



UDS

Mi Universidad

Mireya Pérez Sebastián.

Antiinflamatorios no esteroides (AINES).

Parcial I.

Terapéutica Farmacológica.

Dr. Adolfo Bryan Medellín Guillen.

Cuarto Semestre.

Medicina Humana.

Comitán De Domínguez, Chiapas. 03 de Marzo de 2025.

ANTIINFLAMATORIO NO ESTEROIDEO (AINES).

Los AINES, son un grupo heterogéneo de fármacos con propiedades como Antiinflamatorios, Analgésicos, Antipiréticos. Esta destina a la inhibición de una COX, enzima del ácido Araquidónico, lo cual produce una disminución en la síntesis de PG. Los AINES se dividen en grupos, según su estructura química y selectividad de COX-1 y COX-2. Como salicilatos acetilados, salicilatos no acetilado. Estos se clasifican por su estructura química y la selectividad sobre la enzima COX. El paracetamol no es un fármaco antiinflamatorio, debido que no tiene su efecto terapéutico, su mecanismo de acción actúa sobre la enzima COX-3. Los mecanismos de acción, los AINES en la inhibición de la enzima COX. Que cataliza la síntesis de PG a partir del ácido araquidónico AA. Los AINES, reduce la COX, por una inhibición salvo AAS, ejerce una inhibición irreversible de COX. El AAS entra el canal activo COX. Cox-1 tromboxanos, Cox-2 prostaglandinas, Cox-3 derivado de la Cox-1.

Inhibición: la inhibición irreversible, es como en el caso de la Aspirina. La inhibición competitiva, como en el caso del ibuprofeno. Inhibición reversible no competitivo como en el caso del paracetamol.

AINES selectivos, las cuales se clasifican en muy selectivos a la COX-1, como, ketorolaco, flurbiprofeno. Poco selectivo COX-1, como, ibuprofeno, ketoprofeno, AAS, paracetamol, y el naproxeno. Los muy selectivos a la COX-2 como, Etoricoxibi. Poco selectivo a la COX-2 como, diclofenaco, piroxicam, celecoxib.

Los AINES que son derivados, en las cuales se derivan según su clasificación como, derivados de ácido salicílico: A. acetilsalicílico, Etenzamida, Salicilamida, y Diflunisal. Los derivados de ácido acético como: diclofenaco, indometacina, aceclofenaco, ketorolaco. Los derivados de ácido propiónico como: ibuprofeno, ketoprofeno, naproxeno, dexketoprofeno, dexibuprofeno. Los que son Oxicams como: piroxicam, tenoxicam, meloxicam, lornoxicam. Los que son Coxibs como: etoricoxib, parecoxib, celecoxib.

Sus mecanismos antipiréticos, es del desarrollo de la fiebre, de lo que las toxinas bacterianas y otros pirógenos estimulan la producción de citoquinas por parte de los leucocitos. Todos los AINES reducen la fiebre inhibiendo la síntesis de PG en el hipotálamo. La COX-1, es tejido de la mucosa gástrica y riñones. Enzima actúa y reduce la producción de PGE2 y PGI2 protectoras mucosas gástricas. Las cuales genera efecto adverso como úlceras gástricas. La COX-2, para el proceso de la inflamación. Los COXIBS actúan sobre la enzima y las cuales tienen menos efectos adversos a nivel gástrico que actúan sobre COX-1. Ya que la COX-2, es la enzima de preferencia de vasos sanguíneos para la síntesis de PGI2 que protege frente a la isquemia vascular. La COX-3, es derivado de la COX-1, y lo cual tiene bajo efecto antiinflamatorio, ya que produce diferentes polipéptidos altamente sensibles a los fármacos analgésicos y antipiréticos, y solo que tendrá bajo efecto antiinflamatorio.

Los efectos terapéuticos de los AINES, las cuales son Analgésico, antipirético, antiinflamatorio, anticoagulante. El efecto analgésico, es la que reduce el dolor causado por un daño tisular o por los mediadores inflamatorios que actúan sobre las terminaciones nerviosas. El efecto antipirético, es la que reduce la fiebre, las cuales son todos los AINES y como incluir el paracetamol. La fiebre se produce por una liberación de IL-1, PGE. El efecto antiinflamatorio es el efecto que procede para acción de PG. El efecto anticoagulante, son AINES que interfieren con la activación plaquetaria al inhibir la Cox plaquetaria bloqueando la activación de tromboxano A2.

La clasificación de los AINES según su estructura, los derivados de ácido salicílico: es un antiinflamatorio, analgésico, antipirético, y antiagregante. Inhibe la Cox reduciendo la formación de PG. Los derivados de ácido acético: es un antiinflamatorio, analgésico y antipirético. Los derivados de ácido propiónico: son inhibidores no selectivos de la COX. Son un analgésico, antiinflamatorio, y antipirético; Alteran la función plaquetaria e inhiben reversible. La Oxicams: es un antiinflamatorio e inhibe la Cox-1 y 2. La Coxibs: son un analgésico, antipirético, y antiinflamatorio, no inhiben la agregación plaquetaria, solo tiene Cox-1. La farmacocinética de los fármacos AINES; La AAS, tiene una vida media de 2 a 3 horas las cuales puede llegar a las 15 horas en dosis altas, y en 20 minutos ya tiene un efecto, y son de un metabolito activo, sí. El ibuprofeno, su vida media es de 2 horas y Tmax es de 21 minutos con arginina y si solo ibuprofeno es de 1,5 horas. El diclofenaco su vida media es de 1 a 2 horas y Tmax es de 20 minutos. Ketoprofeno, su vida media es de 2, o 6 de forma retard. El naproxeno su vida media es de 10- 14 horas y lo cual tiene un efecto a 1 a 2 horas. El ketorolaco, su vida media es de 4-10 horas y tiene un efecto 1, 2, 3 horas. El paracetamol su vida media es de 1-3 horas y tiene un efecto 0,5- 2 horas.

El Ácido acetilsalicílico, se absorbe bien en el intestino, es hidrolizado rápidamente por la esterasa plasmática y esto implica su vida media corta 15 minutos. La velocidad de excreción se ve afectada por el PH, por lo que en caso de sobredosis se alcaliniza la orina mediante bicarbonatos sódico para incrementar la ionización y la eliminación del AS.

El ibuprofeno, ketoprofeno y naproxeno; sufren metabolismo extenso hasta metabolitos inactivos en el hígado, antes de la excreción renal. El naproxeno tiene vida media larga de 14 horas, ya que el ibuprofeno y el ketoprofeno es de 2 horas. La distribución es con fuerte unión a proteínas plasmáticas en un 99%. Se metaboliza en el hígado por hidroxilación y carboxilación, dando metabolitos que carecen de actividad farmacológica. Se eliminan en forma de metabolitos inactivos. Los AINES, son un grupo de fármacos heterogéneo, que tienen un mecanismo de acción en la inhibición de enzimas COX. Todos estos fármacos son AINES, que tienen efectos antiinflamatorio, analgésico, antipirético, antiagregante. Debido por la inhibición de la Cox.

Bibliografía

1. Actualización en farmacología de los antiinflamatorio no esteroides: actualización. Revista de la sociedad española multidisciplinar del dolor/ Journal of the multidisciplinary spanish pain society.