



**Mi Universidad**

## **Antiinflamatorios**

*Nombre: Montserrath Juvenalia Guzman Villatoro*

*Tercer Parcial*

*Materia: Farmacología*

*Dr. Silvestre Esteban Dagoberto*

*Medicina Humana*

*Tercer Semestre Grupo B*

## Antiinflamatorios No Esteroideos (AINES)

Son medicamentos ampliamente utilizados para reducir la inflamación, aliviar el dolor y bajar la fiebre. Actúan bloqueando la síntesis de prostaglandinas, sustancias responsables de estos procesos.

Mecanismo de acción los AINES inhiben la enzima ciclooxigenasa (COX), que tiene dos isoformas principales:**COX-1:** Responsable de la producción de prostaglandinas involucradas en funciones fisiológicas, como la protección de la mucosa gástrica y la regulación del flujo sanguíneo renal.**COX-2:** Inducida en procesos inflamatorios y responsable de la síntesis de prostaglandinas inflamatorias.

### *Clasificación*

1. **No selectivos:** Inhiben tanto COX-1 como COX-2 (ej. ibuprofeno, naproxeno, diclofenaco).
2. **Selectivos de COX-2:** Diseñados para minimizar los efectos secundarios gástricos (ej. celecoxib, etoricoxib).

### *Indicaciones terapéuticas*

- **Dolor:** Agudo (cefaleas, dolor dental) y crónico (artritis, osteoartritis).
- **Fiebre:** Procesos infecciosos o inflamatorios.
- **Inflamación:** Artritis reumatoide, espondilitis anquilosante.

### *Farmacocinética*

- **Absorción:** Buena biodisponibilidad vía oral; algunos necesitan administrarse con alimentos para minimizar irritación gástrica.
- **Distribución:** Alta unión a proteínas plasmáticas.
- **Metabolismo:** Hepático, principalmente por enzimas del citocromo P450.
- **Excreción:** Renal, en su mayoría como metabolitos inactivos.

## **Efectos adversos**

1. **Gastrointestinales:** Gastritis, úlceras, hemorragias.
2. **Renales:** Reducción del flujo renal, insuficiencia renal aguda.
3. **Cardiovasculares:** Riesgo de eventos trombóticos (principalmente en selectivos de COX-2).

## **Contraindicaciones**

- Antecedentes de úlceras gástricas o hemorragias digestivas.
- Insuficiencia renal o hepática severa.
- Hipersensibilidad a los AINEs.

## **Fármacos: Ibuprofeno, Diclofenaco y Naproxeno**

**Ibuprofeno:** Es un antiinflamatorio no esteroideo (AINE) derivado del ácido propiónico. Se utiliza para tratar el dolor, la fiebre y la inflamación. **Diclofenaco:** AINE de la clase de los derivados del ácido acético, conocido por su eficacia en el tratamiento del dolor agudo y crónico, así como en procesos inflamatorios. **Naproxeno:** AINE perteneciente al grupo de los derivados del ácido propiónico. Es especialmente útil para el tratamiento de condiciones reumáticas y dolores musculoesqueléticos.

Mecanismos de Acción: Ibuprofeno, Diclofenaco y Naproxeno: Todos inhiben la enzima ciclooxigenasa (COX), disminuyendo la síntesis de prostaglandinas responsables de la inflamación, el dolor y la fiebre. El ibuprofeno y el naproxeno son inhibidores no selectivos de COX-1 y COX-2, mientras que el diclofenaco tiene mayor afinidad por COX-2, lo que puede reducir algunos efectos adversos gastrointestinales. Clasificaciones: Por selectividad: Inhibidores no selectivos de COX: Ibuprofeno y Naproxeno. Inhibidores preferenciales de COX-2: Diclofenaco. Indicaciones Terapéuticas: Ibuprofeno: Dolor leve a moderado (cefalea, dismenorrea), fiebre, artritis reumatoide, osteoartritis. Diclofenaco: Dolor

inflamatorio agudo (lumbalgia, esguinces), artritis reumatoide, espondilitis anquilosante.

Naproxeno: Artritis reumatoide, osteoartritis, gota aguda, dolor dental y dismenorrea. Dosis Habituales: **Ibuprofeno**: Adultos: 200-400 mg cada 4-6 horas. Máximo: 1200-2400 mg/día. Niños: 5-10 mg/kg cada 6-8 horas (según peso y edad). **Diclofenaco**: Adultos: 50-75 mg cada 8-12 horas. Máximo: 150 mg/día. **Naproxeno**: Adultos: 250-500 mg cada 12 horas. Máximo: 1000 mg/día para dolores crónicos.

Efectos Adversos: **Ibuprofeno**: Gastrointestinales: dispepsia, náuseas, hemorragia. Renales: disminución de la función renal. Cardiovasculares: hipertensión, riesgo aumentado de eventos trombóticos. **Diclofenaco**: Gastrointestinales: gastritis, úlceras. Hepáticos: elevación de enzimas hepáticas. Cardiovasculares: mayor riesgo de infarto de miocardio con uso prolongado. **Naproxeno**: Gastrointestinales: dolor abdominal, úlceras. Cardiovasculares: menor riesgo relativo comparado con otros AINEs. Renales: nefritis intersticial, insuficiencia renal aguda. Precauciones y Contraindicaciones: Contraindicados en pacientes con: Historia de úlceras o hemorragia gastrointestinal. Insuficiencia renal o hepática severa. Hipersensibilidad a AINEs. Precaución en: Embarazo, especialmente en el tercer trimestre. Uso concomitante con anticoagulantes.

Consideraciones Farmacocinéticas: Ibuprofeno: **Inicio de acción rápido (30-60 minutos), vida media de 2-4 horas**. Diclofenaco: **Vida media de 1-2 horas, acumulación en tejidos inflamados prolonga su efecto**. Naproxeno: **Vida media más larga (12-15 horas), permite administración dos veces al día**.



## Antiinflamatorios Esteroideos (Glucocorticoides)

Son hormonas sintéticas derivadas del cortisol que poseen potentes efectos antiinflamatorios e inmunosupresores. *Mecanismo de acción* Se unen a receptores intracelulares de glucocorticoides. Inhiben la fosfolipasa A2, bloqueando la síntesis de mediadores inflamatorios como prostaglandinas y leucotrienos. Disminuyen la producción de citoquinas inflamatorias.

### *Clasificación*

1. **Acción corta:** Hidrocortisona.
2. **Acción intermedia:** Prednisona, prednisolona.
3. **Acción prolongada:** Dexametasona, betametasona.

### *Indicaciones terapéuticas*

- **Enfermedades autoinmunes:** Lupus, artritis reumatoide.
- **Alergias severas:** Asma, reacciones anafilácticas.
- **Choque séptico:** Como adyuvantes para controlar inflamación excesiva.
- **Trasplantes:** Prevención del rechazo.

### *Farmacocinética*

- **Absorción:** Alta biodisponibilidad por vía oral o intravenosa.
- **Distribución:** Amplia, atraviesan la barrera hematoencefálica.
- **Metabolismo:** Hepático; algunos glucocorticoides requieren activación (prednisona a prednisolona).
- **Excreción:** Renal.

### *Efectos adversos*

1. **Supresión del eje HHS (hipotálamo-hipófisis-suprarrenal):** Insuficiencia adrenal al suspender bruscamente.

2. **Metabólicos:** Hiperglucemia, dislipidemia.
3. **Óseos:** Osteoporosis.
4. **Inmunosupresión:** Mayor susceptibilidad a infecciones.

### **Contraindicaciones**

- Infecciones sistémicas activas sin tratamiento.
- Osteoporosis severa.
- Diabetes Mellitus no controlada.

### **Fármacos: Cortisol, Prednisona y Dexametasona**

**Cortisol:** Glucocorticoide natural producido por las glándulas suprarrenales. Es esencial para el metabolismo, la respuesta al estrés y la regulación del sistema inmunológico. **Prednisona:** Glucocorticoide sintético, precursor de la prednisolona, utilizado en el tratamiento de enfermedades inflamatorias y autoinmunes. **Dexametasona:** Glucocorticoide sintético de alta potencia, empleado para tratar condiciones inflamatorias severas y reacciones alérgicas graves. **Mecanismos de Acción:** Se unen a receptores glucocorticoides citoplasmáticos, modulando la transcripción de genes que regulan la respuesta inflamatoria e inmunológica. Disminuyen la síntesis de mediadores inflamatorios como prostaglandinas y leucotrienos. Suprimen la actividad de células inmunes (linfocitos y macrófagos) y reducen la permeabilidad vascular.

**Clasificaciones:** Por duración de acción: Corta: **Cortisol (8-12 horas)**. Intermedia: **Prednisona (12-36 horas)**. Prolongada: **Dexametasona (36-72 horas)**. **Indicaciones Terapéuticas:** Cortisol: **Insuficiencia suprarrenal (enfermedad de Addison)**. Manejo del estrés quirúrgico o traumático. Prednisona: **Artritis reumatoide, lupus eritematoso sistémico, asma, colitis ulcerativa, trasplantes de órganos**. Dexametasona: **Shock séptico, edema cerebral, reacciones alérgicas severas, tratamiento de cáncer (como antiemético en quimioterapia)**.

Dosis Habituales: Cortisol: **Insuficiencia suprarrenal: 20-30 mg/día en dosis divididas.** Prednisona: **Enfermedades inflamatorias: 5-60 mg/día dependiendo de la gravedad.** Dexametasona: **Condiciones severas: 0.5-10 mg/día, ajustando según respuesta clínica.**

**Efectos Adversos:** Cortisol, Prednisona y Dexametasona: **Metabólicos: Hiperglucemia, aumento de peso, redistribución de grasa corporal (cara de luna llena, joroba de búfalo).** Musculo esqueléticos: **Osteoporosis, miopatía.** Endócrinos: **Supresión del eje hipotálamo-hipófisis-suprarrenal, insuficiencia suprarrenal al suspender bruscamente.** Cardiovasculares: **Hipertensión arterial.** Psicológicos: **Insomnio, irritabilidad, psicosis.** **Precauciones y Contraindicaciones:** **Contraindicados en: Infecciones sistémicas no controladas (salvo en shock séptico bajo criterio médico). Hipersensibilidad conocida a glucocorticoides. Precaución en Diabetes mellitus, hipertensión, osteoporosis, trastornos psiquiátricos.** **Consideraciones Farmacocinéticas:** Cortisol: **Metabolismo hepático, vida media de 8-12 horas.** Prednisona: **Profármaco convertido en prednisolona en el hígado, vida media de 12-36 horas.** Dexametasona: **Alta potencia y vida media prolongada (36-72 horas), baja retención de sodio.**



## Benzodiazepinas

Fármacos psicotrópicos que potencian el efecto inhibitorio del GABA, el principal neurotransmisor inhibitorio del sistema nervioso central.

Mecanismo de acción *aumentan la frecuencia de apertura de los canales de cloro asociados al receptor GABA-A. Disminuyen la excitabilidad neuronal, causando efectos sedantes, ansiolíticos y anticonvulsivantes.*

*Clasificación según vida media*

1. **Acción corta:** Midazolam, triazolam.
2. **Acción intermedia:** Alprazolam, lorazepam.
3. **Acción larga:** Diazepam, clonazepam.

### ***Indicaciones terapéuticas***

- **Ansiedad:** Trastorno de ansiedad generalizada, ataques de pánico.
- **Insomnio:** Inducción y mantenimiento del sueño.
- **Epilepsia:** Control de convulsiones agudas.
- **Sedación prequirúrgica.**

### ***Farmacocinética***

- **Absorción:** Alta biodisponibilidad por vía oral; algunos efectivos vía IV (midazolam).
- **Distribución:** Lipofílicos, atraviesan la barrera hematoencefálica.
- **Metabolismo:** Hepático; muchos producen metabolitos activos.
- **Excreción:** Renal.

## **Efectos adversos**

1. **Sedación excesiva:** Somnolencia, fatiga.
2. **Dependencia:** Uso prolongado causa tolerancia y síndrome de abstinencia.
3. **Alteraciones cognitivas:** Pérdida de memoria a corto plazo.

## **Manejo de sobredosis**

- Uso de flumazenil como antagonista competitivo del receptor GABA-A.

## **Fármacos: Alprazolam, Diazepam y Lorazepam**

**Alprazolam:** Benzodiazepina de acción intermedia, utilizada principalmente en el tratamiento de los trastornos de ansiedad y el trastorno de pánico. **Diazepam** Benzodiazepina de acción prolongada, indicada para ansiedad, convulsiones, espasmos musculares y sedación prequirúrgica. **Lorazepam:** Benzodiazepina de acción intermedia, empleada en el manejo de la ansiedad, insomnio y como premedicación quirúrgica. **Mecanismos de Acción: Alprazolam, Diazepam y Lorazepam:** Potencian la acción del ácido gamma-aminobutírico (GABA) al unirse al receptor GABA-A, aumentando la frecuencia de apertura de los canales de cloro. Producen efectos sedantes, ansiolíticos, hipnóticos, anticonvulsivantes y relajantes musculares.

*Clasificaciones: Por vida media: **Corta:** Alprazolam (6-12 horas). **Intermedia:** Lorazepam (10-20 horas). **Prolongada:** Diazepam (20-50 horas). Indicaciones Terapéuticas: **Alprazolam:** Trastornos de ansiedad generalizada. Trastorno de pánico. **Diazepam:** Ansiedad aguda , Espasmos musculares. Convulsiones (incluyendo estado epiléptico) , sedación prequirúrgica. **Lorazepam:** Ansiedad severa. Insomnio transitorio o relacionado con ansiedad. Premedicación para procedimientos quirúrgicos o diagnósticos*

**Dosis Habituales:** Alprazolam: **Ansiedad:** 0.25-0.5 mg tres veces al día (máximo 4 mg/día). **Trastorno de pánico:** Inicial de 0.5 mg tres veces al día, ajustando según necesidad. Diazepam: **Ansiedad:** 2-10 mg, 2-4 veces al día. **Convulsiones:** 5-10 mg IV cada 10-15 minutos (dosis máxima 30 mg). **Espasmos musculares:** 2-10 mg, 3-4 veces al día. Lorazepam: **Ansiedad:** 1-3 mg al día en dosis divididas. **Insomnio:** 2-4 mg al acostarse. **Sedación prequirúrgica:** 0.05 mg/kg IM (máximo 4 mg). **Efectos Adversos:** Alprazolam, Diazepam y Lorazepam: **Comunes:** Somnolencia, mareo, debilidad muscular, ataxia. **Graves:** Depresión respiratoria (particularmente en sobredosis o combinación con otros depresores del SNC). Dependencia y tolerancia con uso prolongado. Síndrome de abstinencia al suspender bruscamente.

**Contraindicados en:** *Miastenia gravis. Insuficiencia respiratoria severa. Apnea del sueño. Precaución en: Pacientes con historia de abuso de sustancias. Insuficiencia hepática o renal. Consideraciones en Sobredosis: Uso de flumazenil como antagonista de los receptores GABA-A para revertir los efectos de las benzodiazepinas. Monitorización estrecha por riesgo de convulsiones al usar flumazenil, especialmente en pacientes con dependencia de benzodiazepinas o polifa*



## Opioides

Fármacos analgésicos que actúan sobre receptores opioides para aliviar el dolor. Incluyen compuestos naturales, semisintéticos y sintéticos. Fisiología del sistema opioide: **Receptores  $\mu$  (mu)**: Analgesia, euforia, depresión respiratoria. **Receptores  $\kappa$  (kappa)**: Sedación, disforia. **Receptores  $\delta$  (delta)**: Modulación del dolor crónico.

Mecanismo de acción : **Activan receptores acoplados a proteínas G, inhibiendo la liberación de neurotransmisores excitatorios.**

### **Clasificación**

1. **Naturales**: Morfina, codeína.
2. **Semisintéticos**: Oxycodona, buprenorfina.
3. **Sintéticos**: Fentanilo, tramadol.

### **Indicaciones terapéuticas**

- **Dolor agudo**: Postoperatorio, traumatismos.
- **Dolor crónico**: Oncológico, neuropático.

### **Farmacocinética**

- **Absorción**: Buena biodisponibilidad oral; fentanilo eficaz vía transdérmica.
- **Distribución**: Alta liposolubilidad permite acción rápida (fentanilo).
- **Metabolismo**: Hepático; variabilidad interindividual.
- **Excreción**: Renal.

### **Efectos adversos**

1. **Depresión respiratoria**: Principal causa de muerte en sobredosis.
2. **Estreñimiento**: Muy común con uso crónico.
3. **Dependencia**: Física y psicológica.

### ***Manejo de sobredosis***

- Uso de naloxona como antagonista de receptores opioides.

## Bibliografía

**Goodman & Gilman: Las Bases Farmacológicas de la Terapéutica** Brunton, L. L., Knollmann, B. C., & Hilal-Dandan, R. 13ª edición. McGraw-Hill Education, 2018. ISBN: 978-6071509760.