



Mi Universidad

Ensayo

Dannia Gissela Díaz Díaz

Antiinflamatorios

4to Parcial

Farmacología

Doctor: Dagoberto Silvestre Esteban

Medicina Humana

3er Semestre, Grupo "A"

ANTIINFLAMATORIOS ESTEROIDEOS Y NO ESTEROIDEOS:

Comenzando con los fármacos esteroideos, podemos decir que estos son fármacos antiinflamatorios inmunosupresores, debido a los mediadores químicos, que potencian y desencadenan el proceso inflamatorio. Los corticoesteroides son hormonas sintéticas o naturales, derivados del córtex suprarrenal, estos imitan los efectos que producen las glándulas suprarrenales.

Estos tienen cuatro funciones fundamentales, antiinflamatorios, al inhibir los mediadores químicos; inmunosupresores, metabólicas, además de efectos secundarios sistémicos

Esta inhibición se puede dar al momento de bloquear la fosfolipasa-A-2, esta es una enzima plasmática, conocida como la diana terapéutica de los antiinflamatorios esteroideos, esta a su vez evita que se vaya a la COX-1 y a la COX-2, es entonces en donde se comienzan a producir prostaglandinas, antes de eso cabe recalcar que el ácido araquidónico, es el precursor de estas mismas, es metabolizado por el COX-1-2-3, ahora bien, las enzimas que son esenciales en el metabolismo de este ácido son la ciclooxigenasas (COX), y las lipooxigenasas (LOX), dichas enzimas son responsables en la síntesis de los mediadores inflamatorios como las prostaglandinas (PGE₂) estos generan vasodilatación, quimiotaxis y edema, las prostaciclina (P_g1) que de igual manera genera vasodilatación quimiotaxis e inflamación, los tromboxanos (TXA₂), que estos generan vasoconstricción y al mismo tiempo aumentan la agregación plaquetaria.

Por otro lado, los LOX, convierten el ácido araquidónico en leucotrienos, estos son moléculas fundamentales en el proceso de inflamación. Mientras que las lipoxinas son moléculas lipídicas, derivadas del ácido araquidónico, las cuales desempeñan un papel muy importante en la resolución de la inflamación. Estos a diferencia de la COX, son antiinflamatorias por lo tanto ayudan a limitar la inflamación y a restaurar la homeostasis.

Dentro de este tipo de antiinflamatorios, tenemos diferentes tipos de fármacos, dentro de los cuales destaca la CORTISONA, este es de origen natural y es derivado de los glucocorticoides, este es un profármaco, el cual se convierte en hidrocortisona en el hígado, gracias a la enzima: 11b-hidroxiesteroide-deshidrogenasa-tipo1, los efectos secundarios que se pueden llegar a presentar dependen de la cantidad de dosis ingerida o aplicada, así también como de la duración del tratamiento, por ende también influye mucho la vía de administración, la cortisona se usa principalmente en condiciones inmunológica e inflamatorias, por ejemplo es muy usada en alergias graves, enfermedades cutáneas, insuficiencia renal, o incluso en enfermedades pulmonares. Ahora, la dosis va depender del tipo de enfermedad que desea tratarse, y claro también de la gravedad de esta misma, así como de la vía de administración. Si es por medio de vía oral: la dosis recomendada es de 25-300mg/día, si es vía intramuscular, es de 25-50mg, cada 12 a 24 horas.

Así también encontramos la prednisona, que este es un glucocorticoide sintético, que se deriva prácticamente de la cortisona. De manera más detallada, la prednisona es una prohormona que se convierte en su forma activa en el hígado, se metaboliza rápidamente

gracias a la enzima 11b-hidroxiesteroide-deshidrogenasa-tipo1 en donde se transforma en “Prednisolona”. Su vida media de eliminación es de aproximadamente 2-3 horas.

Mientras que la BETAMETASONA, de igual manera es un glucocorticoide sintético, que es un derivado de la prednisolona, solo que este tiene alta potencia antiinflamatoria y una baja actividad mineralocorticoide, a diferencia de los fármacos antes mencionados, el metabolismo de la betametasona es lento, por ende, es de larga duración, su vida media es entonces de 36-54 horas. Se emplea para tratar la artritis reumatoide localizada y la para la maduración pulmonar fetal para mujeres que tiene riesgo de parto prematuro. La dosis oral en adultos es de 0.5-9mg/día. Mientras que la vía intramuscular es de 4-12mg/1-2 veces por semana. Para la maduración fetal pulmonar son dos dosis de 12mg, cada 24 horas.

Ahora enfocándonos en los antiinflamatorios no esteroideos, son un grupo de fármacos heterogéneos que busca inhibir la ciclooxigenasa, por lo regular actúan en el sitio de la lesión, evitan la síntesis de las prostaglandinas estos cumplen cuatro funciones de vital importancia, es decir, los AINES, poseen propiedades analgésicas, antipiréticas, ya que puede disminuir rápidamente la fiebre; antiinflamatorias, por lo tanto se prescriben como el medicamento de primera línea para tratar cuadros artríticos, así también ayuda a producir anticuerpos y a liberar histamina; antiagregante plaquetaria, aunque si se usan por un largo período de tiempo, pueden llegar a causar ciertos problemas en el organismo como gastritis, úlceras, complicaciones o falla renales; puede causar múltiples efectos secundarios a nivel del sistema digestivo, como dolor abdominal, náuseas, diarrea, incluso puede llegar a presentarse úlceras gástricas; también se ven afectados los riñones, causando disfunción renal, incluso puede verse involucrado el Sistema Nervioso central, causando mareos o cefalea.

Por otro lado, el mecanismo de acción de los AINES, comienza básicamente con los fosfolípidos, estos son precursores para iniciar la vía de la ciclooxigenasa, posteriormente los fosfolípidos junto con la fosfolipasa 2, forman el ácido araquidónico, el cual activa directamente a la COX1, esta entonces va a dividir o separar los endoperoxidos cíclicos, como los tromboxanos, las prostaglandinas y las prostaciclina, haciendo más énfasis en estos últimos, podemos recalcar que los tromboxanos, especialmente los TXA₂, estos se encargan de elevar la agregación plaquetaria, la vasoconstricción, , ahora bien, las prostaglandinas, la PGE₁, aumenta la vasodilatación, mantiene abierto el ducto arterioso; la PGE₂, aumenta el tono uterino, por otro lado, las prostaciclina disminuyen la agregación plaquetaria, aumentan la vasodilatación pero está directamente a nivel renal, gracias a esta también es posible que exista cierta protección gástrica, renal y cardiovascular, es decir que al momento en que un paciente ingiera cierto medicamento, no se verá tan afectada la mucosa gástrica, ya que se genera una capa que busca proteger la pared del estómago, aumentando de esta forma el flujo sanguíneo. La COX 2 ayuda a aumentar de igual manera la agregación plaquetaria, debido a esto se presentan eventos protrombóticos, entre los fármacos selectivos a la COX2 encontramos Celecoxib, Meloxicam, Etodolaco, Aspirina y Paracetamol Mientras que la COX 3 favorece la aparición de la anafilaxia, por lo que

umenta el riesgo de broncoconstricción. Los AINES, se usan básicamente para tratar la fiebre, mejoran el dolor y la inflamación, por ende, se usan para tratar múltiples enfermedades inflamatorias; estos no son recomendables en mujeres embarazadas. No obstante, los antiinflamatorios no esteroideos que destacan son, los derivados de ácido salicílico, ¿cómo es el metabolismo de estos?, bueno pues una vez que estos llegan a la circulación sistémica, este se desacetila por acción de las enterasas, produciendo entonces el ácido salicílico, mismo que es principal metabolito responsable de todos los efectos del fármaco. Estos pueden llegar a causar efectos adversos gastrointestinales y renales, o alergia a algún componente. El AAS, busca inhibir a la COX1 y COX2, bloqueando la producción de tromboxano A2, ésta molécula promueve la agregación plaquetaria y la vasoconstricción a través de la acetilación, causando de esta forma una disminución en la síntesis de las prostaglandinas; ahora la dosis recomendada como analgésica y antipirética es de 300-600mg cada 4-6 horas, se inhibe la COX 1 y la COX 2, pero de manera más selectiva, es decir solo en tejidos periféricos y en el sistema nervioso central, sin embargo, a dosis altas de 3-4mg al día, posee un efecto antiinflamatorio, por lo que inhibe de manera más eficaz las COX2; se usa principalmente para prevenir el infarto agudo al miocardio y el síndrome coronario agudo, así como enfermedades arteriales periféricas, pero se usa principalmente para tratar dolor muscular, cefalea, para reducir la fiebre, o incluso ayuda a tratar la artritis reumatoide.

Entre los derivados de las pirazolonas, entre los más relevantes encontramos Metamizol, propi y Fenilbutazona, estos pueden llegar a causar cierta toxicidad gástrica, agregación plaquetaria, especialmente el metamizol a dosis altas puede causar agranulocitosis.

Es importante que conozcamos los derivados de ácido Propiónico, ya que son fármacos muy utilizados, entre ellos destaca el Ibuprofeno, que inhibe las síntesis de prostaglandinas, su dosis máxima es de 2400mg, se usa para tratar dolor, como cefalea, dolor muscular, artritis y claro, también ayuda a aliviar los síntomas de la fiebre. Mientras tanto el naproxeno, inhibe la actividad enzimática de la ciclooxigenasa, su vida media es de aproximadamente 14 horas, tiene una potencia más alta que el Ibuprofeno, se usa principalmente para tratar síntomas de la enfermedad de gota, su dosis máxima es de 1500mg al día.

El Diclofenaco, es un derivado del ácido fenilacético inhibe eficazmente a la COX2, no es recomendable tomar este fármaco más de 5 días ya que puede ocasionar múltiples daños en el organismo, se usa principalmente para tratar el dolor agudo y crónico, enfermedades reumáticas. Para aliviar inflamación y fiebre, su dosis recomendada en vía oral, es de 150mg al día. Puede ocasionar, muchos daños gastrointestinales, cardiovasculares y renales.

REFERENCIAS BIBLIOGRÁFICAS:

1. Laurencel L. (2018) Las bases farmacológicas de la terapéutica. McGrawHillEducación. 13ava edición. 1441pág.