

Josué Alejandro Roblero Díaz

Dr. Dagoberto Silvestre Esteban

Cuadro Comparativo del mecanismo de acción de los AINES

Farmacología

PASIÓN POR EDUCAR

3°

A

CUADRO COMPARATIVO

CLASE/ FARMACO	FARMACOCIN ÉTICA	DOSIFICACIÓN	COMENTARIOS	COMPARADO CON ÁCIDO ACETILSALICÍLICO
SALICILATOS				
Ácido acetilsalicílico	Máximo Cp, 1 h Unión a proteínas, 80-90% Metabolito, ácido salicílico t _{1/2} terapéutica, 2-3 h t _{1/2} dosis tóxica, 15-30 h	Antiplaquetario, 40-80 mg/día Dolor/fiebre, 325-650 mg 4-6 h Fiebre reumática, niños 1 g/4-6 h o 10 mg/kg 4-6 h	Permanente inhibición de la COX-1 plaquetaria Efectos adversos: GL, ↑ hipersensibilidad a tiempo de coagulación Evitar en niños con enfermedad febril aguda.	
DERIVADO DE PARAAMINOFENOL				
Paracetamol	Máximo Cp, 30-60 min Unión a proteínas, 20-50% Metabolitos, glucurónidos (60%); sulfatos (35%) t _{1/2} , 2 h	650 mg o menos cada 4 h (máximo de 4 000 mg/24 h)	Débil inhibidor no específico de la COX en dosis comunes La potencia puede modularse por peroxidasa Sobredosis ⇒ metabolito tóxico, (NAPQI) necrosis hepática	Equivalente analgésico/antipirético Antiinflamatorio, efectos plaquetarios y GI < ácido acetilsalicílico a 1 000 mg/día
DERIVADOS DEL ÁCIDO ACÉTICO				
Indometacina	Máximo Cp, 1-2 h Unión a proteínas, 99% Metabolitos, O-desmetilo (50%); sin cambios (20%) t _{1/2} , 2 h	25 mg 2-3 veces/día; 75-100 mg por la noche	Efectos secundarios (3-50%); cefalea frontal, neutropenia, trombocitopenia; 20% discontinuo	10-40 × más potente; la intolerancia suele limitar la dosis

CUADRO COMPARATIVO

CLASE/ FARMACO	FARMACOCIN ÉTICA	DOSIFICACIÓN	COMENTARIOS	COMPARADO CON ÁCIDO ACETILSALICÍLICO
-------------------	---------------------	--------------	-------------	--

DERIVADOS DEL ÁCIDO ACÉTICO

Ketorolaco	Máximo Cp, 30-60 min Unión a proteínas, 99% Metabolito, glucurónido (90%) t _{1/2} , 4-6 h	Véase prospecto de la FDA en el paquete	Parenteralmente (60 mg IM, luego 30 mg cada 6 h, o 30 mg IV cada 6 h) Disponible como preparación ocular	Potente analgésico, pobre antiinflamatorio
Diclofenaco	Máximo Cp, 1 h; versión extendida, 5 h Unión a proteínas, 99% Metabolito, glucurónido y sulfuro (renal 65%, bilis 35%) t _{1/2} 1.2-2 h (tabletas de liberación inmediata); 12 h (parche de epolamina tópica)	50 mg 3 veces/día o 75 mg dos veces al día	Como gel tópico, solución ocular, tabletas orales combinado con misoprostol Efecto de primer paso; biodisponibilidad oral, 50%	Más potente; 20%, efectos secundarios; 2% discontinua; 15%, enzimas hepáticas elevadas Sustrato para CYP 2C9 es 3A4

DERIVADOS DEL ÁCIDO PROPIÓNICO

Ibuprofen	Máximo Cp, 2 h (tabletas), 1 h (tabletas masticables), 0.75 h (líquido) Unión a proteínas, 99% Metabolito, oxidación de CYP2C9 a 2- y 3-hidroxilatos; conjugación a acil glucurónidos t _{1/2} , 2-4 h (adultos); 23-75 h (bebés prematuros); 0.9-2.3 h (niños)	200-800 mg 3-6 veces/d con comida (máximo 3.2 g/d); Pediátrica canadiense y estadounidense max 2.4 g/d Niños: 4-10 mg/kg/dosis, 3-4 veces/d	10-15% discontinua; puede aumentar el riesgo de meningitis aséptica; excretado en la leche materna Racemato: 60% de enantiómero R se convierte en ibuprofeno-S	Igual de potente
------------------	---	--	---	------------------

CUADRO COMPARATIVO

CLASE/ FARMACO	FARMACOCIN ÉTICA	DOSIFICACIÓN	COMENTARIOS	COMPARADO CON ÁCIDO ACETILSALICÍLICO
DERIVADOS DEL ÁCIDO PROPIÓNICO				
Naproxeno	Máximo Cp, 2-4 h (valor base); 1-4 h (líquido); 1-2 h (sal de sodio); 4-12 h (liberación retardada) Unión a proteínas, 99% (↑ fracción libre en ancianos) Metabolismo, oxidación de CYP 2C9, 1A2, 2 8 a 6-O-desmetil y otros metabolitos t _{1/2} , 9-25 h	250 mg 3-4 veces/d; 250-550 mg 2 veces/d; 750-1 000 mg al día (liberación prolongada) Niños: 5 mg/kg 2 veces/d (máximo 15 mg/kg/d)	Los efectos máximos antiinflamatorios después de 2-4 semanas; ↑ libre fracción y ↓ excreción ⇒ ↑ riesgo de toxicidad en personas mayores; puede aumentar el riesgo de meningitis aséptica; excretado en la leche materna; t _{1/2} de duración variable puede permitirse cardioprotección en algunos individuos	Usualmente mejor tolerado
Ketoprofeno	Máximo Cp, 1,2 h; 6.8 h (liberación prolongada) Unión a proteínas, 99% Metabolitos, conjugados de glucurónido; ¿recirculación enterohepática? t _{1/2} , 0.9-3.3 h	25-50 mg 3-4 veces/d; 75 mg 3 veces/d; 200 mg diarios (liberación prolongada); max 300 mg/d Antiinflamatorio, 50-75 mg, 3-4/d	30% desarrolla efectos secundarios (por lo general GI, generalmente leve); 13% alteración de función hepática; sin consolidar fracción, exposición sistémica, y t _{1/2} ↑ con la edad en personas mayores; excretado en la leche materna	En general mejor tolerado; eficacia biológica > t _{1/2} plasmática
DERIVADOS DEL ÁCIDO ENÓLICO				
Meloxicam	Máximo Cp, 4-5 h (y 12-14 h debido a reciclaje biliar) Unión a proteínas, 99% Metabolismo, hidroxilación t _{1/2} , 15-20 h	7.5 mg al día (máximo 15 mg/d); Niños ≥2: dosis efectiva más baja, 0.125 mg/kg al día (máximo 7.5 mg al día)	Alguna selectividad de la COX-2, en especial en dosis más bajas; las mujeres mayores tienen mayor exposición sistémica y las mayores concentraciones máximas plasmáticas que los hombres y que las jóvenes; se desconoce si hay excreción en la leche materna	

CUADRO COMPARATIVO

CLASE/ FARMACO	FARMACOCIN ÉTICA	DOSIFICACIÓN	COMENTARIOS	COMPARADO CON ÁCIDO ACETILSALICÍLICO
NSAID DIARIL HETEROCÍCLICOS (SELECTIVOS DE LA COX-2)				
Celecoxib	Máximo Cp, 3 h Unión a proteínas, 97% Metabolismo, CYP 2C9 (mayor) y 3A4 (menor), glucurónido t _{1/2} , 11.2 h	100-200 mg 1-2 veces/d; 400 mg seguido de 200 mg si es necesario en el primer día (dolor agudo); máximo, 800 mg/d. Niños >2 años: 50 mg (10-25 kg) o 100 mg (>25 kg) 2 veces/d	Inhibidor de CYP2D6 y CYP2D8 Efectos adversos: molestias GI (5%); se reporta meningitis aséptica y metahemoglobinemia; riesgo de coagulación diseminada intravascular en pacientes pediátricos; 40% mayor exposición sistémica en personas de la raza negra y mujeres mayores; excretado en la leche materna	Por lo general se tolera mejor; no suele prolongar el tiempo de sangrado

Conclusiones

Los AINE inhiben y retrasan la curación de fracturas en mayor o menor grado, dependiendo de la preparación individual, incluso si realizar solamente estudios animales han producido datos inequívocos. Todos los hallazgos disponibles y mecanismos de acción descubiertos hasta ahora no permiten otra conclusión. Los hallazgos pueden ser extrapolados, al menos con reservas, al organismo humano. Sin embargo, son todavía necesarias investigaciones apropiadas para clarificar los verdaderos hechos con diferentes AINE.

Bibliografía

Laurence, B. L. (2023). *Goodman & Gilman. Las Bases Farmacológicas de la Terapéutica*. McGraw-Hill.

