



Universidad del Sureste  
Campus Comitán  
Medicina Humana



# “AINES”

**Nombre del alumno:**

Liliana Guadalupe Hernández Gomez

**Parcial:** 3

**Nombre de la materia:** Farmacología

**Docente:** DR. Guillen Reyes Luis Enrique

**Semestre:** 3º

Comitán de Domínguez, Chiapas; a 16 de noviembre del 2023

Scanned with CamScanner

Acto Farmac 2 cuhlls

Farmacoterapia de inflamación, fiebre, dolor.

"AINES"

Antiinflamatorio, antipirético y analgésico.

- Tx inflamación, dolor y fiebre
- Actúan por inhibición de prostaglandinas (H Coxibogenero)
- Cox 1 y 2
- Inhibe de Cox 2 → mediador de efectos antipiréticos, analgésicos y antiinflamatorios de AINES
- Efectos adversos por la inhibición a la fuerza donde cumplen funciones fisiológicas
- ASA es irreversible
- Los otros AINES → reversibles → Ur ácido mequidónico

Inflamación

• Respuesta protectora del sistema inmune a estímulo perjudicial

- Agente nocivo

- Infecciones

- Lesiones físicas

• Liberación de mediadores asociados a daño

• PGE<sub>2</sub> y PGI<sub>2</sub> son los principales prostanooides que median inflamación

- ↑ Flujo sanguíneo local

- Permeabilidad vascular

- Infiltración de leucocitos

Dolor

• No tiene receptores

• Terminaciones nerviosas libres

• Detectan estímulos y se activan → dolor, calor, presión

• Mediadores inflamatorios ↑ sensibilidad de nociceptores → ↑ dolor

- Mediadores →
  - Bradicinina
  - $H^+$
  - Serotonina
  - Neurotrofinas
  - Leucotrienos y prostaglandinas

- Prostaglandina relacionada con dolor
- $PGE_2$ ,  $PGD_2$ ,  $PGI_2$ ,  $PGF_{2\alpha}$  → Sensibilización central → Hiperalgesia y alodinia
- Tanto COX1 y COX2 se expresan en médula espinal y liberan PG en respuesta a estímulos dolorosos
- AINES inhiben

## Fiebre

- Hipotálamo regula temperatura corporal
- Tª infecciones, daño de tejido, inflamación, rechazo de injerto, malignidad.
- Citocinas como
  - IL-1 $\beta$ , 6, FNT- $\alpha$  e interferón → Pirogenos Endógenos
- Inicial → inducción de COX2 y formación de  $PGE_2$  →  $PGE_2$  cruza barrera hematoencefálica → receptores EP2 y EP4 termosensibles → hipotálamo → fiebre
- AINES → inhiben COX-2 dependiente de síntesis de  $PGE_2$

## AINES

- Clasificación → Aspirina
- (ASA) - AINES no dependiente de isoforma → inhiben COX-1 y COX-2
- AINES selectivos de COX2
- Competitivo
- No competitivo
- Inhibidor reversible

## Inhib de COX

- AINES → Inhibir PG
- Primera enzima es COX → Convierte el AA a PGG2 y PGH2 → producción de prostanoide, TXA2 y PG
- COX-1 → Mantiene producción fisiológica normal de prostanoide
- Cox-2 → Inducido por citocinas, fuente + importante de formación de prostanoide en inflamación
- Pj → inhib de COX-1 (Citoprotectora) → efectos gástricos y sangrados (forma TXA2 en plaquetas) → Vasocostricción
- COX-2 → regulación de TA, inhibidor de hemostasia → inhibición → HTA y protrombotico.

## Inhibición irreversible de COX por ASA

- Inhibe irreversiblemente los COX
- Inhibe de TXA2 de producción de COX1 de plaqueta → 8-12 días tiempo de recambio plaquetario post terapia
- Acetila a las proteínas de manera irreversible.

## Inhibición selectiva COX-2

No tiene tanto impacto gastrointest. En pacientes con problemas cardiovasculares es más indicado en estos.

- AINES → Uso crónico limitado por poca tolerancia GI
- Los inhib selectivos de COX2 con mejor tolerancia GI
- Ejemp → Coxibs
  - Celecoxib
  - Rofecoxib

Distribuye

Absorbe / Metabolismo  
Eliminación

## ADME → AINES

- Abs rápida oral
- Concentraciones plasmáticas max 2-3h

- Alimentos retrasa absorción y disponibilidad sistémica

## Distribución

- 95 - 99% unido a proteínas → Albumina
- Metabolismo y excreción →
  - Transformación hepática
  - Eliminación renal
  - $T_{1/2}$  variable
  - Ibuprofeno, paracetamol, diclofenaco 1-4h
  - Naproxeno 9-25h
  - No se recomienda en procesos patológicos hepatocelulares

## Usos terapéuticos

1. Antipiréticos
2. Analgésicos
3. Antiinflamatorios
  1. Norma el paracetamol, antipirético y analgésico

## Terapéutica

- Inflamación → Alivia dolor/inflamación asociado a ts musculoesqueléticas
- Dolor → Dolor inflamatorio bajo-moderado.
- Fiebre
- Sistema de circuito Peta → indometacina e ibuprofeno; PG implicador a el mantenimiento del conducto arterial
- Cardioprotección → ASA reduce tiempo de sangrado
  - 20-25% riesgo vascular a PX alto riesgo (IAM previa)
  - Dosis 100mg
  - Riesgo de hemorragias GI