



Mi Universidad

Diego Adarcilio Cruz Reyes

Cuarto Parcial

Farmacología

Dr. Dagoberto Esteban Silvestre

Medicina Humana

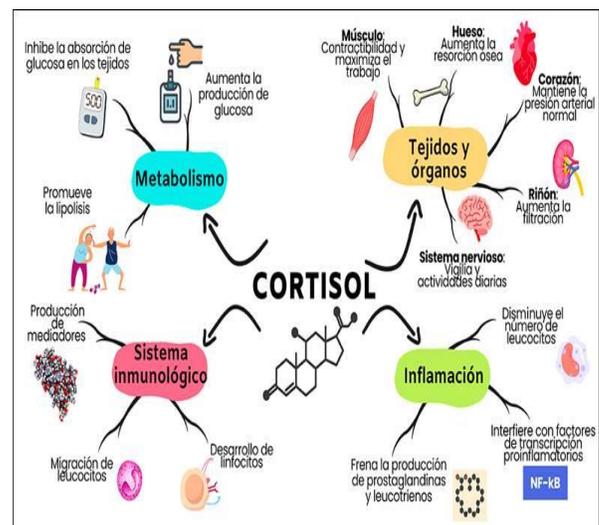
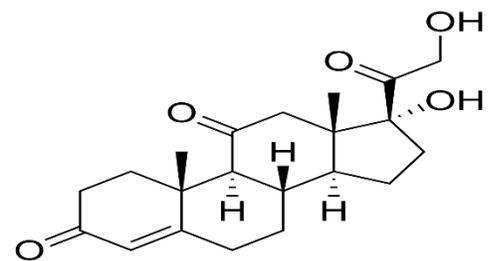
Tercer Semestre

Comitán De Domínguez Chiapas 13 De Diciembre del 2024

En este resumen haremos un repaso de la ya visto durante el parcial analizando varios aspectos, como mecanismos de acción, clasificaciones, efectos adversos, indicaciones y dosis de los fármacos ya analizados en este caso empezaremos hablando de los fármacos no esteroideos recordemos que estos son medicamentos de uso común muy eficaces para diferentes afecciones médicas, se administran principalmente por sus potentes efectos antiinflamatorios e inmunosupresores. Están disponibles en varias formulaciones y pueden administrarse por diferentes vías para el tratamiento local o sistémico y si bien los glucocorticoides suelen atribuírseles dos mecanismos: uno genómico, lento, con latencia y persistencia del efecto por horas o meses, y otro no genómico, rápido, de inicio y persistencia fugaces. Si hablamos de los genómicos hablamos de la transcripción génica pertenecientes a la supe familia de receptores nucleares y el segundo a moléculas diferentes poco caracterizadas.

Si hablamos como tal de los fármacos que hablemos en esta clasificación son los que utilizaremos con mayor frecuencia en su día a día, uno de los principales.

- **Es el cortisol;** Es una sustancia natural que pertenece a la clase de los corticosteroides: el cortisol (también conocido como hidrocortisona) y la corticosterona son liberados en la sangre por las glándulas suprarrenales junto con la adrenalina cuando nos encontramos en una situación estresante.
- **Estructura física;** es una molécula lipídica. Su paso por vía sanguínea requiere una proteína transportadora. El transportador clásico de cortisol es la globulina transportadora (GBP, globulin binding protein), también denominada transcortina.
- **Mecanismo de acción:** en este debemos entender un par de cosas como por ejemplo;
 - Se da a través de la transcripción, posterior a;
 - La inhibición de la cascada araquidónica
 - Inhibe la formación de cox2. Presentes en el proceso antiinflamatorio
 - Inhibe la fosfolipasa A2
- **Este esteroide se clásica como de baja potencia.**



- **Efectos adversos son:** Los corticoides que se toman por vía oral afectan todo el cuerpo. Por este motivo, son el tipo de corticoide que tiene más probabilidades de causar efectos secundarios. Los efectos secundarios dependen de la dosis de medicamento que recibas y pueden incluir los siguientes:
 - Acumulación de líquido, que causa hinchazón en la parte inferior de las piernas.
 - Presión arterial alta.
 - Problemas de cambios en el estado de ánimo, la memoria, la conducta y otros efectos psicológicos, como confusión o delirio.
 - Malestar estomacal.

- Aumento de peso en el abdomen, la cara y la parte posterior del cuello.

Si tomas corticoides por **vía oral** durante un período prolongado, podrías tener lo siguiente:

- Problemas en los ojos, como glaucoma o cataratas.
- Cara más redondeada, que a veces se conoce como cara de luna llena.
- Niveles altos de glucosa en la sangre, que pueden desencadenar o empeorar la diabetes.
- Más riesgo de contraer infecciones, en especial con microorganismos bacterianos, virales y fúngicos comunes.
- Fracturas y afinamiento de los huesos, lo que se conoce como osteoporosis.
- Fatiga, pérdida del apetito, náuseas y debilidad muscular.
- Piel fina, moretones y cicatrización más lenta de las heridas.

Efectos secundarios de los corticoides inhalados

Cuando se usan corticoides que se inhalan, parte del medicamento puede depositarse en la boca y la garganta en lugar de llegar a los pulmones. Esto puede causar lo siguiente:

- Infección por hongos en la boca, lo que se conoce como candidiasis bucal.
- Ronquera.

Podrías evitar la irritación de la boca y la garganta si haces gárgaras y te enjuagas la boca con agua después de cada inhalación de corticoide. Asegúrate de no tragar el agua de enjuague. Algunos investigadores consideran que los medicamentos corticoides inhalados pueden disminuir las tasas de crecimiento en los niños que los usan para tratar el asma.

Efectos secundarios de los corticoides tópicos

El uso de corticoides tópicos puede derivar en piel delgada, lesiones en la piel y acné.

Efectos secundarios de los corticoides inyectables

Los corticoides inyectables pueden causar efectos secundarios temporales cerca del lugar de la inyección. Algunos de estos son adelgazamiento de la piel, pérdida de color en la piel y dolor intenso, el cual se conoce como reacción eritematosa a la inyección. Otros síntomas pueden ser enrojecimiento facial, insomnio y niveles altos de glucosa en la sangre

Indicaciones: Alivio de los dolores articulatorios además de usarse en condiciones inflamatorias e inmunológicas.

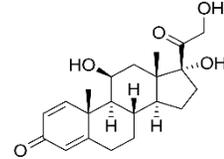
Dosis. La dosis varía según la condición tratada, vía de administración y respuesta del paciente.

- **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



Otro de los fármacos que vemos durante este parcial es **prednisona**:

Que este es un corticoide de síntesis clasificado como de acción intermedia, con pequeña actividad mineralocorticoide, y por tanto con acción antiinflamatoria e inmunosupresora.



Mecanismo de acción: Ejerce su mecanismo de acción a través de la inhibición de la síntesis de prostaglandinas y leucotrienos, sustancias que median en los procesos vasculares y celulares de la inflamación, así como en la respuesta inmunológica. Esto se traduce en que reducen la vasodilatación, disminuyen el exudado de fluido, la actividad leucocitaria, la agregación y desgranulación de los neutrófilos, la liberación de enzimas hidrolíticos por los lisosomas, la producción de radicales libres de tipo superóxido y el número de vasos sanguíneos (con menor fibrosis) en los procesos crónicos. Las dos acciones se corresponden con un mismo mecanismo que consiste en la inhibición de síntesis de fosfolipasa A2, enzima que libera los ácidos grasos poliinsaturados precursores de las prostaglandinas y leucotrienos.

La prednisona se **clasifica** como un fármaco de duración intermedia.

Efectos adversos;

- Endocrinos: síndrome de Cushing, hirsutismo, obesidad troncular, retraso de crecimiento, reducción de la tolerancia a la glucosa.
- Dermatológicos: acné, estrías.
- Musculoesquelético: atrofia y debilidad muscular, osteoporosis.
- Oftalmología: glaucoma y cataratas.
- Sistema nervioso central: depresión, euforia, aumento de apetito, Pseudotumor cerebri, convulsiones y vértigo.
- Digestivo: úlceras, hemorragias gastrointestinales.
- Cardiovascular: HTA.
- La administración de dosis supra terapéuticas puede provocar excitación, ansiedad o depresión

Indicaciones: Para tratamiento de enfermedades Inflammatorias y autoinmunes en adultos y niños ≥ 1 mes: asma bronquial, alteraciones alérgicas e inflamatorias, artritis reumatoide y otras colagenopatías.

Farmacología clínica y consejos :Se usa en combinación con una variedad de agentes quimioterapéuticos

- Usado para efectos citotóxicos primarios, más alivio del dolor y náuseas y estimulación del apetito
- Consejo: no se usa en la leucemia mielógena aguda o crónica

Farmacología clínica y consejos

Hidrocortisona es el equivalente sintético de cortisol

- La dosis oral de hidrocortisona es 20-30 mg preferentemente como dosis divididas
- Aunque los glucocorticoides no fisiológicos son algunas veces usados, la hidrocortisona o la cortisona se prefiere para terapia de reemplazo

- Consejo: dos tercios de dosis en la mañana, un tercio de dosis en la noche

Dosis:

Dosis depende de la enfermedad a tratar, la gravedad y la respuesta del paciente. Debe considerarse siempre que sea posible la terapia en días alternos cuando tenga que instaurarse en terapias a largo plazo. La interrupción del tratamiento a largo plazo requiere la retirada gradual de reducir la dosis.

Dosificación en niños (dosis diarias) según ficha técnica:

- Tratamiento con dosis altas: 2-3 mg prednisona/kg peso corporal.
- Tratamiento con dosis intermedias: 1 mg prednisona/kg peso corporal.
- Dosis de mantenimiento: 0,25 mg prednisona/kg peso corporal.
- Dosis general inicial: Niños: 0,5-2 mg//kg peso corporal/día.
- Dosis general de mantenimiento: Niños: 0,25-0,5 mg//kg peso corporal/día. En caso de uso como antiinflamatorio e inmunosupresor en niños, se recomienda de 0,05 a 2 mg/kg/día, en varias tomas.

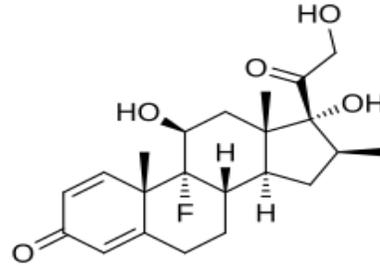


La **Betametasona** es uno de los últimos últimos fármacos que vemos en esta clasificación de los fármacos antiinflamatorios, que iniciaremos con la Betametasona que este glucocorticoide sintético de acción prolongada con propiedades antiinflamatorias e inmunosupresoras que carece de propiedades mineralocorticoides prolongadas. Es el esteroide antiinflamatorio más potente. Sus efectos antiinflamatorios e inmunosupresores aparecen en 1-3 h y persisten de 3 a 4 días, la betametasona se absorbe bien por vía oral, y cuando se aplica tópicamente puede absorberse y pasar al plasma en cantidades importantes.

Mecanismo de acción: Actúa estimulando o reprimiendo la transcripción génica de ARNm específicos que codifican la síntesis de determinadas proteínas en los órganos blancos, inhibe las manifestaciones de inflamación, disminuyen la respuesta inmunológica.

Farmacocinética;

- Vida media 6,5 hrs.
- Unión a proteínas plasmáticas 0,64
- Biodisponibilidad No Aplica
- Metabolismo Hepático
- Excreción Renal



Efectos adversos;

- En niños sometidos a tratamiento tópico con corticosteroides se han notificado supresión del eje hipotálamo-hipófisis-suprarrenal, síndrome de Cushing, retraso del desarrollo longitudinal y de la ganancia de peso e hipertensión intracraneal. Las manifestaciones de la supresión suprarrenal en el niño incluyen unos niveles plasmáticos de cortisol bajos y la ausencia de respuesta a la estimulación con ACTH. Las manifestaciones de hipertensión intracraneal comprenden protrusión de fontanelas, cefalea y papiledema bilateral.
- Reacciones de hipersensibilidad y decoloración de la piel. En ocasiones irritación (quemazón y prurito).
- También se han notificado: atrofia, sequedad, agrietamiento, miliaria, eritema en el lugar de aplicación, hematomas, foliculitis, dermatitis perioral, estrías cutáneas
- Puede producir trastornos síquicos o agravar preexistentes (inestabilidad emocional, cambios de humor, euforia, agitación y tendencias psicóticas preexistentes).
- Administración intranasal anosmia, irritación:
- Elevación de la glucemia y a veces con cetosa (los corticoides disminuyen la tolerancia a los glúcidos). Adaptar la dosis del antidiabético durante el tratamiento con corticoides y después de su retirada si procede.

Indicaciones

- Inyección intramuscular en afecciones alérgicas, dermatológicas, reumáticas y en otras afecciones que responden a los corticosteroides sistémicos.
- Inyección directa en los tejidos afectados en bursitis y en trastornos inflamatorios asociados a tendones, tales como tenosinovitis, y en trastornos inflamatorios del músculo, tales como fibrosis y miositis.
- Inyección intraarticular y periarticular en artritis reumatoide y artrosis.
- Inyección intralesional en diversas afecciones dermatológicas y en ciertos trastornos inflamatorios y quísticos del pie.
- Pomada (**A**): tratamiento local de las manifestaciones inflamatorias y pruriginosas de las dermatosis que responden a los corticosteroides (dermatitis atópica, neurodermatitis, dermatitis de contacto, psoriasis, dermatitis seborreica, eccema numular y dishidrótico) en mayores de 12 años.
- Cuando se sospecha sobreinfección bacteriana se utilizan presentaciones tópicas con antibióticos, principalmente contra *S. aureus*.

- **Farmacología clínica y consejos tópicos**

Los esteroides fluorinados tienen mejor penetración en la piel que la hidrocortisona

- Los efectos se intensifican con el vendaje oclusivo
- Eventos locales adversos: atrofia, estrías y exacerbación de las enfermedades de la piel
- Consejo: los cosméticos para aclarar la piel incluyen corticosteroides y pueden producir graves eventos adversos

Dosis;

Dosis oral (adultos):

- Rango: 0.5-9 mg/día, según la enfermedad y su gravedad.
- Ejemplo: Para lupus o artritis severa, iniciar con 1-2 mg/día, ajustando según respuesta.

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

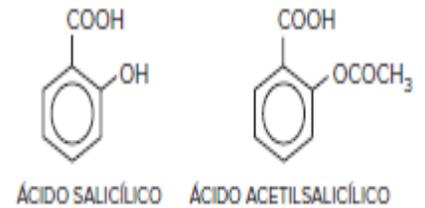


Hablando del otro grupo que son los antiinflamatorios no esteroideos estos que también son llamados AINE (antiinflamatorios no esteroideos) son algunos de los analgésicos que más se administran en adultos. También son un tratamiento habitual para problemas de salud, como la artritis (artritis reumatoide, osteoartritis, entre otras) y enfermedades sistémicas del tejido conectivo. Los AINE pueden disminuir los síntomas de inflamación, como fiebre, hinchazón y enrojecimiento.

Los AINE tradicionales incluyen aspirina, ibuprofeno (Advil, Motrin, etc.), naproxeno (p. ej., Aleve) y muchos otros medicamentos genéricos y de marca. Celecoxib (Celebrex) pertenece a una clase más nueva de AINE, llamada "inhibidor de COX-2", y está diseñado para evitar el malestar estomacal.

Y empezando con el **ácido acetilsalicílico (aspirina)**;

Los salicilatos incluyen ácido acetilsalicílico, ácido salicílico, salicilato de metilo, diflunisal, salsalato (fármaco comercializado sin aprobación en Estados Unidos), olsalazina, sulfalazina, balsalazida, trisalicilato de colina y magnesio (fármaco comercializado sin aprobación en Estados Unidos), el silicato de magnesio, mesalamina y salicilamina (derivado carboxamida del ácido salicílico contenido como un ingrediente en algunas combinaciones de analgésicos OTC).



Mecanismo de acción: Los efectos del ácido acetilsalicílico son causados en gran parte por la capacidad de esta para acetilar proteínas, como se describe en Inhibición irreversible de la ciclooxigenasa por ácido acetilsalicílico. Otros salicilatos por lo general actúan en virtud de su ácido salicílico, que es un inhibidor relativamente débil de las enzimas COX purificadas. El ácido salicílico también puede suprimir la regulación inflamatoria de la COX-2 al interferir con la unión del factor de transcripción al promotor de COX-2.

ADME:

- 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

Efectos adversos;

- Raras veces: Hemorragia gástrica, hipersensibilidad, trombocitopenia.
- A sobredosis: Tinnitus, vértigo, náuseas, vómito, dolor epigástrico, hipoacusia, ictericia, acufenos y daño renal.

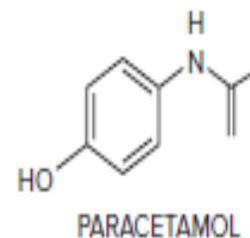
Indicaciones: Está indicado como antipirético, antiinflama-to-rio y como antiagregante plaquetario. También es útil para artritis reuma-toide, osteoartritis, espondilitis anquilo-sante y fiebre reumática aguda.

Dosis:

- Antiplaquetaria, 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



Paracetamol: El paracetamol (N-acetil-p-aminofenol) es el metabolito activo de la fenacetina. El paracetamol eleva el umbral a estímulos de dolor, con lo cual ejerce un efecto analgésico contra el dolor debido a una variedad de etiologías. También está disponible en combinados de dosis fijas que contienen analgésicos narcóticos y no narcóticos (incluyendo ácido acetilsalicílico y otros salicilatos), barbitúricos, cafeína, remedios para la cefalea vascular, somníferos, remedios para el dolor de muelas, antihistámicos, antitusígenos, descongestionantes, expectorantes, preparaciones para el resfriado y la gripe y tratamientos para la garganta irritada



Mecanismo de acción; tiene efectos analgésicos y antipiréticos similares a los del ácido acetilsalicílico, pero sólo efectos antiinflamatorios débiles. Es un inhibidor de COX no selectivo, que actúa en el sitio de peróxido de la enzima y se distingue por ello entre los NSAID. La presencia de altas concentraciones de peróxidos, como ocurre en los sitios de inflamación, reduce su actividad inhibidora de la COX

ADME;

- Maximo C_p , 30-60 min
- Unión a proteínas, 20-50%
- Metabolitos, glucuronidos
- (60%); sulfatos (35%)
- $t_{1/2}$, 2 h

Efectos adversos; ha sido asociado al desarrollo de neutropenia, agranulocitopenia, pancitopenia y leucopenia. De manera ocasional, también se han reportado náusea, vómito, dolor epigástrico, somnolencia, ictericia, anemia hemolítica, daño renal y hepático, neumonitis, erupciones cutáneas y metahemoglobinemia. El uso prolongado de dosis elevadas de paracetamol puede ocasionar daño renal y se han reportado casos de daño hepático y renal en alcohólicos que estaban tomando dosis terapéuticas de paracetamol.

La administración de dosis elevadas puede causar daño hepático e incluso necrosis hepática.

Indicaciones; Es un analgésico y antipirético eficaz para el control del dolor leve o moderado causado por afecciones articulares, otalgias, cefaleas, dolor odontogénico, neuralgias, procedimientos quirúrgicos menores etc. También es eficaz para el tratamiento de la fiebre, como la originada por infecciones virales, la fiebre pos-vacunación, etcétera.

Dosis; 650 mg o menos cada 4 h (máximo de 4 000 mg/24 h)



Derivados de ácido acético

Diclofenaco;

El diclofenaco, un derivado del ácido fenilacético, se encuentra entre los NSAID más utilizados en Europa. El diclofenaco es analgésico, antipirético y actúa como antiinflamatorio. Su potencia es mucho mayor que la de otros NSAID. Aunque no se desarrolló para ser un fármaco selectivo para la COX-2, la selectividad del diclofenaco para esta se asemeja a la del celecoxib.

Mecanismo de acción; Mecanismo de acción principal relacionado con la inhibición de la síntesis de prostaglandinas, por inactivación reversible, de la enzima ciclooxigenasa.

ADME;

- 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-hidroxiatos; conjugación a acilglucurónidos
- t_{1/2}, 2-4 h (adultos);
- 23-75 h (bebés prematuros);
- 0.9-2.3 h (niños)

Efectos adversos; El ibuprofeno se tolera mejor que el ácido acetilsalicílico y la indometacina y se ha utilizado en pacientes con una historia de intolerancia GI a otros NSAID, sin embargo, de 5 a 15% de los pacientes experimentan efectos secundarios GI:

Los efectos adversos menos frecuentes del ibuprofeno incluyen.

Erupciones (3-9%),

Trombocitopenia (<1%)

Cefalea (1-3%),

Mareos (3-9%),

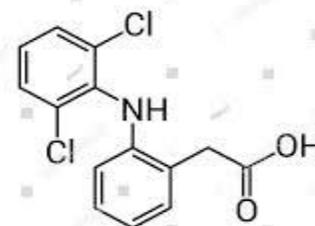
Visión borrosa (<1%)

Ambliopía tóxica (<1%),

Retención de líquidos (1-3%) y edema (1-3%).

Los pacientes que desarrollan trastornos oculares no deben continuar el uso de ibuprofeno y deben someterse a una evaluación oftálmica. En ocasiones puede usarse ibuprofeno en mujeres embarazadas; sin embargo, las preocupaciones van dirigidas a los efectos del tercer trimestre, incluida la demora del parto.

Diclofenac | C₁₄H₁₁Cl₂NO₂



shutterstock

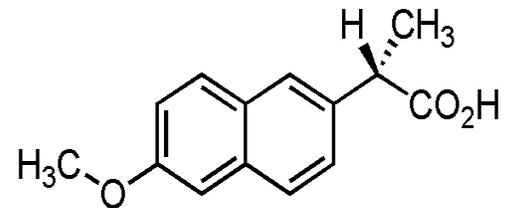
Indicaciones: Es un antiinflamatorio que posee actividades anal-gésicas y antipiréticas y está indicado por vía oral e intramuscular para el tratamiento de enfermedades reumáticas agudas, artritis reu-matoidea, es-pon-dilitis anquilosante, artrosis, lumbalgia, gota en fase aguda, inflamación postraumática y postoperatoria, cólico renal y biliar, migraña aguda, y como profilaxis para dolor postoperatorio y disme-norrea.

Dosis: La dosis habitual para el dolor leve a moderado es de 400 mg cada 4-6 h según sea necesario.



Naproxeno; Es un miembro del grupo de fármacos antiinflamatorios no esteroideos

Mecanismo de acción; COX con acciones y efectos secundarios comunes a otros NSAID. Algunos de los derivados del ácido propiónico, en particular el naproxeno, tienen efectos inhibidores sobre la función de los leucocitos, y algunas pruebas sugieren que el naproxeno puede tener una eficacia ligeramente mayor con respecto a la analgesia y al alivio de la rigidez matutina.



ADME

- 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, 2C8 a 6-O-desmetil y otros metabolitos
- t1/2, 9-25 h

Efectos adversos;

- Estreñimiento,
- Diarrea,
- Náuseas,
- Dispepsia
- Estomatitis.

Los efectos adversos con naproxeno ocurren casi a la misma frecuencia que con indometacina y otros NSAIDs.

Los efectos secundarios sobre el CNS incluyen somnolencia (3-9%),

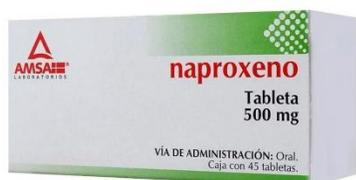
- Dolor de cabeza (3-9%),
- Mareos ($\leq 9\%$),
- Vértigo ($< 3\%$)
- Depresión ($< 1\%$).

Otras reacciones comunes incluyen prurito lumbar (3-9%) y diaforesis ($< 3\%$). Se han informado casos raros de ictericia, deterioro de la función renal, angioedema, trombocitopenia y agranulocitosis.

Indicaciones: Está indicado para el tratamiento de la artritis reumatoide, osteoartritis, espondilitis anquilosante y artritis juvenil. También está indicado para el tratamiento de tendinitis, bursitis, esguinces y para el manejo del dolor posquirúrgico

Dosis:

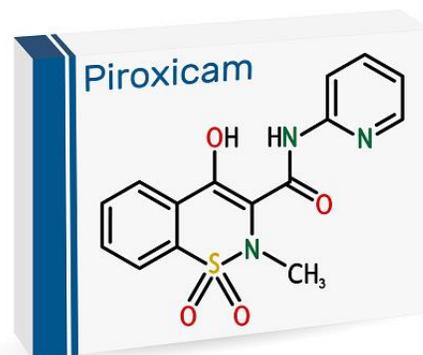
- 250 mg 3-4 veces/d; 250- 550 mg 2 veces/d; 750-1 000 mg al día (liberación prolongada)
- Niños: 5 mg/kg 2 veces/d (máximo 15 mg/kg/d)



Ácidos enólicos (oxicams):

Piroxicam

Es el inhibidor no selectivo de la COX con la $t_{1/2}$ más prolongada. El meloxicam muestra modos de selectividad COX-2 comparables a celecoxib y en algunos países ha sido aprobado como NSAID selectivo para la COX-2. Estos agentes tienen similar eficacia al ácido acetilsalicílico, la indometacina o el naproxeno para el tratamiento a largo plazo de la artritis reumatoide o la osteoartritis. La principal ventaja señalada para estos compuestos es su larga $t_{1/2}$, que permite la dosificación una vez al día.



Mecanismo de acción; El piroxicam puede inhibir la activación de neutrófilos, aparente e independientemente de su capacidad para inhibir la COX; por tanto, se han propuesto

modos adicionales de acción antiinflamatoria, que incluyen la inhibición de la proteoglucanasa y la colágenas en el cartílago.

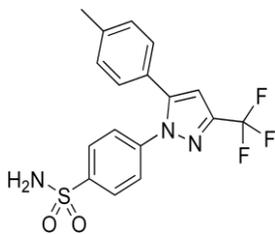
ADME;

- Máximo Cp, 3-5 h
- Unión a proteínas, 99%
- Metabolitos, hidroxilación CYP2C9,
- conjugación, N-desmetilación
- $t_{1/2}$, ~50 h

Efectos adversos; La mayoría de los eventos gastrointestinales espontáneos fatales se han observado en sujetos ancianos y en pacientes con enfermedades debilitantes. Son comunes los problemas menores del tracto superior gastrointestinal, por ejemplo, dispepsia. En menor frecuencia se puede presentar: estomatitis, anorexia, náusea, constipación, molestias abdominales, flatulencia, diarrea, dolor abdominal, indigestión, efectos renales: la administración a largo plazo de Piroxicam en animales de laboratorio ha producido necrosis papilar renal.

Indicaciones; Dolor agudo (a corto plazo) y la inflamación, además de estar aprobado para el tratamiento de la artritis reumatoide y la osteoartritis.

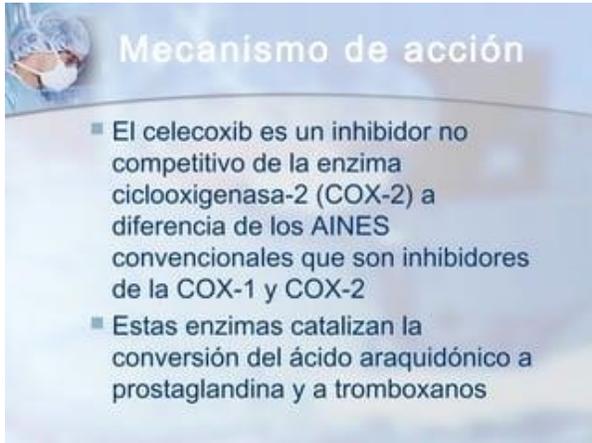
Dosis; 20 mg al día.



Por ultimo veremos inhibidores selectivos de la COX-2 que veremos el fármaco **Celecoxib** este son moléculas con cadenas laterales que se ajustan dentro de su bolsillo hidrofóbico pero son demasiado grandes para bloquear la COX-1 con igual y alta afinidad.

El celecoxib es el único inhibidor de la COX-2 desarrollado con intención que aún está aprobado en Estados Unidos (consúltense sus propiedades farmacocinéticas y precauciones clásicas).

Mecanismo de acción;



Mecanismo de acción

- El celecoxib es un inhibidor no competitivo de la enzima ciclooxigenasa-2 (COX-2) a diferencia de los AINES convencionales que son inhibidores de la COX-1 y COX-2
- Estas enzimas catalizan la conversión del ácido araquidónico a prostaglandina y a tromboxanos

ADME;

- Máximo Cp, ~3 h
- Unión a proteínas, 97%
- Metabolismo, CYP 2C9 (mayor) y 3A4 (menor), glucurónido
- t1/2, 11.2 h

Efectos adversos; Sinusitis, infección del tracto respiratorio superior, infección del tracto urinario; empeoramiento de la alergia; insomnio; mareo, hipertensión; IAM; HTA; faringitis, rinitis, tos, disnea; dolor abdominal, diarrea, dispepsia, flatulencia, vómito, disfagia; erupción, prurito; síntomas de tipo gripal, edema periférico/retención de líquidos.

Indicaciones. Alivio sintomático en el tratamiento de artrosis, artritis reumatoide y espondilitis anquilosante.

Dosis; 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



Bibliografía:

- Brunton, L. L., Knollmann, B. C., & Hilal-Dandan, R. (Eds.). (2019). Goodman & Gilman: Las bases farmacológicas de la terapéutica (13ª ed.). McGraw-Hill Education.
- Información extra de :
http://www.facmed.unam.mx/bmd/gi_2k8/prods/PRODS/Piroxicam.htm