

# Aines

Ciclooxigenasa → Prostaglandina

## Clasificación

- Aines no dependientes de Isoforma → Inhiben Cox-1 y Cox-2
- Aines selectivos de Cox-2
- Competitivos
- No " " "
- Inhibidor irreversible

## Aines → Inhibir PG

Acido Aracido

- Primera enzima es Cox → Convierte el AA en PGE<sub>2</sub> y PGE<sub>2</sub> → producción de prostanoideas: TXA<sub>2</sub> y PGI<sub>2</sub>
- Cox-1 → Mantiene producción fisiológica normal de prostaglandina.
- Cox-2 → Inducida por citocinas, fuente + importante de formación de prostanoideas en inflamación.
- PU → Inhib de Cox-1 (citoprotectora) → efecto gástricos y sangrados (forma TXA<sub>2</sub> en plaquetas) ↓ Vasodilatación
- Cox-2 Regulación de TA, inhibidor de hemostasia → inhibición → HTA y protrombótico.

## Inhibición Irreversible de Cox por ASA "Aspirina"

- Inhibe irreversiblemente las Cox
- Inhibe de TXA<sub>2</sub> dependiente de Cox 1 de plaquetas → 8-12 días tiempo de recambio plaquetario post terapia.
- Actúa en los proteínas de manera irreversible.

## Inhibición Selectiva Cox-2

Aines → Dosis limitada por poca tolerancia GI

Los inhib selectivos de Cox2 con mejor tolerancia GI

GU → Coxibs. [celecoxib]

Proprambos. → parecoxib, etoricoxib

## Absorción

## Distribución

## Metabolismo

## Eliminación

## Aines

- Abs oral
- Concentración Max 2-3 n
- Alimentos reduce absorción ↓ disponibilidad sistémica.

## Distribución

90-99% Unido a proteínas  $\rightarrow$  Albumina

Metabolismo y excreción.

Biotransformación hepática

Eliminación renal

$T_{1/2}$  Variable

Ibuprofeno, paracetamol, diclofenaco 1-4 h

Naproxeno 9-25 h

X en proceso hepatomera

## Uso terapéuticos

- Analgésicos

- Anestésicos

- Antiinflamatorios

## Terapéutica

Inflamación  $\rightarrow$  Asociado a Musculoesqueléticas

Dolor  $\rightarrow$  neurop-Medullar

Fiebre

• Sistema de circuito fetal  $\rightarrow$  Indometacina o ibuprofeno - PEI implicados en el mantenimiento del conducto arterial.

• Cardioprotección  $\rightarrow$  ASA prolonga tiempo de sangrado -  $\downarrow$  20-25% Riesgos Vasculares.

- Dosis 100 mg.

- Riesgos de hemorragias GI.

## Efectos Adversos con Aines gastrointestinales

Disepepsia  $\rightarrow$  Distensión abd.

Dolor de abdomen

Anorexia

Náuseas

Diarrea

Sangrados

## Mecanismo de Complicaciones GIales.

Cox-1 Inhibe secreción de ácido por células  
Mantiene flujo sanguíneo en mucosa  
Masa citoprotectora

Cox-2, produce PEI

- producción de úlceras.

## Erales $\downarrow$

Hemorragia

Perforación

Úlceras

Hematemesis

Melena

- Por inhibición de PEI. riesgo  $\uparrow$

Por H. pylori / alcohol

• bomba de protones + Aines  $\rightarrow$   $\uparrow$  úlceras