

Universidad del Sureste
Campus Tuxtla Gutiérrez



AINE'S

4to Semestre: Terapéutica
Farmacológica
Por: Viridiana Merida Ortiz
Dr. Alfredo López

Aine's

Antiinflamatorios no esteroideos

Definición: son un grupo de agentes de estructura química diferente que tienen como efecto primario inhibir la síntesis de prostaglandinas, a través de la inhibición de la enzima ciclooxigenasa. Estas drogas comparten acciones farmacológicas y efectos indeseables semejantes.

Clasificación

Tabla 1: **Clasificación de los AINE según su estructura química**

Grupo terapéutico	Fármaco
Salicilatos	Acido acetilsalicílico, salsalato, diflunisal, fosfosal, acetilato de lisina
Pirazolonas	Fenilbutazona
Indolacéticos	Indometacina, tolmetín, sulindaco, acemetacina
Arilacéticos	Diclofenaco, aceclofenaco, nabumetona
Arilpropiónicos	Ibuprofeno, naproxeno, ketoprofeno, flurbiprofeno
Oxicams y análogos	Piroxicam, tenoxicam, meloxicam
Fenamatos	Acido mefenámico, meclofenamato
Inhibidores selectivos de la COX-2	Celecoxib, etoricoxib, lumiracoxib

Tabla 2: **Clasificación de los AINE según vida media plasmática**

Analgésicos	Vida media corta (< 6 horas)	Vida media larga (> 6 horas)
Salicilatos	Acido acetilsalicílico, salsalato, acetilato de lisina	Diflunisal, fosofosal
Pirazolonas	--	Fenilbutazona
Indolacéticos	Indometacina, tolmetín	Sulindaco
Arilacéticos	Diclofenaco,	Aceclofenaco, nabumetona
Arilpropiónicos	Ibuprofeno, ketoprofeno, flurbiprofeno	Naproxeno
Oxicams y análogos	--	Piroxicam, tenoxicam, meloxicam
Inhibidores selectivos de la COX-2	--	Celecoxib, etoricoxib, lumiracoxib

Mecanismo de acción:

Inhibición de la ciclo-oxigenasa (COX):

Es el mecanismo principal, evitando la producción de prostaglandinas, que actúan como mediadores de la inflamación a nivel periférico y central. Inhiben la prostaglandina-sintetasa, afectando a la transformación del ácido araquidónico en prostaglandinas, prostaciclina y tromboxano. Se conocen 2 formas de la enzima COX: COX-1 y COX-2:

- ◆ COX-1. Es una enzima constitutiva que se encuentra en la mayoría de los tejidos. Se encarga de regular procesos como la protección gástrica, agregación plaquetaria, función renal y la homeostasis vascular. Por tanto su inhibición puede provocar efectos secundarios a estos niveles.
- ◆ COX-2. Esta enzima habitualmente no se detecta en los tejidos y aparece de forma inducida en estados de inflamación. Su expresión se inhibe por todos los AINE y también por los corticoides. En estos casos, los llamados AINE selectivos, al inhibir preferentemente la COX-2, consiguen una acción antiinflamatoria sin los efectos secundarios, especialmente gástricos, al no inhibir la enzima COX-1.

Indicación

- ◆ Los NSAID son antipiréticos, analgésicos y antiinflamatorios, con excepción del paracetamol, que es antipirético y analgésico.
- ◆ Sistema circulatorio fetal: Las PG están implicadas en el mantenimiento de la permeabilidad del conducto arterial y la indometacina, el ibuprofeno y otros NSAID han sido utilizados en neonatos para cerrar el conducto que no tiene permeabilidad apropiada.
- ◆ Cardioprotección: El ácido acetilsalicílico reduce en 20-25% el riesgo de eventos vasculares graves en pacientes de alto riesgo.
- ◆ Tolerabilidad a la niacina. Grandes dosis de niacina (ácido nicotínico) reducen de manera efectiva los niveles de colesterol sérico, disminuyen las lipoproteínas de baja densidad y aumentan la lipoproteína de alta densidad.

- ◆ Quimioprevención del cáncer. Los estudios epidemiológicos sugieren que el uso diario de ácido acetilsalicílico se asocia con una deficiencia de 24% en la incidencia de cáncer de colon.

Dosis

Fármaco	Semivida (horas)	Excreción urinaria del medicamento sin alterar	Dosis recomendada del antiinflamatorio
Ácido acetil-salicílico	0.25	<2%	1 200-1 500 mg tid
Salicilato ¹	2-19	2-30%	Véase nota al pie ²
Celecoxib	11	27% ³	100-200 mg bid
Diclofenaco	1.1	<1%	50-75 mg qid
Diflunisal	13	3-9%	500 mg bid
Etodolaco	6.5	<1%	200-300 mg qid
Fenoprofeno	2.5	30%	600 mg qid
Flurbiprofeno	3.8	<1%	300 mg tid
Ibuprofeno	2	<1%	600 mg qid
Indometacina	4-5	16%	50-70 mg tid
Ketoprofeno	1.8	<1%	70 mg tid
Meloxicam	20	<1%	7.5-15 mg qd
Nabumetona ⁴	26	1%	1 000-2 000 mg qd ⁵
Naproxeno	14	<1%	375 mg bid
Oxaprozin	58	1-4%	1 200-1 800 mg qd ⁵
Piroxicam	57	4-10%	20 mg qd ⁵
Sulindaco	8	7%	200 mg bid
Tolmetina	1	7%	400 mg qid

Efecto secundario

- ◆ Sistema nervioso central: dolores de cabeza, tinnitus, mareos y, raramente, meningitis aséptica.
- ◆ Cardiovascular: retención de líquidos, hipertensión, edema y, en raras ocasiones, infarto del miocardio e insuficiencia cardiaca congestiva.

- ◆ Gastrointestinal: dolor abdominal, dispepsia, náuseas, vómitos y, raramente, úlceras o hemorragia.
- ◆ Hematológico: trombocitopenia rara, neutropenia e incluso anemia aplásica.
- ◆ Hepático: resultados anormales en la prueba de función hepática e insuficiencia hepática rara.
- ◆ Pulmonar: asma.
- ◆ Piel: erupciones, todos los tipos, prurito.
- ◆ Renal: insuficiencia renal, fallo renal, hipercalcemia y proteinuria.
- ◆ Síndrome de Reye: Debido a la posible asociación con el síndrome de Reye, el ácido acetilsalicílico y otros salicilatos están contraindicados en niños y en jóvenes menores de 20 años de edad con fiebre asociada a enfermedad viral.