



Mi Universidad

Anamim Cordero Aranda

Parcial I

Terapia Farmacologica

Dr. Adolfo Brayan Medellin Guillen

Licenciatura en Medicina Humana

Cuarto Semestre

Comitán de Domínguez, Chiapas, a 3 de marzo del 2025

Definición

Los Antiinflamatorios No Esteroideos (AINEs) son un grupo de fármacos ampliamente utilizados en la práctica médica por sus propiedades analgésicas, antipiréticas y antiinflamatorias. Su mecanismo de acción principal es la inhibición de las enzimas ciclooxigenasas (COX), las cuales están involucradas en la conversión del ácido araquidónico en prostaglandinas. Estas moléculas juegan un papel clave en la inflamación, el dolor y la regulación de la temperatura corporal. A pesar de su eficacia en el tratamiento de diversas afecciones inflamatorias y dolorosas, su uso prolongado o inadecuado puede generar efectos adversos, especialmente a nivel gastrointestinal y cardiovascular.

Clasificación por estructura química

Los AINEs se agrupan en diferentes categorías según su estructura química, lo que influye en su potencia, selectividad y perfil de seguridad. Los salicilatos, como el ácido acetilsalicílico, son los más antiguos y se caracterizan por su acción analgésica, antiinflamatoria y antiagregante plaquetario, siendo la aspirina el representante más conocido de este grupo. Los derivados del ácido propiónico incluyen fármacos como el ibuprofeno, el naproxeno y el ketoprofeno, los cuales presentan un equilibrio entre eficacia y tolerabilidad, con menor riesgo de toxicidad gastrointestinal en comparación con otros AINEs.

Por otro lado, los derivados del ácido acético, como el diclofenaco, la indometacina y el ketorolaco, tienen una potente acción antiinflamatoria, aunque pueden presentar un mayor riesgo de efectos adversos, especialmente a nivel gastrointestinal. Dentro de este grupo, el ketorolaco es conocido por su potente efecto analgésico, por lo que se usa con más frecuencia en el manejo del dolor agudo postoperatorio, aunque su administración debe ser de corta duración debido a su toxicidad. Los oxicams, como la piroxicam y el meloxicam, poseen una vida media prolongada, lo que permite su administración una vez al día, aunque su uso prolongado puede incrementar el riesgo de toxicidad gastrointestinal y renal. Finalmente, los inhibidores selectivos de la COX-2, también conocidos como coxibs, como el celecoxib y el etoricoxib, fueron desarrollados para reducir los efectos adversos gástricos asociados a los AINEs tradicionales, aunque su seguridad cardiovascular sigue siendo motivo de debate.

Clasificación por selectividad sobre enzimas COX

Además de su estructura química, los AINEs también se clasifican según su selectividad sobre las enzimas ciclooxigenasas. La COX-1 se encuentra en muchos tejidos y participa en la síntesis de prostaglandinas que protegen la mucosa gástrica, regulan la función renal y facilitan la agregación plaquetaria. Por otro lado, la COX-2 se expresa principalmente en situaciones de inflamación y participa en la producción de prostaglandinas proinflamatorias.

Los AINEs no selectivos, como la aspirina, el ibuprofeno y el diclofenaco, inhiben tanto la COX-1 como la COX-2, lo que les confiere una potente acción antiinflamatoria, pero también aumenta el riesgo de efectos adversos, como daño gastrointestinal y alteraciones en la función renal. Los inhibidores preferenciales de la COX-2, como el meloxicam y la

nimesulida, ofrecen un perfil de seguridad más equilibrado al reducir la inflamación con menor impacto sobre la mucosa gástrica. Finalmente, los inhibidores selectivos de la COX-2, como el celecoxib y el etoricoxib, fueron diseñados para evitar la toxicidad gastrointestinal, aunque su uso se ha asociado con un mayor riesgo de eventos cardiovasculares.

Mecanismo de acción

El efecto terapéutico de los AINEs se debe a su capacidad para inhibir la actividad de las ciclooxigenasas, reduciendo la síntesis de prostaglandinas, lo que disminuye la inflamación, el dolor y la fiebre. La inhibición de la COX-1 puede provocar efectos adversos, como úlceras gástricas y alteraciones en la función renal, ya que esta enzima participa en la producción de prostaglandinas protectoras del estómago y los riñones. En cambio, la inhibición de la COX-2 reduce la inflamación con menos efectos secundarios gastrointestinales, aunque puede incrementar el riesgo de trombosis debido a la disminución de prostaciclina, una molécula que protege contra la agregación plaquetaria excesiva.

El paracetamol, aunque no es considerado un AINE en sentido estricto debido a su escaso efecto antiinflamatorio, parece ejercer su acción sobre una tercera isoforma de la enzima, la COX-3, que se encuentra principalmente en el sistema nervioso central. Esta inhibición explicaría su potente efecto analgésico y antipirético sin afectar la mucosa gástrica ni la función plaquetaria.

Características de cada grupo según su estructura química

Cada subgrupo de AINEs tiene propiedades particulares que influyen en su uso clínico. La aspirina, por ejemplo, es ampliamente utilizada tanto como antiinflamatorio como en la prevención de eventos cardiovasculares gracias a su capacidad para inhibir la agregación plaquetaria de manera irreversible. Sin embargo, su uso prolongado puede provocar úlceras gástricas y hemorragias. Los AINEs derivados del ácido propiónico, como el ibuprofeno y el naproxeno, son bien tolerados y tienen un buen equilibrio entre eficacia y seguridad, siendo una de las opciones más comunes en el tratamiento del dolor y la inflamación.

El diclofenaco es un AINE con una potente acción antiinflamatoria, pero su uso se ha asociado con un mayor riesgo cardiovascular en comparación con otros AINEs. La indometacina, debido a su alta potencia, suele reservarse para el tratamiento de condiciones inflamatorias graves, aunque su perfil de efectos adversos limita su uso a corto plazo. El ketorolaco, por su parte, es un analgésico muy potente que se utiliza en el manejo del dolor agudo, pero no debe emplearse de forma prolongada debido a su elevada toxicidad renal y gastrointestinal.

Los oxicams, como la piroxicam y el meloxicam, presentan una acción prolongada, lo que permite su administración una vez al día, aunque requieren precaución en pacientes con riesgo de toxicidad gastrointestinal. Los inhibidores selectivos de la COX-2, como el celecoxib y el etoricoxib, han demostrado ser eficaces en el tratamiento del dolor

inflamatorio con menor riesgo de ulceración gástrica, aunque su seguridad cardiovascular sigue siendo objeto de debate.

Interacciones farmacológicas

Los AINEs pueden interactuar con diversos fármacos, modificando su eficacia o aumentando su toxicidad. Se ha observado que pueden elevar las concentraciones de litio en sangre, aumentando el riesgo de toxicidad, y reducir el aclaramiento del metotrexato y de los aminoglucósidos, lo que incrementa el riesgo de toxicidad renal y hematológica. También pueden interferir con el efecto de los antihipertensivos, como los inhibidores de la enzima convertidora de angiotensina y los bloqueadores de los receptores de angiotensina II, disminuyendo su eficacia.

La combinación de AINEs con diuréticos ahorradores de potasio puede provocar hiperpotasemia, mientras que el uso de altas dosis de salicilatos se ha relacionado con efectos hipoglucemiantes que pueden interferir con el control de la diabetes. La aspirina, en particular, puede potenciar el efecto anticoagulante de la warfarina, aumentando el riesgo de hemorragias. También se ha documentado que el ibuprofeno puede reducir el efecto antiplaquetario de la aspirina si se administran de manera conjunta, lo que podría comprometer su acción en la prevención de eventos cardiovasculares.

Fármaco	Familia química	Indicaciones terapéuticas	Posología recomendada	Observaciones especiales
Ácido Acetilsalicílico (Aspirina)	Salicilatos	Dolor leve a moderado, fiebre, inflamación, prevención cardiovascular	325-650 mg cada 4-6 h (dolor/fiebre). Dosis antiagregante: 75-100 mg/día	Inhibe irreversiblemente COX-1, efecto antiagregante plaquetario, riesgo de hemorragias
Ibuprofeno	Derivado del ácido propiónico	Dolor leve a moderado, fiebre, artritis reumatoide, dismenorrea	200-400 mg cada 4-6 h (máx. 1200-2400 mg/día)	Menos gastrolesivo que otros AINEs, puede interferir con el efecto antiplaquetario de la aspirina
Naproxeno	Derivado del ácido propiónico	Artritis reumatoide, osteoartritis, gota, dismenorrea, dolor musculoesquelético	250-500 mg cada 12 h (máx. 1000 mg/día)	Vida media larga, mayor riesgo cardiovascular en comparación con ibuprofeno
Ketoprofeno	Derivado del ácido propiónico	Dolor moderado a severo, inflamación, artritis	50-100 mg cada 6-8 h (máx. 300 mg/día)	Mayor toxicidad gastrointestinal en comparación con otros del grupo
Diclofenaco	Derivado del ácido acético	Dolor agudo, inflamación, artritis, dismenorrea	50 mg cada 8 h (máx. 150 mg/día). En gel: 2-4 g cada 6 h	Potente antiinflamatorio, pero con mayor riesgo cardiovascular
Indometacina	Derivado del ácido acético	Artritis, espondilitis anquilosante, cierre del ductus arterioso en neonatos	25-50 mg cada 8-12 h (máx. 200 mg/día)	Mayor riesgo de efectos adversos gastrointestinales y neurológicos
Ketorolaco	Derivado del ácido acético	Dolor agudo moderado a severo (postoperatorio, cólico renal)	Oral: 10 mg cada 6-8 h (máx. 40 mg/día, máx. 5 días). IV: 30 mg cada 6 h	Uso limitado por riesgo de toxicidad renal y gástrica, contraindicado en pediatría
Piroxicam	Oxicams	Artritis reumatoide, osteoartritis, dolor musculoesquelético	20 mg 1 vez al día o 10 mg cada 12 h	Vida media larga, mayor riesgo de úlceras gástricas
Meloxicam	Oxicams	Artritis reumatoide, osteoartritis	7.5-15 mg 1 vez al día	Preferencia por COX-2 a dosis bajas, menor

				toxicidad digestiva en comparación con otros AINEs
Celecoxib	Inhibidor selectivo COX-2	Artritis reumatoide, osteoartritis, dolor agudo	200 mg/día en 1-2 dosis	Menor riesgo gástrico, pero aumenta riesgo cardiovascular
Etoricoxib	Inhibidor selectivo COX-2	Osteoartritis, artritis reumatoide, gota	60-120 mg/día (dependiendo de la indicación)	Mayor selectividad por COX-2, contraindicado en pacientes con alto riesgo cardiovascular
Paracetamol	Inhibidor de COX-3 (en estudio)	Fiebre, dolor leve a moderado	500-1000 mg cada 6-8 h (máx. 4 g/día)	No tiene efecto antiinflamatorio significativo, hepatotóxico en sobredosis

BIBLIOGRAFIA:

https://www.mpainjournal.com/FicherosRev/331/6/Art_1059-ESP_3.pdf

<https://rheumatology.org/patients/aines-medicamentos-antiinflamatorios-no-esteroides>

<https://www.msdmanuals.com/es/hogar/multimedia/table/c%C3%B3mo-funcionan-los-f%C3%A1rmacos-antiinflamatorios-no-esteroides>