



**Mi Universidad**

**Mi Universidad**

# **Resumen Antinflamatorios**

*Marla Mariela Santiz Hernández*

*Parcial IV*

*Farmacología I*

*Dr. Dagoberto Silvestre Esteban*

*Medicina Humana*

*Tercer Semestre Grupo C*

*Comitán de Domínguez, Chiapas a 13 de diciembre del 2024*

## Antiinflamatorios

Los antiinflamatorios son fármacos utilizados para aliviar la inflamación (Tiene como finalidad la lisis celular), el dolor y la fiebre. Su uso abarca desde condiciones leves, como cefaleas, hasta enfermedades graves como artritis reumatoide. Se dividen en dos grandes grupos:

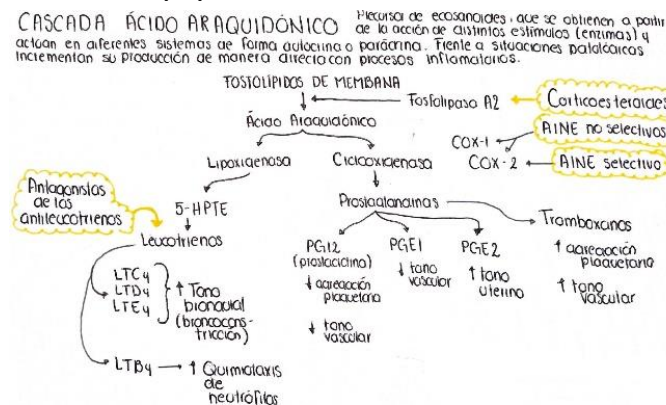
- ❖ **Antiinflamatorios No Esteroideos (AINES):** Son grupo heterogéneo de fármacos con propiedades antiinflamatorio, analgésico, antipirético y la antiagregación plaquetaria e protección mucosa, esto consiste en inhibir las enzimas conocidas como ciclooxigenasas (COX-1 y COX-2), que son esenciales para la producción de prostaglandinas.
- ❖ **Antiinflamatorios Esteroideos:** Los corticoesteroides son hormonas sintéticas o naturales derivadas del córtex suprarrenal, Imitan los efectos de las hormonas producidas por las glándulas suprarrenales que se utilizan por sus propiedades antiinflamatorias e inmunosupresoras.

### I. Antiinflamatorios No Esteroideos (AINES):

Se clasifican mecánicamente como no selectivos de isoforma, que inhiben la COX-1 y la COX-2, y los selectivos de COX-2, se utilizan para tratar inflamación, dolor, fiebre y la antiagregación plaquetaria. Al ser no esteroides sus efectos clínicos son similares a los corticoides, pero sin efectos secundarios y como analgésicos se caracterizan por no pertenecer a la clase de los narcóticos.

#### ❖ Mecanismo de Acción:

El ácido araquidónico, en seres humanos, es un precursor clave para la formación de mediadores de la inflamación. Proviene principalmente del ácido linoleico presente en los alimentos o se ingiere directamente a través de la dieta. Este ácido se encuentra esterificado a los fosfolípidos de las membranas celulares, lo que significa que está unido a las membranas de las células. Cuando el cuerpo necesita responder a una lesión o inflamación, una enzima llamada fosfolipasa A2 libera el ácido araquidónico de los fosfolípidos, una vez liberado, el ácido araquidónico puede ser convertido en prostaglandinas y leucotrienos, que son mediadores clave en la inflamación, el dolor, la fiebre y ayuda a desarrollar tratamientos más efectivos y específicos para enfermedades inflamatorias.



Los AINEs inhiben la enzima ciclooxigenasa (COX), responsable de sintetizar prostaglandinas y tromboxanos a partir del ácido araquidónico son: COX-1 (Antiagregación plaquetaria, protección mucosa) y COX-2: (Antiinflamatorio, analgésico, antipirético).

Mecanismo de acción específicos en los antipiréticos actúan específicamente en el hipotálamo, donde los pirógenos como IL-1 y TNF- $\alpha$  aumentan la producción de prostaglandina E2 (PGE2). Esta prostaglandina eleva el punto de ajuste térmico del cuerpo, causando fiebre. Al inhibir las enzimas ciclooxigenasas (COX), los antipiréticos reducen la síntesis de PGE2, normalizando el termostato corporal y bajando la temperatura. Los analgésicos, por su parte, alivian el dolor al bloquear la producción de prostaglandinas en los tejidos, lo que disminuye la sensibilización de las terminaciones nerviosas al dolor. Los analgésicos, actúa directamente en el sistema nervioso central uniéndose a receptores específicos ( $\mu$ ,  $\kappa$ ,  $\delta$ ), bloqueando la transmisión de las señales dolorosas en la médula espinal y modulando su percepción en el cerebro. Así, los analgésicos abordan tanto el dolor periférico como el central.

#### ❖ Farmacocinética:

- **Absorción:**  
Son bien absorbidos y la absorción no se ve afectada por los alimentos. La concentración máxima (Cmax) se alcanza entre 1 y 4 horas después de la administración. Si se administran con fármacos anti H2, la absorción se puede retardar.
- **Metabolismo:**  
El metabolismo de los AINEs ocurre principalmente en el hígado, a través de las enzimas del citocromo P-450, en especial **CYP3A** y **CYP2C**.
- **Excreción:**  
La excreción renal es la principal donde los metabolitos se secretan en el túbulo proximal mediante un mecanismo dependiente de sodio, además pueden pasar por circulación enterohepática, siendo excretados en la bilis y luego reabsorbidos en el intestino, lo que puede alargar su presencia en el cuerpo. Este proceso se ve influido por la irritación del intestino distal.
- **Distribución:**  
Los AINEs se unen fuertemente a la albúmina (aproximadamente 98%), lo que afecta su distribución en los tejidos.

#### ❖ **Clasificación:**

Su vida media	Potencia antiinflamatoria	Acción sobre las enzimas de Cox
<5 horas: Ácido acetil salicílico, Acetaminofén, ibuprofeno, diclofenaco, ketoprofeno, indometacina	Analgésicos pero insignificante antiinflamatorio: Paracetamol	Inhibidores no selectivo: Derivados al ácido salicílico, D. de acéticos, D. de ácido propiónico, D. de ácido fenamatos. D. enólicos
5-15 horas: Diflunisal, naproxeno, sulindac, celecoxib, metamizol, sulindac	Analgésicos y antiinflamatorios moderados: Ibuprofeno, mefenámico, diclofenaco	Inhibidores selectivo de la Cox-2: Refecoxib, celecoxib, valdecoxib, nimesulida, Meloxicam, diclofenaco.
> 15 horas: Piroxicam, tenoxicam, nuevos aines oxicanos, rofecoxib.	Analgésicos y antiinflamatorios potentes: Salicilatos, dipirona, indometacina	Algunos especial por la Cox-3: Paracetamol

#### ❖ **Indicaciones Terapéuticas:**

- Estados febriles por infecciones o inflamaciones.
- Dolor leve a moderado, como migrañas, cefaleas, dolores postoperatorios y dismenorrea.
- Enfermedades inflamatorias, como artritis reumatoide, artrosis y tendinitis.
- Enfermedad inflamatoria intestinal ( colitis ulcerosa).
- Condiciones oculares como la inflamación posquirúrgica y conjuntivitis alérgica.
- Trastornos dermatológicos, como verrugas vulgares.
- En niños, se usan principalmente paracetamol e ibuprofeno para fiebre y dolor.
- Otros usos clínicos:

-**Mastocitosis sistémica:** Los AINEs como el ácido acetilsalicílico pueden ayudar a controlar los síntomas de enrojecimiento e hinchazón causados por la liberación de PGD2, pero deben usarse con precaución para evitar la desgranulación de los mastocitos.

-**Tolerabilidad al niacina:** Los AINEs pueden reducir el enrojecimiento facial provocado por grandes dosis de niacina, que eleva los niveles de colesterol.

-**Síndrome de Bartter:** Los AINEs no son una solución primaria, pero pueden ayudar a manejar algunos síntomas asociados a este trastorno raro.

#### ❖ **Efectos farmacológicos:**

- **Dolor:** Son efectivos para aliviar dolores leves a moderados, como los dentales, menstruales o los asociados a la inflamación.
- **Fiebre:** Reducen en personas con temperaturas elevadas, pero no afectan la temperatura corporal en personas sanas.
- **Inflamación:** Beneficioso en tto de enfermedades musculares esqueléticas (artritis reumatoide, artrosis).

- **Plaquetas:** Al inhibir la formación del tromboxano A2 en las plaquetas, los AINEs alteran su función, lo que prolonga el tiempo de hemorragia.

#### ❖ Efectos Adversos:

Sistema/Órgano	Manifestaciones
<b>Gastrointestinal</b>	Dolor abdominal, náuseas, diarrea, anorexia, erosiones/úlceras gástricas, anemia, hemorragia.
<b>Plaquetaria</b>	Inhibición de la activación plaquetaria, propensión a equimosis, mayor riesgo de hemorragias.
<b>Renal</b>	Retención de sodio y agua, edema, agravamiento de disfunción renal en pacientes con nefropatías, cardiopatías y cirrosis; reducción de eficacia de antihipertensores y diuréticos; disminución de la excreción de urato, hiperpotasemia.
<b>Cardiovascular</b>	Cierre del conducto arterioso, infarto de miocardio, apoplejía, trombosis.
<b>SNC</b>	Cefalea, vértigo, mareos, confusión, hiperventilación (particularmente con salicilatos).
<b>Reproductivo</b>	Prolongación de la gestación, inhibición del trabajo de parto
<b>Hipersensibilidad</b>	Rinitis vasomotora, edema angioneurótico, asma, urticaria, rubefacción, hipotensión, choque.
<b>Hematológica</b>	Anemia, agranulocitosis, anemia aplásica, anemia hemolítica, leucopenia
<b>Hepático</b>	Enzimas elevadas, hepatitis, insuficiencia hepática, ictericia
<b>Dermatológico</b>	Diaforesis, dermatitis exfoliativa, fotosensibilidad, prurito, púrpura, erupción, síndrome de Stevens-Johnson, necrólisis tóxica de la epidermis, urticaria
<b>Respiratorio</b>	Disnea, hiperventilación (salicilatos)
<b>Otros</b>	Alopecia, visión borrosa, conjuntivitis, epistaxis, fiebre, pérdida de la audición, pancreatitis, parestesias, alteraciones visuales, aumento de peso

#### ❖ Contraindicaciones

- Úlcera péptica activa.
- Insuficiencia renal o hepática grave.
- Embarazo avanzado.

### I.1 Propiedades específicas de los AINES individual

#### ❖ Derivado salicilatos:

**Ácido acetilsalicílico:** Fármaco de la familia de los salicilatos, está indicado como antipirético, antiinflamatorio y como antiagreganteplaquetario. También es útil para artritis reumatoide, osteoartritis, espondilitis anquilosante y fiebre reumática aguda.

#### Propiedades farmacocinéticas

**-Absorción máxima (Cp):** Se alcanza aproximadamente 1 hora después de su administración oral.

**Unión a proteínas plasmáticas:** 80-90%, principalmente a la albúmina.

**-Metabolismo:** Principalmente se metaboliza en el hígado a ácido salicílico.

**-Vida media (t<sub>1/2</sub>):** En dosis terapéuticas: 2-3 horas, y en dosis tóxicas: 15-30 horas debido a la saturación de las vías metabólicas.

#### Indicaciones principales:

- **Antipirético y analgésico:** Para aliviar fiebre y dolor leve a moderado.

- **Antiinflamatorio:** En el manejo de enfermedades inflamatorias como artritis reumatoide.

- **Antiplaquetario:** Para prevenir enfermedades cardiovasculares o alto riesgo de trombosis porque su efecto prolongado, es eficaz para prevenir complicaciones relacionadas con la formación de coágulos.

### Dosis terapéuticas:

-**Efecto antiplaquetario Cox I:** 75-150 mg/día.

-**Control de dolor o fiebre Cox2:** >500 mg cada 6-8 horas.

-**Fiebre reumática:** En niños, 1 g cada 4-6 horas o 10 mg/kg cada 4-6 horas.

### Dosis de intoxicación:

-**Dosis toxica:** 150 mg / Kg / Dosis

-**Dosis letal:** >500 mg / Kg / Dosis

### -Clasificación de Dosis de intoxicación/síntomas:

- 150 mg es leve: hiperventilación, tinitis, mareo y cefalea.
- 150-300 mg es moderado: Taquipnea-acidosis, confusión, calor, somnolencia, hipertermia.
- 300-500 mg es severa: Coma, paro respiratorio, muerte.

### -Tratamiento de Intoxicación:

- ABC <10 min: **A:** asegurar la vía aérea, **B:** evaluar y apoyar la respiración, y **C:** estabilizar la circulación.
- <1 hr: Lavado gástrico o carbón activado.
- Líquido IV: > excreción renal x Administrar de HCO<sub>3</sub> para alcalizar (1hr.)

### Mecanismo de acción:

Inhibición irreversible de la COX-I plaquetaria reduce la síntesis de tromboxano A<sub>2</sub>, lo que prolonga el tiempo de coagulación y genera efectos antiplaquetarios duraderos.

### Efectos adversos:

-Tracto gastrointestinal Riesgo de irritación, úlceras y sangrado.

-Puede desencadenar reacciones alérgicas en pacientes predispuestos.

-Cierre prematuro del conducto arterioso 3 trimestre de embarazo, síndrome de rey:

El síndrome de Reye es una enfermedad rara pero grave, es evitar la administración de aspirina en niños y adolescentes con infecciones virales, como la gripe o la varicela. Este síndrome provoca inflamación en el cerebro (encefalopatía) y acumulación de grasa en el hígado, lo que puede llevar a síntomas como vómitos persistentes, confusión, convulsiones y pérdida de conciencia.

### ❖ Derivado paraaminofenol

**Paracetamol (Acetaminofén):** Actúa principalmente en el SNC, donde inhibe la Cox-3, una variante de la ciclooxigenasa presente en el cerebro y la médula espinal, esta inhibición disminuye la producción de prostaglandinas, lo que le otorga propiedades analgésicas y antipiréticas. Sin embargo, en los tejidos periféricos, la acción del paracetamol sobre la COX se ve limitada por la presencia de peroxidasa, lo que reduce su efecto antiinflamatorio en comparación con otros AINEs.

### Farmacocinéticas:

- Se absorbe rápido en el Intestino delgado y la biodisponibilidad es alta, aproximadamente del 90 a 95 % .
- Metabolismo:
  - Principalmente en el hígado, a través de conjugación con **glucurónido y sulfato**.
  - Una fracción se metaboliza por el citocromo P450 a **NAPQI** (metabolito tóxico).
- Unión a proteínas 20- 50 %
- Vida media: 2-4 hr.

### Indicación principal:

- Aliviar el dolor leve a moderado (dolor de cabeza, dolor muscular, dolor dental, dolor menstrual, etc.).
- Reducir la fiebre en condiciones como resfriados, gripe y otras infecciones.
- Tratamiento del dolor postoperatorio o dolor relacionado con procedimientos médicos menores.

- Alivio del dolor asociado con enfermedades crónicas como osteoartritis

**Dosis terapéuticas:**

- **Adultos:** Dolor/ fiebre: 325-650 mg cada 4-6 horas o 1 g cada 6-8 horas.
- **Niños:** Dolor/ fiebre: 10-15 mg/kg cada 4-6 horas.

**Dosis de intoxicación:**

- **Dosis Letal:** Adulto= 10g/Kg/Dosis y Niños= 150mg/Kg/Dosis
- **toxico:** Adulto= 4 g/Kg/Dosis y Niños= 75 mg/Kg/Dosis
- **Efectos por intoxicación:**
  - **Fase 1 (0-24 horas):** Síntomas leves como náuseas, vómitos y malestar general.
  - **Fase 2 (24-72 horas):** Dolor abdominal, ictericia y elevación de las pruebas hepáticas.
  - **Fase 3 (72-96 horas):** Insuficiencia hepática aguda, encefalopatía, sangrados y posible fallo multiorgánico.
  - **Fase 4 (más de 96 horas):** confusión, somnolencia extrema, ictericia o insuficiencia hepática irreversible que puede requerir trasplante.
- **Aumentó de la toxicidad:** una sobre dosis, condiciones que afectan la perfusión hepática, consumo crónico del paracetamol, desnutrición y bajos niveles de glutatión, enfermedades hepáticas preexistente, edad avanzada
- **Tratamiento de intoxicación:** Dado que existe un antídoto, el principal tratamiento es la administración de N-acetilcisteína, entre otros sería un lavado gástrico y carbón activado, o trasplante hepático depende de la gravedad.

**Efectos adversos:**

- Intoxicación aguda con necrosis hepática grave.
- Toxicidad hemática ( leucopenia, trombocitopenia).
- Alergias: erupciones eritematosas urticaria.
- ❖ **Derivado de pirazonas:** Son fármacos que se han utilizado por mucho tiempo , sin embargo, en los últimos años muchas farmacopeas los han retirado del mercado por el riesgo de agranulocitis graves. Este grupo está representado por: Fenilbutazona, Oxifenbutazona, Propifenazona, Dipirona.

**Dipirona(Metamizol):** Es antipirético, analgésico y efecto relajante de la fibra muscular lisa.

**Mecanismo de acción:** Actúa sobre el dolor y la fiebre reduciendo la síntesis de prostaglandinas pro-inflamatorias al inhibir a la actividad de la prostaglandina sintetasa.

**Farmacocinética:**

- **Absorción:** Gastrointestinal es completa y rápida.
- **Distribución:** Uniforme y amplia, la unión a proteínas plasmáticas es mínima y depende de la concentración de sus metabolitos.
- **Metabolismo:** Se metaboliza en el hígado, generando metabolitos activos como el 4-aminoantipirina.
- **Eliminación:** Por vía renal y una pequeña fracción del fármaco no metabolizado se excretan en la orina

**Indicaciones:** Dolor agudo postoperatorio o postraumático, dolor de tipo cólico, fiebre alta que no responda a otros antipiréticos.

**Efectos adversos:** Agranulocitosis, reacciones alérgicas, hipotensión y efectos gastrointestinales.

- ❖ **Derivados del ácido propionico:** Poseen actividad de antiinflamatoria, Analgésica, Antitérmica  
Antiagregantes plaquetaria

Fármacos	Definición	Mecanismo de Acción	Farmacocinética	Indicaciones	Efectos Adversos
----------	------------	---------------------	-----------------	--------------	------------------

<b>Ibuprofeno</b>	AINE utilizado para tratar dolor, fiebre e inflamación de leve a moderada.	Inhibe las COX-1 y COX-2, disminuyendo la producción de prostaglandinas que causan dolor e inflamación.	<ul style="list-style-type: none"> <li>- <b>Absorción:</b> rápida, 45 minutos a 1 hora.</li> <li>- <b>Unión a proteínas:</b> 99%.</li> <li>- <b>Vida media:</b> 2-4 horas.</li> <li>- <b>Excreción:</b> en orina.</li> </ul>	<ul style="list-style-type: none"> <li>- Dolor leve a moderado.</li> <li>- Fiebre.</li> <li>- Artritis y otras afecciones inflamatorias.</li> </ul>	<ul style="list-style-type: none"> <li>- Dolor abdominal.</li> <li>- Úlceras gástricas.</li> <li>- Sangrado gastrointestinal.</li> <li>- Retención de líquidos.</li> <li>- Aumento de la presión arterial.</li> </ul>
<b>Naproxeno</b>	AINE usado para aliviar dolor e inflamación, con un efecto más prolongado.	Inhibe las ciclooxigenasas COX-1 y COX-2, reduciendo la síntesis de prostaglandinas involucradas en dolor e inflamación.	<ul style="list-style-type: none"> <li>- <b>Absorción:</b> rápida (aproximadamente 1-2 horas).</li> <li>- <b>Unión a proteínas:</b> 99%.</li> <li>- <b>Vida media:</b> 9-25 horas.</li> <li>- <b>Excreción:</b> principalmente renal.</li> </ul>	<ul style="list-style-type: none"> <li>- Artritis reumatoide y osteoartritis.</li> <li>- Dolores musculares, articulares, menstruales.</li> <li>- Fiebre.</li> </ul>	<ul style="list-style-type: none"> <li>- Dolores gastrointestinales.</li> <li>- Retención de líquidos.</li> <li>- Aumento de la presión arterial.</li> <li>- Úlceras gástricas.</li> <li>- Efectos renales.</li> <li>- Reacciones alérgicas.</li> </ul>
<b>Fenoprofeno</b>	AINE utilizado para el alivio de dolor e inflamación, con acción similar al ibuprofeno.	Inhibe COX-1 y COX-2, disminuyendo la producción de prostaglandinas responsables del dolor y la inflamación.	<ul style="list-style-type: none"> <li>- <b>Absorción:</b> rápida, inicio de acción en 30-60 minutos.</li> <li>- <b>Vida media:</b> 2 - 3 horas.</li> <li>- <b>Excreción:</b> renal.</li> </ul>	<ul style="list-style-type: none"> <li>- Dolor leve a moderado.</li> <li>- Artritis y condiciones inflamatorias.</li> </ul>	<ul style="list-style-type: none"> <li>- Trastornos gastrointestinales.</li> <li>- Náuseas y vómitos.</li> <li>- Cefalea.</li> <li>- Retención de líquidos.</li> <li>- Aumento de presión arterial.</li> </ul>
<b>Ketoprofeno</b>	AINE utilizado para tratar dolor, fiebre e inflamación, especialmente en afecciones musculoesqueléticas.	Inhibe COX-1 y COX-2, reduciendo la síntesis de prostaglandinas que causan inflamación, fiebre y dolor.	<ul style="list-style-type: none"> <li>- <b>Absorción:</b> bien absorbido, rápido.</li> <li>- <b>Unión a proteínas:</b> 99%.</li> <li>- <b>Vida media:</b> 2 horas.</li> <li>- <b>Excreción:</b> en orina (80%).</li> </ul>	<ul style="list-style-type: none"> <li>- Dolor leve a moderado.</li> <li>- Artritis.</li> <li>- Fiebre.</li> <li>- Lesiones musculares.</li> </ul>	<ul style="list-style-type: none"> <li>- Trastornos gastrointestinales (úlceras, sangrado).</li> <li>- Náuseas, vómitos.</li> <li>- Cefalea.</li> <li>- Retención de líquidos.</li> <li>- Daño renal.</li> <li>- Reacciones alérgicas.</li> </ul>
<b>Oxaprina</b>	AINE con propiedades antiinflamatorias y analgésicas, usado para aliviar el dolor y la inflamación.	Inhibe las COX-1 y COX-2, reduciendo la producción de prostaglandinas proinflamatorias.	<ul style="list-style-type: none"> <li>- <b>Absorción:</b> rápida.</li> <li>- <b>Vida media:</b> 8-45 horas.</li> <li>- <b>Excreción:</b> rena</li> </ul>	<ul style="list-style-type: none"> <li>- Tratamiento de afecciones inflamatorias (artritis).</li> <li>- Dolores musculares y articulares.</li> </ul>	<ul style="list-style-type: none"> <li>- Dolor gastrointestinal.</li> <li>- Mareos.</li> <li>- Náuseas.</li> <li>- Hipersensibilidad.</li> <li>- Efectos renales.</li> </ul>

❖ **Derivados del ácido acético:** Poseen efectos analgésicos, antipiréticos y antiinflamatorios. Dentro de este grupo, destacan los AINEs derivados del ácido acético, como el diclofenaco, la indometacina que actúan inhibiendo las enzimas COX para aliviar el dolor y la inflamación.

Fármaco	Definición	Mecanismo de Acción	Farmacocinética	Indicación	Efectos Adversos
<b>Diclofenaco</b>	AINE con potente actividad antiinflamatoria y analgésica, ampliamente usado en dolor e inflamación.	Inhibidor no selectivo de COX-1 y COX-2. Tiene preferencia relativa por COX-2, lo que podría reducir algunos efectos adversos gastrointestinales en comparación con otros AINEs.	- <b>Absorción:</b> rápida, Tmax 1-2 h. - <b>Unión a proteínas:</b> 99%. - <b>Vida media:</b> 1-2 h. - <b>Metabolismo:</b> hepático (CYP2C9). - <b>Excreción:</b> renal y biliar.	- Dolor agudo (traumatismos, cirugías). - Artritis reumatoide, osteoartritis. - Espondilitis anquilosante. - Dismenorrea primaria.	- Elevación de transaminasas hepáticas. - Riesgo cardiovascular. - Retención de líquidos y edema.
<b>Indometacina</b>	AINE con potente efecto antiinflamatorio, menos utilizado por su perfil de toxicidad.	Inhibidor no selectivo de COX-1 y COX-2, con efecto en la síntesis de prostaglandinas. También inhibe la motilidad de neutrófilos en sitios inflamatorio	- <b>Absorción:</b> buena, Tmax 1-2 h. - <b>Unión a proteínas:</b> 90%. - <b>Vida media:</b> 4-5 h. - <b>Metabolismo:</b> hepático (CYP2C9). - <b>Excreción:</b> renal y biliar.	- Tratamiento de artritis reumatoide y osteoartritis. - Espondilitis anquilosante. - Cierre de conducto arterioso en neonatos.	- Alta incidencia de efectos GI: náuseas, vómitos, diarrea, úlceras. - Cefalea severa. - Toxicidad renal. - Pancreatitis. - Reacciones hematológicas (anemia, leucopenia).

- **Derivado del ácido enólico (oxicam):** Inhibe la cox-1 y la cox-2 que tienen una actividad antiinflamatoria, analgésica y antipirética.

Fármaco	Definición	Mecanismo de Acción	Farmacocinética	Indicaciones	Efectos Adversos
<b>Meloxicam</b>	AINE con acción antiinflamatoria, analgésica y antipirética. Se clasifica como un oxicam, pero tiene mayor selectividad por COX-2.	Inhibidor selectivo de COX-2 a dosis bajas (por lo que tiene menos efectos adversos gastrointestinales en comparación con otros AINEs no selectivos). A dosis altas, inhibe también COX-1.	- <b>Absorción:</b> buena, Tmax 4-5 h. - <b>Unión a proteínas:</b> 99%. - <b>Vida media:</b> 20-24 h. - <b>Metabolismo:</b> hepático (CYP2C9). - <b>Excreción:</b> renal.	- Artritis reumatoide. - Osteoartritis. - Espondilitis anquilosante. - Dolor postquirúrgico.	- Efectos gastrointestinales como náuseas, dolor abdominal. - Raras alteraciones hematológicas. - Efectos renales (retención de líquidos, hipertensión). - Cefalea.
<b>Piroxicam</b>	AINE con potente actividad antiinflamatoria y analgésica, pero de acción más prolongada.	Inhibidor no selectivo de COX-1 y COX-2. Tiene una acción más prolongada, lo que permite administración diaria. Inhibe la síntesis de prostaglandinas,	- <b>Absorción:</b> buena, Tmax 3-5 h. - <b>Unión a proteínas:</b> 99%. - <b>Vida media:</b> 45-50 h. - <b>Metabolismo:</b> hepático (CYP2C9). - <b>Excreción:</b> renal.	- Artritis reumatoide. - Osteoartritis. - Espondilitis anquilosante. - Dolor musculoesquelético.	- Efectos gastrointestinales: náuseas, dolor epigástrico, úlceras. - Efectos renales: retención de líquidos, edema. - Efectos hematológicos (anemia,



lo que reduce la inflamación.

leucopenia).  
- Cefalea.

## 2. Antiinflamatorios Esteroides

Los corticoesteroides son hormonas naturales o sintéticas derivadas del córtex suprarrenal, utilizadas en medicina por sus potentes efectos antiinflamatorios, antialérgico e inmunosupresores. Actúan reduciendo la inflamación e inhibiendo mediadores químicos, lo que los hace útiles para tratar enfermedades autoinmunes, prevenir rechazos de trasplantes y controlar diversas afecciones inflamatorias. Además, alteran el metabolismo de glucosa, grasas y proteínas. Sin embargo, su uso prolongado puede ocasionar efectos secundarios, como osteoporosis, hiperglucemia y hipertensión. El cortisol es el principal glucocorticoide natural en el cuerpo humano.

### ❖ Mecanismo de Acción:

Los glucocorticoides actúan uniéndose a receptores intracelulares, modulando la transcripción de genes. Inhiben la producción de mediadores inflamatorios como **citocinas, prostaglandinas y leucotrienos**.

- Suprime la fosfolipasa A2, bloqueando la síntesis de ácido araquidónico.
- Reduce la migración de leucocitos al sitio inflamado.

### ❖ Efectos

#### **Antiinflamatorio:**

Los glucocorticoides inhiben la fosfolipasa A2, una enzima que está involucrada en la producción de prostaglandinas y leucotrienos, mediadores clave de la inflamación. Al reducir la producción de estos mediadores, los esteroides disminuyen la inflamación en los tejidos.

#### **Antialérgico:**

Los glucocorticoides también modulan la respuesta alérgica, ya que suprimen la liberación de histamina y otros mediadores inflamatorios de los mastocitos, las células que participan en las reacciones alérgicas. Además, disminuyen la producción de citoquinas proinflamatorias, lo que reduce la intensidad de las reacciones alérgicas.

#### **Inmunosupresor:**

En cuanto al sistema inmunológico, los esteroides inhiben la actividad de las células **T** y otras células inmunológicas, reduciendo su capacidad de atacar tejidos propios (lo que es útil en enfermedades autoinmunes). Los glucocorticoides también disminuyen la producción de anticuerpos, lo que reduce la respuesta inmune general.

### ❖ Farmacocinética:

- **Absorción:** Los corticoesteroides, como la prednisona, se absorben eficientemente después de la administración oral y alcanzan concentraciones plasmáticas relativamente altas. La biodisponibilidad oral puede variar dependiendo de la formulación, pero en general, los corticoesteroides orales tienen una buena absorción.
- **Distribución:** Se distribuyen extensamente en los tejidos, especialmente en aquellos donde existe inflamación, gracias a su afinidad por los receptores celulares. Los corticoesteroides se unen a proteínas plasmáticas, principalmente a la **transcortina** (corticosteroid-binding globulin, CBG) y a albúmina, lo que afecta su actividad biológica y duración.
- **Metabolismo:** Los corticoesteroides son metabolizados principalmente en el hígado, donde se convierten en formas activas o inactivas mediante procesos de reducción y conjugación.
- **Eliminación:** La eliminación se lleva a cabo principalmente por los riñones, en forma de metabolitos inactivos, y la vida media de los corticoesteroides varía. Los corticoesteroides con vida media corta (como la hidrocortisona) requieren dosis más frecuentes, mientras que los de vida media larga (como la dexametasona) pueden administrarse con menos frecuencia.

### 2.1 Propiedades específicas cada fármaco

Fármaco	Cortisona	Betametasona	Prednisona	Dexametasona
Definición	Glucocorticoide natural, precursor de la hidrocortisona, usado	Glucocorticoide sintético con un potente efecto antiinflamatorio y menos	Glucocorticoide sintético que tiene propiedades antiinflamatorias y se utiliza	Glucocorticoide sintético de acción prolongada y

	en el tratamiento de inflamaciones agudas y crónica	efectos mineralocorticoides.	para tratar trastornos inflamatorios y autoinmunes.	potente, utilizado en trastornos inflamatorios severos.
<b>Mecanismo de Acción</b>	Actúa a través de la unión a receptores citoplasmáticos y modula la transcripción de genes involucrados en la inflamación (inhibiendo la fosfolipasa A2).	Potente agonista de los receptores de glucocorticoides que inhibe la fosfolipasa A2 y la síntesis de citoquinas proinflamatorias.	Similar a otros glucocorticoides, inhibe la producción de mediadores inflamatorios como prostaglandinas y citoquinas.	Agonista potente del receptor de glucocorticoides, que inhibe la transcripción de genes inflamatorios y modula la respuesta inmune.
<b>Clasificación</b>	Glucocorticoide endógeno / terapéutico	Glucocorticoide sintético	Glucocorticoide sintético derivado de la cortisona	Glucocorticoide sintético
<b>Farmacocinética</b>	<ul style="list-style-type: none"> <li>- <b>Absorción:</b> rápida por vía oral: Tracto gastrointestinal y IM: puede ser de liberación rápida o sostenida dependiendo la fórmula.</li> <li>- <b>Distribución:</b> se une a proteínas plasmáticas principalmente CBG y albumina</li> <li>- <b>Metabolismo:</b> hepático mediante conjugación con glucuronidos y sulfatos. (principalmente a hidrocortisona del <b>11β-HSD I</b>).</li> <li>- <b>Excreción:</b> renal.</li> </ul>	<ul style="list-style-type: none"> <li>- <b>Absorción:</b> rápida y completa</li> <li>- <b>Distribución:</b> 60-70% se une a proteínas plasmáticas albumina y transcortina</li> <li>- <b>Metabolismo:</b> hepático a través de la enzima microsomales</li> <li>- <b>Excreción:</b> renal.</li> </ul>	<ul style="list-style-type: none"> <li>- <b>Absorción:</b> rápida por vía oral: tracto gastrointestinal y tiene biodisponibilidad 70-80%</li> <li>- <b>Distribución:</b> se une a proteínas plasmáticas el 70-90% en globulina y albumina</li> <li>- <b>Metabolismo:</b> hepático o CYP3A4</li> <li>- <b>Excreción:</b> renal.</li> </ul>	<ul style="list-style-type: none"> <li>- <b>Absorción:</b> completa.</li> <li>- <b>Distribución:</b> se une a proteínas plasmáticas.</li> <li>- <b>Metabolismo:</b> hepático.</li> <li>- <b>Excreción:</b> renal.</li> </ul>
<b>Indicación</b>	<ul style="list-style-type: none"> <li>- Enfermedades inflamatorias crónicas.</li> <li>- Trastornos autoinmunes.</li> <li>- Alergias severas.</li> </ul>	<ul style="list-style-type: none"> <li>- Trastornos inflamatorios crónicos graves.</li> <li>- Trastornos alérgicos severos.</li> <li>- Enfermedades</li> </ul>	<ul style="list-style-type: none"> <li>- Artritis reumatoide.</li> <li>- Lupus eritematoso.</li> <li>- Enfermedades autoinmunes.</li> </ul>	<ul style="list-style-type: none"> <li>- Enfermedades inflamatorias graves.</li> <li>- Cáncer (tratamiento paliativo).</li> <li>- Enfermedades</li> </ul>

		autoinmunes. -Maduración pulmonar		alérgicas severas. -Maduración pulmonar
<b>Dosis</b>	- 25-300 mg/día en dosis fraccionadas (oral).	- Oral: 0.5-7.2 mg/día -IM:4-12mg/1-2 semana -Maduración pulmonar IM: 12 mg cada 24 horas por 2 dosis -Tópica: 1-2 al día	- 5-60 mg/día dependiendo del tratamiento.	- 0.5-10 mg/día (según la indicación). -Maduración pulmonar: 6 mg cada 12 hora por 4 dosis.
<b>Potencialidad Antiinflamatoria</b>	0.8 Menos potente que otros glucocorticoides sintéticos.	25 Alta, más potente que la cortisona.	4 Moderada, menos potente que la betametasona.	25 Muy alta, uno de los glucocorticoides más potentes
<b>Efecto adverso</b>	- Hiperglucemia - Hipertensión - Osteoporosis - Retención de sodio - Inmunosupresión	- Hiperglucemia - Hipertensión - Edema - Osteoporosis - Inmunosupresión	- Hiperglucemia - Hipertensión - Retención de líquidos - Osteoporosis - Disminución de la resistencia a infecciones	- Hiperglucemia - Hipertensión - Edema - Psicosis - Osteoporosis
<b>Contraindicaciones</b>	- Hipersensibilidad - Infecciones activas - Úlceras gástricas	- Hipersensibilidad a glucocorticoides - Infecciones no tratadas - Úlceras gástricas	- Hipersensibilidad - Infecciones activas - Úlceras gástricas	- Hipersensibilidad - Infecciones sistémicas no controladas - Úlceras gástricas

## Bibliografía

1. Brunton, L. L., Hilal-Dandan, R., & Parker, K. L. (Eds.). (2018). *Goodman & Gilman's: The pharmacological basis of therapeutics* (13.ª ed.). McGraw-Hill Education. [https://www.academia.edu/50053420/Las\\_bases\\_farmacol%C3%B3gicas\\_de\\_la\\_Terap%C3%A9utica\\_13\\_ed](https://www.academia.edu/50053420/Las_bases_farmacol%C3%B3gicas_de_la_Terap%C3%A9utica_13_ed)
2. A, P. R. A., Marta, L. M. A., & Ileana, G. L. (s. f.). *Antiinflamatorios no esteroideos (AINES): Consideraciones para su uso estomatológico*. [http://scielo.sld.cu/scielo.php?script=sci\\_arttext&pid=S0034-75072002000200004](http://scielo.sld.cu/scielo.php?script=sci_arttext&pid=S0034-75072002000200004)
3. De Melo, R. S. (2014, 26 marzo). *Farmacos antiinflamatorios esteroideos* [Diapositivas]. SlideShare. <https://es.slideshare.net/slideshow/farmacos-antiinflamatorios-esteroideos/32782788#5>
4. *Medicamentos antiinflamatorios no esteroideos (AINE) | Cigna*. (s. f.). <https://www.cigna.com/es-us/knowledge-center/hw/medicamentos-antiinflamatorios-no-esteroideos-sid7998#:~:text=Los%20medicamentos%20antiinflamatorios%20no%20esteroideos,los%20medicamentos%20de%20venta%20libre%20>
5. *MICROB: Analgésicos*. (s. f.). <https://www.iztacala.unam.mx/rrivas/NOTAS/Notas%20Microbiologia/5.6analg%C3%A9sicos.html>
6. uDocz. (2024c). *Corticoesteroides*. uDocz. <https://www.udocz.com/apuntes/516600/corticoesteroides-farmacologia>
7. G, B. (2016, 13 octubre). *Aines*. [Diapositivas]. SlideShare. <https://es.slideshare.net/coniconstanzaaaa/aines-67096699#28>