



Universidad Del Sureste
Campus Comitán
Lic. Medicina Humana



Citlali Monserrath Campos Aguilar.

Farmacologia

Dr. Dagoberto Silvestre Esteban

CLASE/ FÁRMACO	FARMACOCINÉTICA	DOSIFICACIÓN	COMENTARIOS	COMPARADO CON ÁCIDO ACETILSALICÍLICO
• Ácido acetilsalicílico	• Máximo Cp, 1 h Unión a proteínas, 80-90% Metabolito, ácido salicílico t/2 terapéutica, 2-3 h t/2 dosis tóxica, 15-30 h	• Antiplaquetario, 40-80 mg/día Dolor/febre, 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.	
• Paracetamol	• Máximo Cp, 30-60 min Unión a proteínas, 20-50% Metabolitos, glucurónidos (60%), sulfatos (35%) t/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
• Indometacina	• Máximo Cp, 1-2 h Unión a proteínas, 99% Metabolitos, O-desmetilo (50%), sin cambios (20%) t/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 x más potente; la intolerancia suele limitar la dosis
• Ketorolaco	Máximo Cp, 30-60 min Unión a proteínas, 99% Metabolito, glucurónido (90%) t/2, 4-6 h		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%, biliar 35%) t/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
• Ibuprofeno	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-hidroxiolatos; conjugación a acil glucurónidos t/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); Pediatría 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
• 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/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/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/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/2 ↑ con la edad en personas mayores; excretado en la leche materna	En general mejor tolerado; eficacia biológica > t/2 plasmática
• Meloxicam	Máximo Cp, 4-5 h (y 12-14 h debido a recirculación biliar) Unión a proteínas, 99% Metabolismo, hidroxilación t/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	
• Celecoxib	Máximo Cp, 3 h Unión a proteínas, 97% Metabolismo, CYP 2C9 (mayor) y 3A4 (menor), glucurónido t/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