "1. IGAROTZE" GERTAKIZUNA
Metabolismo aurre-sistemikoa da, batez ere gibelean
Zirkulazio orokorrera heldu baino lehen farmakoa metabolizatzen da
farmakoa \rightarrow jarduera biologikorik gabe

Honek *Bioerabilgarritasuna* (f) baldintzatzen du

1.4.-Farmakoen administrazio-bidea: administrazio topikoaren

garrantzia fisioterapian

- ✓ AHO-BIDEA
- ✓ MIHIAZPIKO BIDEA
- ✓ ONDESTEKO BIDEA

ENTERALA
digestio mukosa

✓ PARENTERALAK

- BENABARNEKOA
- MUSKULUBARNEKOA
- AZALPEKOA
- GILTZADURABARNEKOA

✓ **MUKOSETAN**: Azala, sudur-mukosa, bagina, konjuntiban,...IONTOFORESIS

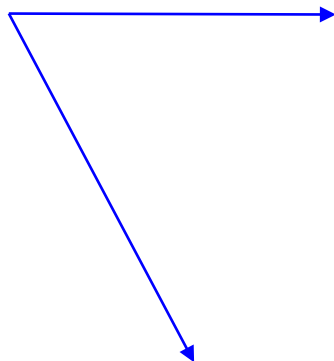
✓ **INHALATORIOA**

Administrazio enterala

Digestio mukosaren bidezko xurgapena

- **Ahozko bidea**

- Mihi-azpiko bidea
- On hesteko bidea



Abantailak:

Erosoa

Segurua

Merkea

Desabantailak:

Mukosaren narritadura

Usain eta zapore txarra

Xurgapen-arazoak (1. igarotze, fkoak)

Farmakoen galerak (entzimak, pH)

Pazientearen kolaborazioa (tratameduaren betetzea)

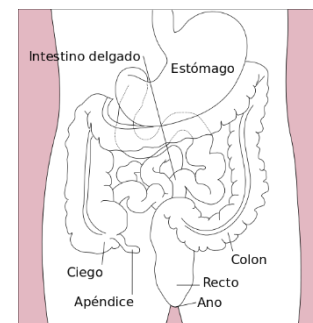
Toxikapen arriskua (umeak, suizidak,..)

Mihi-azpiko bidea

- Azpimihiko baskularizazio handiari esker →
→ goiko kaba zaina → eskuineko aurikula → eragin azkarra
- Gibel- edo urdail/hesteke inaktibazioa ekiditen da → eragin indartsua
- Abantaila krisi akutuetan:
 - nitroglizerina bular-anginan
 - nifedipino krisi hipertentsiboetan

Ondesteko bidea

- Noiz? Aho-bidea ezin denean:
 - Gorako/goitikak
 - Konorterik eza
 - Urdaileko narritadura
 - Urdaileko inaktibazioa (pH, entzimak,...)
 - Gibekeko inaktibazioa txikitxeko
 - Usain/zapore txarra
- Arazoak:
 - Deserosoa
 - Xurgapen aldakorra eta askotan ez osoa



Administrazio parenterala

Zain barneko bidea



Abantailak	Desabantailak
Biderik azkarrena Larrialdietan Konortetik eza Perfusioak Bolumen handia Cp oso zehatzak	Asepsia Mina Automedikazio zaila Erreakzio larrien arriskua (anafilaxia)

Muskulu barneko bidea (i.m.)

Abantailak	Desabantailak
Xurgapen azkarra Farmako narritagarriak Paziente "zailak" Bolumen handiak (<5ml)	Xiringapen-puntua aldatu behar da (fibrosi lokala) Nerbio ziatiko arriskua

* **"DEPOT"** prestakizunak
xurgapen geldoa → Cp iraunkorragoak
Ab: hormonak, penicilina, antipsikotikoak

Azalazpiko bidea (s.c)

- Xurgapen-abiadura ertaina (< i.m.)
- Xurgapen-abiadura moldagarria
(↓) basouzkurduraz: hotza, farmakoak
(↑) basozabalkuntzaz: beroa, masajea, basozabaltzaileak, entzimak (hialuronidasa)
- Eragin egonkorra
- Bolumen txikiak

Artikulazio barneko bidea

- Konzentrazio handiak saku sinobialean
- Eragin **lokala**
- Analgesikoak, antiinflamatorioak, antibiotikoak
- Espezializazio behekoa (medikua)
- Erabilera mugatua (infiltrazio kupurua)

Azal eta beste mukosen bidezko xurgapena: Bide Topikoa (eragin lokala)

INHALATORIOA (Birikietan)

Farmako hegazkorrak eta gaseosoak
Eragin lokala: asma

TRANSDERMIKOA kremak, txaplatak

Abantailak:

1. Igarotze gertakisuna ekidin

Azkapen abiadura egonkorra

Aldaketa plasmatico gutxi

kronikoa edo akutua

Toxikotasun egoeratan irazketa azkarra



Desventajas:

Farmako lipofilikoak

Toxikoak (organofosforados)

Garesti samarrak

Bide topikoa: garrantzitsua fisioterapian



Iontoforesis

Azalaren bitarteko administrazioa korrente elektrikoaren bidez.

Boltai txikiko korronteak

Molekula kargadunek gradiente aldeko mugimendua

Izer-bide eta ile-folikuluaren bidez

Sakona (cm)

Abantailak:

Ez da inbasiboa

Eragin lokala eta xurgapen sistemiko gutxi

Farmako kargadunen administrazioa azalaren bidez

Desabantailak:

Farmakoak ionizatzeko beharra

Dosifikazioa ez da sehatza

Eritema arriskua

Hipersentikortasuna

Farmakoak: Anti Inflamatorio Ez Esteorideoak, dexametasona,
lidokaina/adrenalina

Bide topikoa: garrantzitsua fisioterapian



Fonoforesis (US)

Ultrasoinuak (20kHz)

Gelak- soluzio bezaka

Sakontasuna mugatua = lotailuak eta tendoiak

Erabilera bakarra: tenperatura igo, mekaniko estimulazioa =

↑ elastikoatsuna eta ↓ zurruntasun artikularra

Farmakoekin erabilia: ↑ aurreko eraginak

Farmakoak: kortikoideak, lidokaina, salizilatoak

Bide topikoa: garrantzitsua fisioterapian

Masoterapia

- Farmakoen xurgapena alda dezake
- Kontuz - antikoagulatzaileak → hematoma
- NSZ fkoak txaplatak → toxikapena
- Errezeta gabeko farmako asko, masoterapiaren bidez
- **Farmakoak:** AIEE, DMSO, heparina



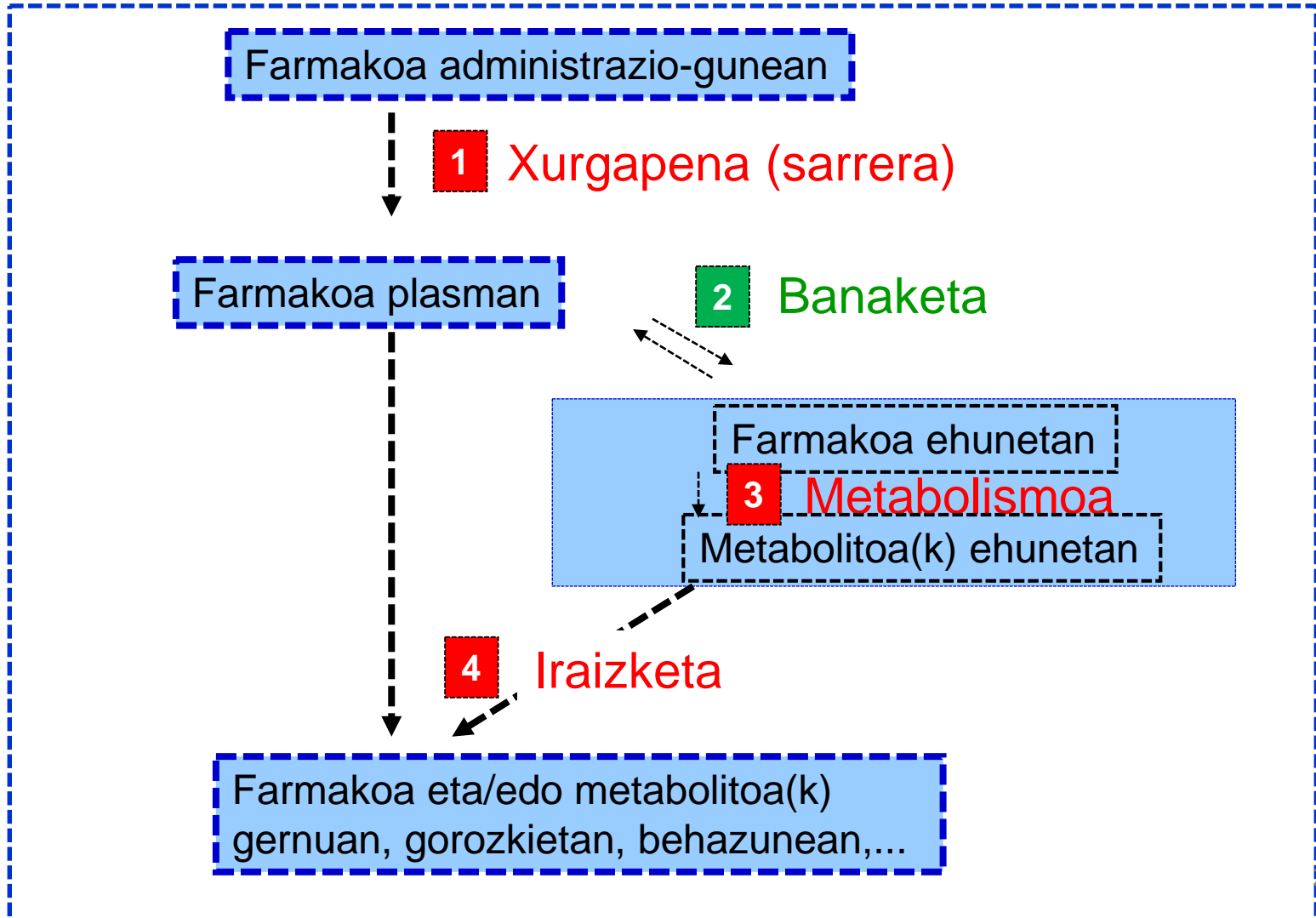
2.- FARMAKOEN BANAKETA

2.1.- Banaketaren kontzeptua

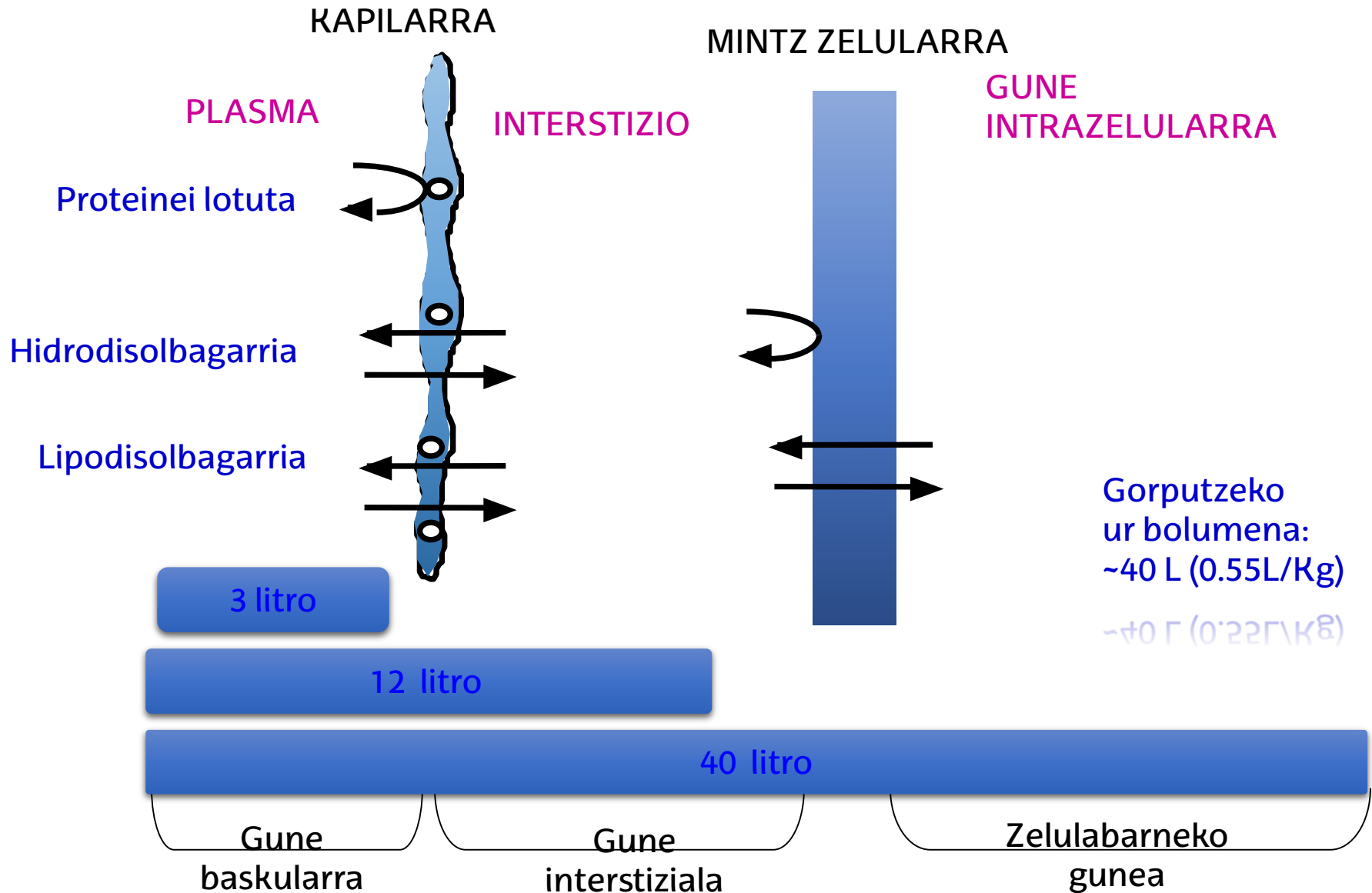
Farmakoen sarrera baimentzen du organo eta ehunetara

Konzentrazioak zehazten ditu ehunetan

Farmako librea da banatzen dena



2.2.- Gorputzeko gune funtzionalak



2.3.- Banaketa bolumenaren ageria: esangura biologikoa

Zer bolumetan disolbatu beharko da emandako dosia, kontzentrazio plasmatico zehatza lor dadin.

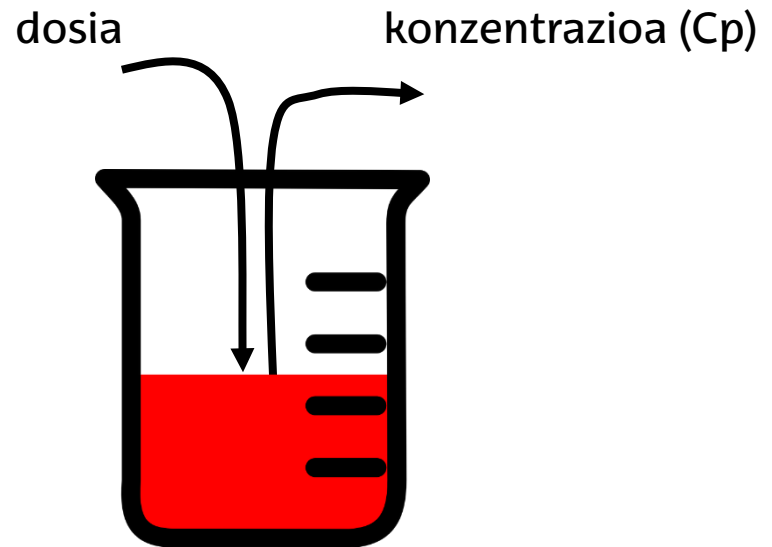
“Farmako banaketaren adierazlea”

▪ **Nola kalkulatzen da?** Zatiketa eginez dosia (Q) /hasierako Kontzentrazioa (C_p)
Benabarneko adm.

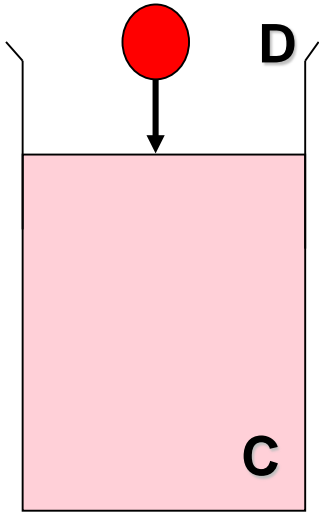
▪ **Faktore baldintzagarriak:**
Bolumen erreal
Plasma proteinekiko lotura
Ehunetikiko lotura

▪ **Zertarako erabilgarria?**
Hasierako dosiak kalkulatzeko (C_p zehatzak lortu)
(dosis de choque-txoke dosia)

$$V_d = \frac{Q}{C_p}$$

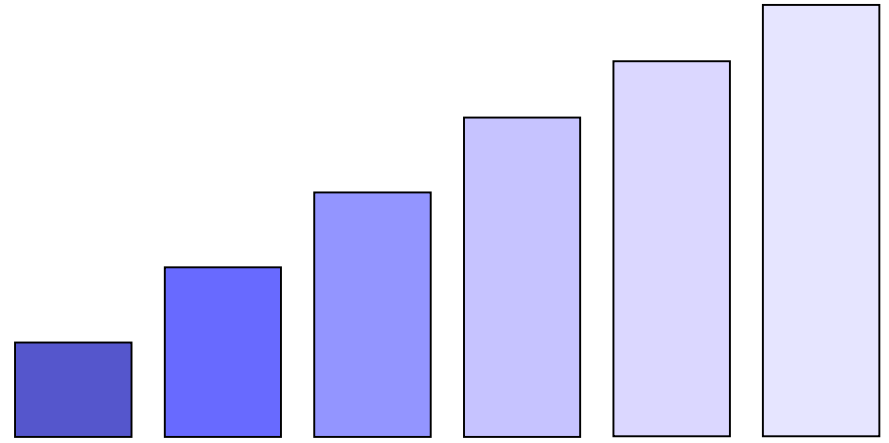


2.3.- Banaketa bolumenaren ageria: esangura biologikoa



$$Vd = \frac{D}{Cp}$$

$$Vd = \frac{1000 \text{ mg}}{50 \text{ mg/L}} = 20 \text{ L}$$



	0,1	0,2	0,3	0,4	0,5	0,6
Vd (L/Kg)	0,1	0,2	0,3	0,4	0,5	0,6
Cp (mg/L)	140	70	50	35	28	23

KONZENTRAZIOA txikitu

2.4.- Farmakoen banaketa: faktore baldintzagarriak

1- Mintz biologikoak zeharkatzeko gaitasuna
- Lipodisolbagarritasuna eta disoziazio-gradua

2- Osagai organoekiko afinitatea

Plasma proteinekiko finkapena: zati librea → banaketa

- la albúmina plasmática

- la alfa₁- glicoproteína ácida

Beste osagaiekiko finkapena → biltegia

- proteinak, hezurak, gantza,

3- Ehunaren odol fluxua

4- Gune funtzional urtsuak

- Baskular, interstizial eta zelulabarrukoa

5- Gune anatomiko bereziak

- Hezi hematoentzefalikoa eta hezi plazentarioa

“Gune funtzionala”
Konpartimenduak = gorputz atalak
farmako-banaketa berberarekin

2.5.-Gune funtzional bereziak

Muga hemato entzefalikoa

Difusio pasiboa, garraio aktibo

Faktore mugatzaileak:

- **Liposolugarritasuna**
- Disoziazio gradua
- Plasma proteinekiko finkapena

Endotelio-zelula arteko arraildurarik ez daude MHEan
Iragazketa oso mugatua fko hidrofiliikoentzat

Muga plazentarioa

Farmako askok muga plazentarioa zeharka dezakete: kalteak
Bereziki difusio pasiboaz



Faktore mugatzaileak:

- Liposolugarritasuna
- **Disoziazio gradua**
- Plasma proteinekiko finkapena