



Mi Universidad

Resumen

Brayan Henry Morales Lopez

AINEs

Parcial I

Terapia farmacológica

Dr. Adolfo Bryan Medellín

Licenciatura en medicina humana

Cuarto semestre

Los antiinflamatorios no esteroideos (AINEs) son un grupo heterogéneo de fármacos ampliamente utilizados debido a sus propiedades analgésicas, antipiréticas, antiinflamatorias y antiagregantes plaquetarios. Su mecanismo de acción principal es la inhibición de las enzimas ciclooxigenasas (COX), responsables de la síntesis de prostaglandinas.

Para añadir un poco de historia: El uso de los AINEs se remonta a la antigüedad con la utilización de la salicilina, un compuesto presente en la corteza del sauce. Se tiene registro de su uso en Egipto, Grecia y Roma, siendo Hipócrates uno de los primeros en recomendar su empleo para el alivio del dolor.

El primer AINE comercializado fue la aspirina (ácido acetilsalicílico, AAS), sintetizada en 1897 por Felix Hoffmann en los laboratorios Bayer. A partir de entonces, se desarrollaron nuevas generaciones de AINEs con mejores perfiles de seguridad y eficacia.

Clasificación de los AINEs

1. Según su estructura química (derivados del ácido acético, ácido propiónico, oxicams, etc.).
 2. Según su selectividad por las enzimas COX:
 - A. No selectivos: Inhiben tanto COX-1 como COX-2 (ej. ibuprofeno, naproxeno).
 - B. Selectivos COX-2: Diseñados para reducir los efectos adversos gastrointestinales (ej. celecoxib).
 - C. Otros con mecanismos mixtos (ej. paracetamol, que inhibe COX-3).
- Mecanismo de Acción

Los AINEs bloquean la actividad de las enzimas COX-1 y COX-2, impidiendo la síntesis de prostaglandinas y tromboxanos, sustancias que median el dolor, la inflamación y la fiebre.

- COX-1: Se encuentra en tejidos sanos y regula funciones fisiológicas como la protección gástrica y la función plaquetaria.
- COX-2: Se expresa en respuesta a inflamación, por lo que su inhibición es la principal responsable del efecto terapéutico.

Efectos Terapéuticos

Los principales efectos de los AINEs son:

- Analgésico: Reducen el dolor al disminuir la producción de prostaglandinas.

- Antiinflamatorio: Disminuyen la respuesta inflamatoria, especialmente en enfermedades como artritis.
- Antipirético: Actúan sobre el centro termorregulador del hipotálamo.
- Antiagregante plaquetario: Algunos AINEs, como la aspirina, inhiben la formación de tromboxanos, reduciendo la coagulación.

Farmacocinética

La absorción de los AINEs suele ser rápida tras su administración oral, alcanzando concentraciones plasmáticas máximas en 1-2 horas. Se metabolizan principalmente en el hígado por el citocromo P450 y se eliminan por riñón o vía biliar.

Efectos Adversos e Interacciones

- Gastrointestinales: Irritación gástrica, úlceras y sangrado (más frecuente con COX-1).
- Renales: Retención de sodio y agua, insuficiencia renal en pacientes predispuestos.
- Cardiovasculares: Riesgo de trombosis con los selectivos COX-2.
- Hepáticos: Riesgo de hepatotoxicidad con algunos AINEs.
- Neurológicos: Cefalea, mareo o confusión en algunos casos.

Las interacciones farmacológicas más relevantes:

- Aumento del riesgo de hemorragias con anticoagulantes.
- Mayor toxicidad renal cuando se combinan con diuréticos o IECA.
- Disminución del efecto antihipertensivo de algunos fármacos.

Diferencias entre los AINEs

- AINEs de acción corta (ibuprofeno, diclofenaco): Se utilizan en cuadros agudos por su rápida acción y menor duración en el organismo.
- AINEs de acción prolongada (naproxeno, piroxicam): Se prefieren para enfermedades crónicas debido a su vida media más larga.
- AINEs selectivos COX-2 (celecoxib): Indicados cuando se busca reducir el riesgo de toxicidad gastrointestinal.

Aplicaciones Terapéuticas

Los AINEs se utilizan en diversas patologías, ajustando la elección del fármaco según el cuadro clínico y el perfil del paciente.

- Dolor musculoesquelético y articular: En artritis, tendinitis, lumbalgia y esguinces.
- Fiebre: En infecciones virales o bacterianas cuando se requiere control sintomático.
- Enfermedades inflamatorias crónicas: Como artritis reumatoide o espondilitis anquilosante.

- Disminución del riesgo cardiovascular: La aspirina en dosis bajas se usa en prevención de eventos trombóticos.
- Cólicos menstruales (dismenorrea): Inhiben la producción de prostaglandinas en el endometrio, reduciendo el dolor.

1. Derivados del Ácido Acético

- Indometacina: Potente antiinflamatorio. Usado en artritis reumatoide, espondilitis anquilosante y cierre del conducto arterioso en neonatos. Alto riesgo de efectos adversos gastrointestinales y renales.
- Diclofenaco: Alta penetración en tejidos inflamados. Se emplea en dolor musculoesquelético, artritis, dismenorrea y migraña. Disponible en diversas formulaciones (oral, tópica, inyectable). Riesgo de hepatotoxicidad con uso prolongado.
- Ketorolaco: Potente analgésico. Uso limitado a corto plazo en dolor postoperatorio y cólico nefrítico. No se recomienda en tratamientos prolongados por toxicidad renal.
- Sulindaco: Profármaco con menor toxicidad renal. Indicado en artritis reumatoide y gota.

2. Derivados del Ácido Propiónico

- Ibuprofeno: Acción rápida y vida media corta. Indicado en fiebre, dolor leve-moderado, artritis y dismenorrea. Menos gastrolesivo que otros AINEs.
- Naproxeno: Mayor vida media que el ibuprofeno. Usado en enfermedades inflamatorias crónicas como artritis y espondilitis anquilosante. Mayor riesgo cardiovascular en comparación con otros AINEs del grupo.
- Ketoprofeno: Potente antiinflamatorio y analgésico. Disponible en presentaciones tópicas y orales.

3. Derivados del Ácido Enólico (Oxicams)

- Piroxicam: Vida media larga (hasta 50 horas), permite dosificación una vez al día. Indicado en artritis reumatoide y osteoartritis. Alto riesgo de toxicidad gastrointestinal.
- Meloxicam: Mayor selectividad por COX-2 en comparación con otros oxicams. Menor riesgo de efectos adversos gástricos. Uso en enfermedades inflamatorias crónicas.

4. Derivados de las Pirazolonas

- Metamizol (Dipirona): Potente analgésico y antipirético. Uso en fiebre resistente y dolor agudo. Riesgo de agranulocitosis, restringido en algunos países.

5. Derivados del Ácido Antranílico (Fenamatos)

- Ácido mefenámico: Eficaz en dismenorrea y dolor musculoesquelético. Alta tasa de efectos adversos gastrointestinales.
- Ácido flufenámico: Similar al ácido mefenámico pero con mayor toxicidad.

6. Derivados del Ácido Salicílico

- Ácido acetilsalicílico (Aspirina): Usado en analgesia, fiebre, inflamación y prevención cardiovascular. Inhibidor irreversible de COX-1. A dosis bajas es antiagregante plaquetario. Riesgo de síndrome de Reye en niños.

7. Inhibidores Selectivos de COX-2 (Coxibs)

- Celecoxib: Menor toxicidad gastrointestinal que los AINEs no selectivos. Uso en osteoartritis, artritis reumatoide y dolor crónico. Precaución en pacientes con riesgo cardiovascular.
- Etoricoxib: Mayor selectividad por COX-2 que celecoxib. Indicado en gota y enfermedades inflamatorias crónicas. Mayor riesgo cardiovascular.

Bibliografías:

1. Regueras, E., Velázquez, I., & Torres, L. M. (2024). *Actualización en farmacología de los antiinflamatorios no esteroideos: actualización*. Multidisciplinary Pain Journal, 4. Sociedad Española Multidisciplinar del Dolor.
2. *Katzung, B. G. (2018). Farmacología básica y clínica (14ª ed.). McGraw-Hill Education*

