



**Nombre de alumnos:** Brisaida Trigueros Ramírez.

**Nombre del profesor:** Ervin silvestre Castillo.

**Nombre del trabajo:** cuadro sinóptico

**Materia:** farmacología

**Grado:** tercer cuatrimestre

**Grupo:** 2 " A "

Frontera Comalapa Chiapas, a 9 de Julio de 2020.

# ANALGÉSICOS- ANTITÉRMICOS Y ANTIINFLAMATORIOS NO ESTEROIDEOS (AINES)

Se trata de un grupo heterogéneo de fármacos que se caracterizan por poseer un grado variable de actividad analgésica, antipirética y antiinflamatoria

Los antiinflamatorios no esteroideos (AINE) pueden actuar a nivel periférico y central. Con respecto a su acción periférica, hay que decir que inhiben la síntesis de prostaglandinas por inactivación de una enzima

Los antiinflamatorios no esteroideos (AINE) pueden actuar a nivel periférico y central.

## ACCIONES FARMACOLÓGICAS

### Acción analgésica

La actividad analgésica de los AINE es de intensidad moderada respecto a los opiáceos, y existe escasa relación entre la dosis y el incremento de la potencia analgésica.

No todos exhiben la misma potencia analgésica, siendo más potentes el ketorolaco y el metamizol. Seguidos del ácido acetilsalicílico (AAS) y sus derivados y demás AINE, para finalizar con el paracetamol (débil inhibidor de la COX-1/COX-2).

### Acción antitérmica

Acción antitérmica sólo se manifiesta cuando la temperatura está elevada y es consecuencia del bloqueo de prostaglandinas (PG), concretamente la PG-E2, que actúa sobre el centro termorregulador del hipotálamo reduciendo la fiebre y favoreciendo los mecanismos de vasodilatación cutánea y sudoración.

Así como los inhibidores selectivos de la COX-2, seguidos de paracetamol, ácido mefenámico, ibuprofeno y naproxeno; de moderada acción antitérmica, indometacina, fenilbutazona, sulindaco, piroxicam, meloxicam, tenoxicam, flurbiprofeno, y de escasa, diflunisal y ketorolaco

### Acción antiinflamatoria

La actividad antiinflamatoria de cada AINE depende de su espectro de acción, es decir, de su actividad anti-COX y acción amortiguadora de las respuestas celulares que se generan como consecuencia de una acción lesiva.

Son potentes antiinflamatorios la indometacina, la fenilbutazona, el naproxeno y el AAS (a dosis de 1-2g/48h), moderada actividad los de más grupos y escasa o nula acción antiinflamatoria: ácido mefenámico, paracetamol, metamizol.

FARMACOCINÉTICA

Acción antiagregante plaquetaria

Inhiben la síntesis de prostaglandinas y tromboxanos por inhibición de la COX, siendo el AAS un inhibido irreversible (efecto prolongado incluso entre 12 y 17 días) y los demás reversibles (la inhibición sólo se manifiesta mientras el fármaco esté circulante en sangre)

los efectos del AAS como antiagregante plaquetario se han observado con dosis bajas de éste (325mg/día), y otros tienen escasos o nulos efectos sobre la agregación plaquetaria dependiendo del grado de selectividad sobre la COX-1 y COX-2, como ocurre con paracetamol.

Acción uricosúrica

Resulta de inhibir el transporte del ácido úrico a nivel renal; sin embargo, los AINE son, en general, útiles a dosis altas en la crisis gotosa por su acción analgésica y antiinflamatoria.

Absorción

La vía más usada es la oral, dada la buena biodisponibilidad (rápida y completa)

Distribución

Se unen en alta proporción a las proteínas plasmáticas (> 90%), especialmente a la albúmina, y en general tienen volúmenes de distribución bajos, pero se distribuyen ampliamente difundiendo hacia todos los líquidos orgánicos

Respecto a su distribución, hay que indicar que debido a que muchos AINE no han sido estudiados en humanos, se desaconseja su uso durante el embarazo, ya sea durante los dos primeros trimestres.

TOXICIDAD Y EFECTOS ADVERSOS

Metabolismo y excreción

Se metabolizan extensamente por vía hepática y se excretan principalmente por vía renal en forma de metabolitos

Alteraciones y lesiones gastrointestinales.

En general inducen un número elevado de alteraciones y lesiones gastrointestinales, tanto de carácter leve como de carácter grave: pirosis, dispepsia, gastritis.

Fármacos útiles para prevenir las lesiones gastrointestinales son: a) antihistamínicos H<sub>2</sub> (v. cap. 31): cimetidina (300 mg/6h) o ranitidina (150mg/12h), que elevan ligeramente el pH, pero que debido a su localización más duodenal que gástrica, estarían más indicados en la prevención de la úlcera duodenal (a excepción de famotidina, 40mg/12h), y b) inhibidores de la bomba de H<sup>+</sup> (v. cap.

Alteraciones renales

Muy comunes son las alteraciones renales con riesgo de insuficiencia renal, ya que al inhibir la prostaglandina PG-E<sub>2</sub> y prostaciclina PG-D<sub>2</sub> y PG-I<sub>2</sub>, se estaría reduciendo la vasodilatación renal (velocidad de filtración glomerular y flujo renal).

Reacciones de hipersensibilidad

Son otros efectos adversos muy frecuentes (20%) y están relacionados con la reducción de PG-E<sub>2</sub> y el incremento de la actividad de LTC<sub>4</sub> (los fármacos modificadores de la síntesis de leucotrienos parecen ser efectivos en el tratamiento del asma)

## INTERACCIONES FARMACOLÓGICAS

### Alteraciones hematológicas

Menos frecuentes son las alteraciones hematológicas: diátesis hemorrágicas por déficit de agregación plaquetaria, anemia hemolítica en pacientes con déficit de glucosa-6-fosfato-deshidrogenasa, agranulocitosis, anemia aplásica y trombocitopenia, y los más lesivos a este nivel son fenilbutazona, indometacina, diclofenaco y metamizol.

### Alteraciones hepáticas

Los más hepatotóxicos son AAS (síndrome de Reye), diclofenaco, sulindaco, fenilbutazona y paracetamol.

### Reacciones cutáneas

Pueden presentar erupciones fijas (fenilbutazona), eritemas multiformes, púrpura, síndrome de Stevens-Johnson (diflunisal, metamizol, oxipizona), fotodermatitis (piroxicam, naproxeno) y necrólisis dérmica (fenilbutazona).

Los AINE presentan importantes interacciones farmacológicas con consecuencias negativas tanto para sí mismos como para los fármacos con los que interactúan.

Disminuyen el efecto antihipertensivo de los bloqueadores beta (controlar la presión arterial y ajustar la dosis), el efecto diurético e hipotensor de los diuréticos de asa, tiazídicos e inhibidores de la enzima de conversión de la angiotensina (IECA) (controlar el efecto diurético y ajustar la dosis), y la actividad uricosúrica del probenecid.

## APLICACIONES TERAPÉUTICAS

Se usan en el control del dolor agudo articular, músculo esquelético, cefaleas de diversa etiología, dismenorreas (muy útiles los derivados de ácido propiónico y antranílico), visceral (en los de tipo cólico nefrítico son muy usados metamizol y ketorolaco), postoperatorio (metamizol, ketorolaco, diclofenaco y parecoxib son los más utilizados) y postraumático, etc

Son también eficaces en el dolor crónico (afecciones reumatológicas, neuralgias de diverso origen, etc.) y dolor oncológico (junto a opiáceos reduciendo así la dosis de los mismos, como ocurre en las asociaciones paracetamol-codeína y ketorolaco-morfina).

## CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES

Los AINE, en general, están contraindicados en hipersensibilidad al principio activo u otros similares (sensibilidad cruzada), hemorragia gastrointestinal activa y enfermedad ulcerosa, y deben tomarse precauciones en casos de enfermedad cardiovascular grave, renal o hepática, diabetes, historia de enfermedad ulcerosa, consumo crónico de alcohol, embarazo, lactancia y en niños (debido a que la seguridad no ha sido bien establecida en el embarazo y en casos de niños, se desaconseja su uso en la segunda mitad del embarazo).