

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.