



MEDICINA HUMANA

Dr. Dagoberto Silvestre Esteban

Farmacología de la Inflamación

Farmacología

3° PASIÓN POR EDUCAR

“A”

Comitán de Domínguez Chiapas a 3 de mayo de 2024.[nol](#)

PARAMINOFENOL

PARACETAMOL

Analgésico y antipirético: efectos antiinflamatorios débiles

Mecanismo de acción: Tiene efectos similares a los del acetilsalicílico, pero solo efectos antiinflamatorios débiles. Es un inhibidor de COX no selectivo, que actúa en el sitio de peróxido del enzima y se distingue por ello entre los NSAID.

Ac. Acético

Indometacina

Potente inhibidor no selectivo de la COX.

Inhibe la movilidad de los leucocitos PMN, deprimen las biosíntesis de los mucopolisacáridos y puede tener un efecto directo vasoconstrictor independiente de COX. La indometacina tiene propiedades antiinflamatorias y analgésicosantiperreticas prominentes similares a las de los salicilatos.

→ **ADME: (ORAL)** tiene una excelente biodisponibilidad. Las concentraciones máximas se producen 1-2 horas después de la dosificación. La concentración del fármaco en el CSF es baja, pero su concentración en el líquido sinovial es igual a las del plasma al cabo de las 5h de la administración.

Diclofenaco

Se encuentra entre los NSAID. Analgésico, antipirético y actúa como antiinflamatorio Su potencia es mucho mayor que la de otros NSAID No se desarrolló para ser un fármaco selectivo para la COX-2 la selectividad del diclofenaco para esta se asemeja a la del celocoxib.

→ **ADME:** Muestra una absorción rápida. Una unión a proteínas extensa y una $t_{1/2}$ de 1-2 h La corta $t_{1/2}$ hace que sea necesario administrar dosis de diclofenaco mucho más altas de lo que se requería para inhibir por completo la COX-2 en las entradas de concentrados máximos en plasma para proporcionar una inhibición sostenida de la COX al largo del intervalo de dosificación. Ambas formas COX se inhiben para la primera fase del intervalo de dosificación.

Ketorolaco

Potente analgésico, moderadamente eficaz como fármaco antiinflamatorio. Su uso se limita a 5 días o menos para el dolor agudo. **Dosis:** 30-69 mg (Intramuscular): 15-30 mg (intravenoso). 10-20 (Oral). 31.5 (intranasal). **Efectos secundarios:** Somnolencia 6% Mareo 7% Dolor de cabeza 17% Dolor GI 13% Dispepsia 12% Náuseas 12% Dolor en el sitio de la inyección 2%.

Ac. Acetil salicílico

Analgésico- Antipirético y Antiinflamatorio, más utilizado.

Mecanismo de acción: La acción se debe a su contenido de ácido salicílico los efectos del ácido son causados por su propiedad para acetilar proteínas "inhibición irreversible de la ciclooxigenasa

→ **Absorción, distribución, eliminación:** Se absorbe con rapidez por el tracto digestivo alcanzando concentración máxima en el plasma en menos de 30 min, se distribuye en la mayor parte de sus tejidos corporales y los líquidos transcelulares y son excretados en la orina

Derivados del ac. Propiónico

Ibuprofeno

- Tabletas, capsulas, capsulas de gelatina, gotas orales, suspensión oral.
- Es de acción corta, con una $t_{1/2}$ de casi 2h
- La dosis habitual para el dolor leve a moderado es de 400 mg cada 4-6 horas según sea necesario.

→ **Efectos adversos:** Erupciones (3-9%), Trombocitopenia (<1%), Cefalea (1-3%), Mareos (3-9%), Visión borrosa (<1%), Ambliopía tóxica (<1%), Retención de líquidos (1-3%), Edema (1-3%).

Naproxeno

Tabletas, tabletas de liberación prolongada, capsulas de gel y comprimidos que contienen 200-500 mg.

Las formas sólidas oral contienen 200mg o menos estas disponibles sin receta médica

→ **ADME:**
Se absorbe por completo después de la administración oral. También se absorbe por vía rectal, pero es más lento. Deben prescribirse dosis bajas en

los ancianos. Se metaboliza extensamente en el hígado, alrededor del 30% del fármaco se absorbe 6-dementilasion.

Se excreta como el glucoronido u otros conjugados.

El metabolito de naproxeno se excreta casi por completo en la orina

Ketoprofeno

Unión a proteínas, 99% (liberación prolongada); Max 3-4/d

30% se desarrolló efectos secundarios (por lo general GI, generalmente leve)13% alteración de función hepática; sin consolidar fracción, exposición sistémica, y t1/2 aumento con la edad en personas mayores; excretado en la leche materna.

En general mejor tolerado; eficacia biológica>t1/2 plasmática.

Selectivos de la Cox-2

Celecoxib

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; excretados en la leche materna.

Por lo general se tolera mejor, no suele prolongar el tiempo de sangrado.

Unión a proteínas, 97%

Metabolismo, CYP2C9 (mayor) y 3^a4 (menor), glucuronido

T1/2, 11.2 h

Derivados del Ac. Enolico

Meloxicam

Unión a proteínas, 99%

Metabolito, hidroxilación CYP2C9, conjugación N-desmetilación t 1/”-50h

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). Máximo Cp, 3-5 horas

Conclusión

Los AINES (antiinflamatorios no esteroideos) son medicamentos fundamentales en el tratamiento del dolor y la inflamación, y su importancia radica en varios aspectos

Ya sea para aliviar el dolor, reducir la inflamación, variedad de usos, su accesibilidad que tienen, ya que muchos de estos, los podemos adquirir incluso sin receta médica, así como también que estos no nos van a generar efectos adversos como el de los esteroideos que estos generan consecuencias hormonales etc. etc.

Aunque los AINES son medicamentos eficaces, es importante utilizarlos con precaución y bajo la supervisión de un profesional de la salud debido a sus posibles efectos secundarios, especialmente en el sistema gastrointestinal y cardiovascular. Además, es crucial seguir las indicaciones de dosificación y evitar su uso prolongado sin supervisión médica.

Bibliografía

GOODMAN & GILMAN LAS BASES FARMACOLÓGICAS DE LA TERAPÉUTICA 13ª EDICIÓN, LAURANCE BRUNTON, McGraw-Hill Interamericana de España, 2019.

AINES



Una lesión

Las células liberan ácido araquidónico

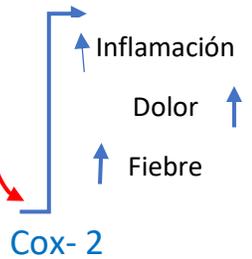
Esta conversión se da por acción de

Enzima prostaglandina sintetasa

Se convierte en:

- Tromboxano
- Prostaciclina
- Prostaglandinas

Mediadores inflamatorios



Enzima inducida

No se afecta en los tejidos, aparece de forma inducida en estados de inflamación

Cox-1

Enzima Constitutiva

Se encuentra en casi todos los tejidos

- Tubo digestivo
- Plaquetas
- Riñón

- Inflamación
- Fiebre
- Dolor
- Protección gástrica

Al inhibir:

