

Caracterización Farmacocinética de Formulaciones Orales de Liberación Sostenida. Factores que influyen en el Perfil Farmacocinético.

Yaimy de la CRUZ PASTRANA*¹, Analién BOZA RIVERA¹,
Tahimi ESPINO ENRIQUE² e Isidoro CARABALLO³

¹ Centro de Química Farmacéutica, Calle 200 y Ave. 21, Atabey, Playa, CP 14042, Ciudad de La Habana, Cuba. ² Centro de Consultoría BIOMUNDI, Ciudad de La Habana, Cuba. ³ Facultad de Farmacia, Universidad de Sevilla, España

RESUMEN. Diversos estudios en el campo de los fármacos de acción sostenida se han enfocado sobre el diseño de ensayos que permitan conocer la velocidad y el grado de absorción de estos fármacos en el tracto gastrointestinal, además de su distribución en el organismo, su metabolismo y excreción, estudios que integran el campo de la farmacocinética. En el presente trabajo se introducen los criterios más actuales sobre la caracterización farmacocinética de las formulaciones de liberación sostenida (FLS) que son administradas por vía oral, se analizan los parámetros seleccionados en la evaluación de las características farmacocinéticas y se reportan diferentes ejemplos que muestran la influencia que ejercen algunos factores (la alimentación, la tecnología de la forma farmacéutica, la administración concomitante con otros medicamentos y la edad) en la farmacocinética de las FLS.

SUMMARY. "Pharmacokinetic characterization of oral sustained-release formulations. Factors that influence pharmacokinetic profiles". Several studies in the field of sustained release drugs have been focused on an assay designs that allow the determination of the rate and extent of absorption of these drugs in the gastrointestinal tract, besides their distribution in the organism, metabolism and excretion, all of which are included in the pharmacokinetic field. This article introduces the most current criteria on pharmacokinetic characterization of oral sustained-release formulations. The parameters selected in the evaluation of pharmacokinetic characteristics were analyzed and different examples that indicate the influence of some factors (e.g.: food, formulation technology, concomitant administration of other drugs, age) on drug release from sustained release drugs were reported.

INTRODUCCIÓN

Una de las tendencias actuales en la elaboración de medicamentos lo constituye el diseño de sistemas de liberación sostenida de fármacos. Estos sistemas surgen con el objetivo de mejorar la calidad de vida de los pacientes y optimizar el tratamiento, al reducir el número de dosis diarias y lograr concentraciones plasmáticas estables, con la consecuente disminución en la aparición de reacciones adversas locales y sistémicas.

El tracto gastrointestinal introduce un gran número de factores que pueden influir significativamente en la velocidad y extensión de la absorción del fármaco; sin embargo, la administración oral es la vía más utilizada para lograr efectos sistémicos. Durante el desarrollo de un nuevo producto farmacéutico con características de

liberación sostenida, resulta imprescindible la realización de estudios farmacocinéticos que permitan caracterizar al producto y compararlo bajo condiciones de estado estacionario con formulaciones convencionales o con otras de referencia. En el presente trabajo se analizan los criterios y parámetros más utilizados en la literatura especializada, que permiten caracterizar correctamente a las nuevas formulaciones de liberación sostenida, y se evalúan los factores que con mayor frecuencia influyen en la modificación de los perfiles de liberación sostenida de los medicamentos.

MATERIALES Y MÉTODOS

Se realizó una búsqueda exhaustiva en la base de datos MEDLINE disponible en Internet, los términos utilizados fueron: *pharmacokinetic*,

PALABRAS CLAVE: Biodisponibilidad, Farmacocinética, Formulaciones de liberación sostenida.

KEY WORDS: Bioavailability, Pharmacokinetic, Sustained - release formulations.

* Autor a quien dirigir la correspondencia. E-mail: cqf@ceniai.inf.cu