

Mi Universidad

RESUMEN

Carla Sofía Alfaro Domínguez

Resumen de Antiinflamatorios esteroideos y no esteroideos

Parcial 4

Farmacología

Dr. Dagoberto Silvestre Esteban

Licenciatura en Medicina Humana

Tercer Semestre grupo "A"

11 de diciembre del 2024, Comitán de Domínguez, Chiapas.

INTRODUCCIÓN

Los fármacos antiinflamatorios desempeñan un papel crucial en el tratamiento de diversas enfermedades caracterizadas por inflamación, dolor y fiebre. Se dividen en dos grandes categorías: antiinflamatorios esteroideos (corticoides) y no esteroideos (AINEs). En este resumen detallaré sus mecanismos de acción, clasificaciones, indicaciones, efectos adversos y dosis recomendadas para algunos de los fármacos más utilizados, con la finalidad de aprender a usarlos correctamente en situaciones adecuadas.

ANTIINFLAMATORIOS ESTEROIDEOS

Los corticoesteroides son hormonas sintéticas o naturales derivadas del córtex suprarrenal. Estos imitan los efectos de las hormonas producidas por las glándulas suprarrenales y se utilizan ampliamente en medicina por sus propiedades antiinflamatorias e inmunosupresoras.

Dentro de sus funciones principales están:

Antiinflamatorias: Reducen la inflamación al inhibir mediadores químicos.

Inmunosupresoras: Suprimen la respuesta inmune para evitar rechazos o controlar enfermedades autoinmunes.

Metabólicas: Alteran el metabolismo de glucosa, grasas y proteínas.

Efectos secundarios sistémicos: Pueden ocasionar osteoporosis, hiperglucemia, hipertensión, entre otros.

Y sabemos que el cortisol es el principal glucocorticoide del ser humano. Estos fármacos se metabolizan en el hígado y pueden clasificarse de acuerdo a su potencia, por ejemplo:

Baja potencia: Cortisona

Potencia intermedia: Prednisona

Alta potencia: Betametasona

CORTISONA

La cortisona es un corticosteroide de origen natural. Es uno de los derivados de los glucocorticoides y su fórmula molecular es $C_{21}H_{28}O_5$, es un esteroide con un núcleo ciclopentano-perhidro-fenantreno que posee un grupo cetona en la posición C3 y C20 y un grupo hidroxilo en C17.

★ **Absorción:** La cortisona se puede administrar por vía oral, intramuscular (IM) o tópica.

Oral: Se absorbe bien en el tracto gastrointestinal.

IM: Su absorción depende de la formulación; puede ser de liberación rápida o sostenida



Distribución: Se une en gran parte a proteínas plasmáticas, principalmente a la globulina fijadora de corticosteroides (CBG) y en menor grado a la albúmina. Tiene una vida media corta (60-90 minutos) y se distribuye ampliamente en los tejidos.



Metabolismo: La cortisona es un profármaco que se convierte en hidrocortisona (cortisol) en el hígado por la enzima 11 β -hidroxiesteroide deshidrogenasa tipo 1 (11 β -HSD1).



Excreción: Se elimina principalmente a través de la orina en forma de metabolitos inactivos conjugados.



Efectos adversos: Los efectos secundarios van a depender de la dosis, duración del tratamiento y vía de administración del fármaco, por ejemplo:

+ Hiperglucemia

+Osteoporosis

+Retención de sodio y agua

+Supresión del eje hipotalámico-hipofisario-adrenal.

+Sx de Cushing

+Miopatía (debilidad muscular)

Indicaciones principales:

+Enfermedades inflamatorias como artritis reumatoide y lupus eritematoso sistémico.

+Alergias graves (anafilaxia, angioedema).

+Enfermedades cutáneas (eczema, dermatitis atópica).

+Insuficiencia suprarrenal (como terapia de reemplazo en enfermedad de Addison).

+Enfermedades pulmonares (asma severa, exacerbaciones de EPOC).

+Tratamiento paliativo en neoplasias (para aliviar edema cerebral), estados de shock y condiciones autoinmunes.

Dosis: La dosis varía según la condición tratada, vía de administración y respuesta del paciente.

Oral:

Dosis inicial típica: 25-300 mg/día, dependiendo de la gravedad del cuadro.

Intramuscular:

Dosis común: 25-50 mg cada 12-24 horas.

Tópica:

Depende de la concentración del preparado (1%-2%) y del área.

PREDNISONA

Es un glucocorticoide sintético, derivado de la cortisona, con estructura básica de ciclopentano-perhidro-fenantreno.

Respecto a su farmacocinética, este fármaco se administra por vía oral y se absorbe rápidamente en el tracto gastrointestinal, la biodisponibilidad oral es alta, cercana al 70-80%, y el pico plasmático se alcanza entre 1-2 horas después de la administración.

En relación a su distribución, se une en un 70-90% a las proteínas plasmáticas, principalmente a la globulina y la albúmina. La prednisona es un profármaco que se metaboliza rápidamente en el hígado por acción de la 11 β -hidroxiesteroide deshidrogenasa tipo 1, transformándose en prednisolona (su forma activa).

+También se metaboliza a través del sistema **CYP3A4**.

Se elimina mayoritariamente por los riñones (como metabolitos inactivos conjugados con glucurónido o sulfato), y la vida media de eliminación es de 2-3 horas, pero sus efectos farmacológicos duran más debido a su modulación génica prolongada.

BETAMETASONA

La betametasona es un glucocorticoide sintético que se deriva de la prednisolona, con alta potencia antiinflamatoria y baja actividad mineralocorticoide, su fórmula molecular: **C₂₂H₂₉FO₅**.

INDICACIONES ESPECIALES

1. Vía intraarticular o intralesional:

Bursitis, tendinitis, artritis reumatoide localizada.

2. En neonatología (intramuscular):

Maduración pulmonar fetal en mujeres en riesgo de parto prematuro (entre las 24-34 semanas de gestación).

DOSIS

Dosis oral (adultos):

Rango: 0.5-9 mg/día, según la enfermedad y su gravedad.

Dosis intramuscular (IM):

Adultos: 4-12 mg cada 1-2 semanas (dependiendo de la indicación).

Maduración pulmonar fetal: 12 mg IM cada 24 horas por 2 días.

Dosis tópica: Aplicar una capa fina en la zona afectada 1-2 veces al día.

AINES

Son fármacos que inhiben la actividad de la ciclooxigenasa (COX), reduciendo la síntesis de prostaglandinas responsables de la inflamación, el dolor y la fiebre.

Su acción principal se realiza a nivel periférico, Pueden actuar a diversos niveles, pero el mecanismo de acción más importante consiste en la inhibición de la síntesis de prostaglandinas, su vía de administración:

-Oral ,inyectable, rectal, local.

Estos fármacos se pueden clasificar según: Su vida media, potencia antiinflamatoria, y su acción sobre las isoenzimas de cox. Los AINE`S tienen una rápida absorción gastrointestinal, su concentración máxima es de 2 a 4 horas, respecto a su excreción, se excretan mayormente mediante en a orina, y una pequeña parte puede ser excretada también por las heces.

PARACETAMOL

Es eficaz como analgésico y antipirético, pero no posee acciones antiinflamatorias, es seguro y bien tolerado en dosis terapéuticas y la sobredosis aguda produce lesión hepática muy grave. Este fármaco se absorbe rápidamente en el ID, y se metaboliza en el hígado, la velocidad de su absorción va a depender del vaciado gástrico. Puede llegar a causar reacciones adversas tales como:

- +Alergias
- +Toxicidad hemática
- +Intoxicación aguda con necrosis hepática grave

Ahora, al hablar de sus acciones farmacológicas, podemos decir que, tiene efecto analgésico y antipirético muy similar al de la aspirina, sin embargo, este fármaco no tiene efecto antiinflamatorio ya que posee una ligera actividad sobre la COX1 y la COX2, por otro lado, este medicamento es capaz de reducir la síntesis de prostaglandinas cuando hay una escasa concentración de peróxidos, como ocurre en el cerebro, de esta manera se alivia el dolor y la fiebre.

En dosis terapéuticas no produce efectos cardiovasculares, respiratorios ni afecta a la agregación plaquetaria.

Reacciones adversas:

- Alergias: Erupciones eritomasas (urticaria)
- Toxicidad hemática (leucopenia, trombocitopenia)
- Intoxicación aguda con necrosis hepática grave

DIPIRONA

La dipirona es un derivado de la pirazolona con propiedades analgésicas, antipiréticas y espasmolíticas. Es conocida por su efectividad en el manejo de dolores moderados a severos y fiebre refractaria a otros medicamentos, aunque su uso está restringido en varios países debido a preocupaciones de seguridad, como la agranulocitosis.

FARMACOCINÉTICA:

-Se absorbe por vía oral

-Se absorbe casi de forma completa, alcanzando una concentración máxima de 1-1,5 horas.

-La mayor biodisponibilidad que se alcanza tras su administración intramuscular y rectal es del 87% y 54% respectivamente.

-El metabolito 4-MAA se une a las proteínas plasmáticas en un 58%. El resto de metabolitos de metamizol se unen en la siguiente proporción: 4-amino antipirina (48%), 4 - formil amino antipirina (18%) y 4-acetil amino antipirina (14%).

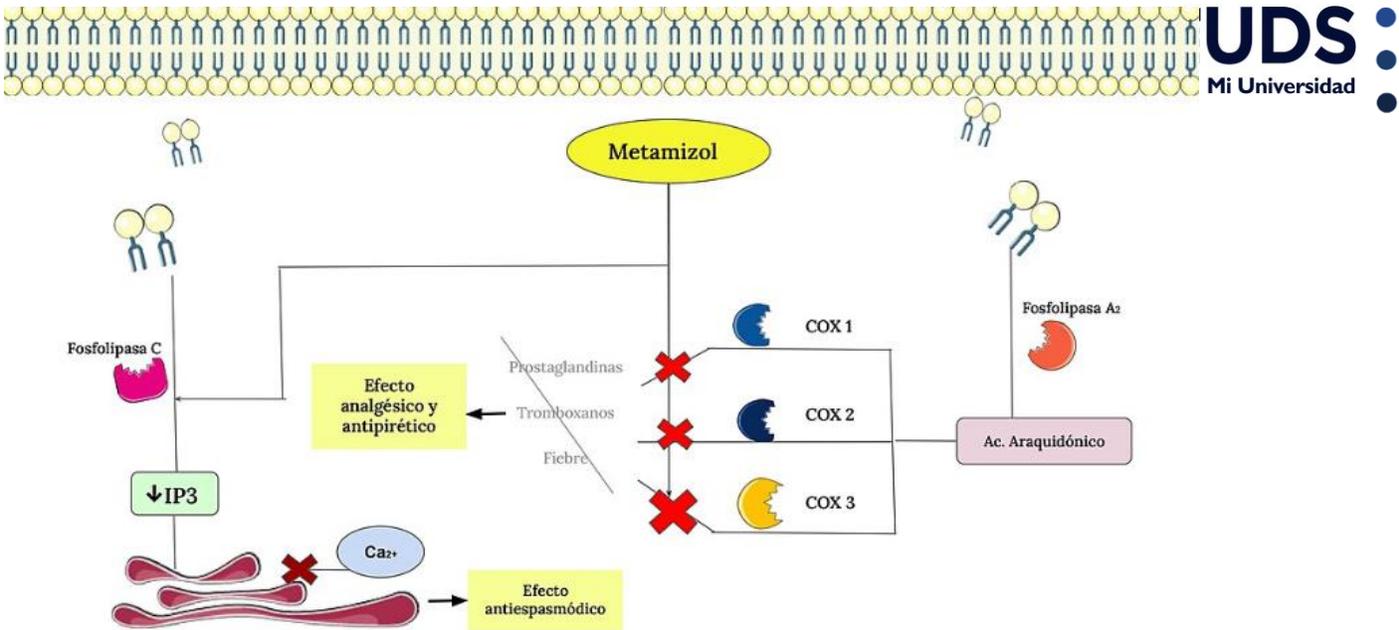
EXCRECIÓN

Para la eliminación de los metabolitos del Metamizol es necesaria la transformación a glucurónidos, los cuales tienen depuración predominantemente renal. La eliminación del metamizol y sus metabolitos se considera básica o alcalina debido a la excreción predominante a través de la orina.

La vida media de los metabolitos activos es de 2,5-4 horas y aumenta con la edad. Se excreta más del 90 % de la dosis en la orina al cabo de 7 días en personas sin patologías. Para el metabolito activo 4-MAA, la vida media de eliminación después de una dosis única por vía oral es de 2,7 horas; para los demás metabolitos principales, la vida media de eliminación es de 3-7 a 11 horas.

MECANISMO DE ACCIÓN

El metamizol es un inhibidor de las enzimas ciclooxigenasas claves en las síntesis de prostaglandinas, principalmente, a partir del ácido araquidónico. No se sabe muy bien el mecanismo de acción específico, pero se habla de que inhibe principalmente la COX 3 y en menor medida las enzimas COX 1 y COX 2.



EFFECTOS ADVERSOS

Dentro de los efectos adversos, podemos encontrar: reacciones inmunes graves como anafilaxia, asma, enfermedad del suero, vasculitis por hipersensibilidad, alveolitis, neumonitis, hepatitis y por último la agranulocitosis.

INDICACIONES

- Dolor agudo moderado a severo, como en dolores postoperatorios o cólicos.
- Fiebre resistente a otros tratamientos antipiréticos.
- Dolor asociado a enfermedades oncológicas o crónicas

DOSIS

Adultos: Entre 500 mg y 1 g, administrados por vía oral o intravenosa cada 6-8 horas, con un máximo de 4 g al día.

Niños: Dosis ajustada según el peso corporal, generalmente de 10-20 mg/kg por administración, con intervalos similares a los de los adultos.

NAPROXENO

El Naproxeno es un antiinflamatorio de uso común para controlar algunos padecimientos relacionados con las articulaciones, los músculos y algunos otros que provocan hinchazón, fiebre y dolor. Algunos de sus usos más comunes son:

- Dolores artríticos.
- Dolor posterior a cirugías.
- Lumbalgia o dolor de espalda.
- Dolor e inflamación por gota aguda.
- Dolores de cabeza leves.
- Molestias del resfriado común.
- Dolores musculares.
- Dolor menstrual.
- Fiebre.
- Dolor de muelas.

MECANISMO DE ACCION

El naproxeno actúa inhibiendo de manera reversible las enzimas ciclooxigenasa-1 (COX-1) y ciclooxigenasa-2 (COX-2). Estas enzimas son responsables de la conversión del ácido araquidónico en prostaglandinas, compuestos que median la inflamación, el dolor y la fiebre. Al reducir la síntesis de prostaglandinas:

- Disminuye la inflamación en los tejidos afectados.
- Reduce la sensibilidad de los receptores al dolor.
- Controla la elevación de la temperatura corporal inducida por pirogénos.

El naproxeno tiene una alta afinidad por ambas isoformas de la COX, aunque la inhibición de la COX-1 se asocia con efectos secundarios gastrointestinales.

EFECTOS ADVERSOS

Los efectos adversos del naproxeno están relacionados principalmente con su acción sobre la COX-1 y COX-2:

-**Efectos gastrointestinales:** Irritación de la mucosa, dolor abdominal, náuseas, úlceras y riesgo de hemorragia digestiva.

-**Efectos cardiovasculares:** Incremento del riesgo de eventos trombóticos, como infarto de miocardio y accidente cerebrovascular.

-**Efectos renales:** Reducción del flujo sanguíneo renal, insuficiencia renal aguda en pacientes predispuestos.

-**Otros:** Reacciones alérgicas, cefalea, mareos y, raramente, hepatotoxicidad

INDICACIONES

El naproxeno está indicado para una variedad de condiciones que implican dolor e inflamación:

-**Dolor agudo:** Dolor musculoesquelético, cefaleas, dolor dental.

-**Enfermedades reumáticas:** Osteoartritis, artritis reumatoide, espondilitis anquilosante.

-**Dismenorrea primaria:** Alivio del dolor menstrual.

-**Gota aguda:** Tratamiento del dolor e inflamación asociados a ataques agudos de gota.

-**Fiebre:** Como antipirético en casos seleccionados.

DOSIS

-**Adultos:** 250-500 mg cada 12 horas. La dosis máxima recomendada es de 1.5 g/día en situaciones agudas.

-**Niños (mayores de 2 años):** 10 mg/kg/día en dos dosis divididas, ajustadas según la condición clínica.

Farmacocinética y Farmacodinamia

Absorción: Alta biodisponibilidad tras administración oral, con concentraciones máximas alcanzadas en 1-2 horas.

Distribución: Alta unión a proteínas plasmáticas (>99%).

Metabolismo: Metabolizado principalmente en el hígado por conjugación con ácido glucurónico.

Excreción: Eliminado mayoritariamente por la orina en forma de metabolitos inactivos.

Vida media: Aproximadamente 12-17 horas, lo que permite una dosificación de dos veces al día.

DICLOFENACO

El diclofenaco es un fármaco antiinflamatorio no esteroideo (AINE) utilizado principalmente para tratar el dolor y la inflamación asociados con enfermedades musculoesqueléticas, artritis reumatoide, osteoartritis, y otras condiciones inflamatorias agudas y crónicas. Pertenece al grupo de los derivados del ácido acético.

Sus efectos adversos más comunes son los gastrointestinales.

MECANISMO DE ACCION:

El diclofenaco actúa inhibiendo la actividad de las enzimas ciclooxigenasas (COX-1 y COX-2), responsables de la síntesis de prostaglandinas. Las prostaglandinas son mediadores inflamatorios que contribuyen al dolor, la fiebre y la inflamación. Su acción se centra principalmente en COX-2, lo que explica su eficacia antiinflamatoria y analgésica, aunque también afecta COX-1, lo que puede derivar en efectos adversos gastrointestinales,

INDICACIONES

-Tratamiento del dolor agudo y crónico.

-Enfermedades inflamatorias como artritis reumatoide, osteoartritis, espondilitis anquilosante.

-Dolor postoperatorio o posquirúrgico.

-Dismenorrea primaria.

-Crisis de migraña.

Dosis

Oral: 50-150 mg diarios, divididos en 2-3 dosis.

Intramuscular: 75 mg como dosis única o dos veces al día, por un máximo de 2 días.

Tópica: 1-4% en forma de gel, aplicado en el área afectada 3-4 veces al día.

Rectal: Supositorios de 50-100 mg, según necesidad.

ASPIRINA

La aspirina, también conocida como ácido acetilsalicílico, es un fármaco antiinflamatorio no esteroideo (AINE) que pertenece al grupo de los salicilatos. Se utiliza ampliamente por sus propiedades analgésicas, antipiréticas, antiinflamatorias y antiagregantes plaquetarias.

MECANISMO DE ACCION

La aspirina actúa mediante la inhibición irreversible de las enzimas ciclooxigenasas (COX-1 y COX-2), responsables de la conversión del ácido araquidónico en prostaglandinas y tromboxanos. Esta acción tiene varios efectos:

-Propiedades analgésicas y antiinflamatorias: Reducción de prostaglandinas responsables de la inflamación y el dolor.

-Efecto antipirético: Disminución de prostaglandinas en el hipotálamo, lo que regula la temperatura corporal.

-Acción antiagregante plaquetaria: Inhibe la producción de tromboxano A₂ en las plaquetas, reduciendo la formación de coágulos.

EFECTOS ADVERSOS

El uso de aspirina puede estar asociado con varios efectos adversos, que varían según la dosis y la duración del tratamiento:

- Gastrointestinales:** Irritación de la mucosa, gastritis, úlceras pépticas y hemorragia gastrointestinal.
- Hematológicos:** Aumento del tiempo de sangrado.
- Renales:** Reducción del flujo sanguíneo renal y nefrotoxicidad en pacientes predispuestos.
- Reacciones alérgicas:** Urticaria, angioedema y, en casos graves, broncoespasmo.
- Síndrome de Reye

INDICACIONES

La aspirina tiene diversas indicaciones terapéuticas:

- Dolor y fiebre:** Dolor leve a moderado y fiebre.
- Enfermedades inflamatorias:** Artritis reumatoide, osteoartritis.
- Prevención cardiovascular:** Dosis bajas para reducir el riesgo de infarto de miocardio, accidente cerebrovascular y otras complicaciones trombóticas.
- Enfermedades reumatológicas:** Fiebre reumática aguda.

DOSIS

Las dosis de aspirina dependen de la indicación terapéutica:

- Analgesia y antipirética:** 325-650 mg cada 4-6 horas (máximo 4 g/día).
- Antiagregante plaquetario:** 75-325 mg al día.
- Antiinflamatorio:** 3-6 g/día en dosis divididas.

CONTRAINDICACIONES

- Hipersensibilidad a salicilatos.
- Historia de úlceras gastrointestinales.
- Hemofilia u otros trastornos hemorrágicos.

MELOXICAM

El meloxicam es un antiinflamatorio no esteroideo (AINE) de la clase de los oxicams. Se utiliza principalmente para tratar el dolor e inflamación asociados con enfermedades reumáticas, como la osteoartritis y la artritis reumatoide. Es conocido por tener una selectividad preferencial hacia la enzima ciclooxigenasa-2 (COX-2) en comparación con otros AINEs tradicionales, lo que puede reducir el riesgo de ciertos efectos adversos gastrointestinales.

MECANISMO DE ACCIÓN

El meloxicam actúa inhibiendo la actividad de las enzimas COX-1 y COX-2, que son fundamentales en la síntesis de prostaglandinas. Estas moléculas participan en la mediación del dolor, la inflamación y la fiebre. Al inhibir preferentemente COX-2, el meloxicam conserva en mayor medida la función protectora de COX-1 en la mucosa gástrica y la agregación plaquetaria, aunque no elimina completamente el riesgo de daño gastrointestinal.

INDICACIONES

Artritis reumatoide: Alivio del dolor, la inflamación y la rigidez.

Osteoartritis: Tratamiento del dolor y la inflamación en esta enfermedad degenerativa.

Espondilitis anquilosante: Manejo del dolor y la inflamación.

DOSIS

Adultos:

Osteoartritis: 7.5 mg al día, ajustable hasta 15 mg según la respuesta clínica.

Artritis reumatoide: Inicialmente 7.5 mg, incrementable a 15 mg/día.

Población pediátrica: Aprobado en algunos países para mayores de 2 años, con dosis ajustadas según el peso corporal.

La dosis máxima diaria no debe exceder los 15 mg para minimizar riesgos de toxicidad.

EFFECTOS ADVERSOS

Gastrointestinales: Náuseas, vómitos, dispepsia, úlceras gástricas, y en casos graves, hemorragia gastrointestinal.

Cardiovasculares: Riesgo aumentado de eventos trombóticos, como infarto de miocardio y accidente cerebrovascular.

Renales: Reducción de la función renal, especialmente en pacientes con insuficiencia preexistente.

Otros: Reacciones alérgicas, cefaleas, mareos, y en casos raros, hepatotoxicidad.

Contraindicaciones: Hipersensibilidad al meloxicam, úlcera péptica activa o sangrado gastrointestinal, y asma inducida por AINEs.

REFERENCIA BIBLIOGRAFICA

Goodman& Gilman; Las bases farmacológicas de la terapéutica,13^a edición.