



Mi Universidad

Integrantes del equipo: Dulce Sinai Goicochea Avendaño.

Nombre del tema: Resumen de AINES (antiinflamatorios no esteroideos).

Parcial: primer parcial.

Nombre de la materia: terapéutica farmacológica.

Nombre del profesor: Dr. Adolfo Brayan Medellín Guillen.

Nombre de la licenciatura: Medicina Humana

Semestre: Cuarto semestre.

Comitán de Domínguez, Chiapas a 03 de marzo del 2025.

Introducción.

Los AINES (Anti-Inflamatorios No Esteroideos) son un grupo de medicamentos ampliamente utilizados en la práctica médica para aliviar el dolor, reducir la inflamación y bajar la fiebre. Estos fármacos actúan inhibiendo la enzima ciclooxigenasa (COX), que desempeña un papel clave en la síntesis de prostaglandinas, sustancias químicas responsables de la inflamación y el dolor en el cuerpo. Entre los AINES más conocidos se encuentran el ibuprofeno, el naproxeno y la aspirina, cada uno con sus propias indicaciones y perfil de efectos secundarios. Aunque son efectivos y accesibles, su uso debe ser cuidadoso debido a los posibles efectos adversos, especialmente en el sistema gastrointestinal y cardiovascular. La comprensión adecuada de su mecanismo de acción, así como de sus beneficios y riesgos, es esencial para el manejo seguro y eficaz de diversas condiciones clínicas, desde dolores de cabeza y artritis hasta enfermedades inflamatorias crónicas.

"AINES"

Los AINES, también conocidos como los antiinflamatorios no esteroideos son una familia farmacológica destinada a la inhibición de una de las dos COX, enzimas involucradas en la cascada del Ácido Araquidónico el cual es el responsable de una disminución de la síntesis de prostaglandinas, la cual se dividen en grupos según su estructura química y selectividad (COX-1 y COX-2).

CLASIFICACION DE LOS AINES.

Por lo general se usa la clasificación por su estructura química y la clasificación según su selectividad sobre las enzimas COX, Por lo general se usa la clasificación por su estructura química y la clasificación según su selectividad sobre las enzimas COX. Paracetamol no es fármaco antiinflamatorio ya que no cumple esa característica, pero por mecanismo de acción se puede incluir en el grupo porque actúa sobre la COX-3.

- Derivados del ácido salicílico: Aspirina (ácido acetilsalicílico).
- Derivados del ácido acético: Indometacina, Diclofenaco, Sulindaco.
- Derivados del ácido propiónico: Ibuprofeno, Naproxeno, Ketoprofeno.
- Oxicams: Piroxicam, Meloxicam.
- Derivados del ácido enólico: Fenilbutazona, Oxyphenbutazona.
- COX-2 selectivos (coxibes): Celecoxib, Etoricoxib, Parecoxib.

MECANISMO DE ACCIÓN.

Principal MA es la inhibición de la COX, que sintetiza PG a partir del AA y de otros ac grasos precursores.

- ❖ COX-1: está continuamente expresado en los tejidos, principalmente en la mucosa gástrica y en los riñones, la ingesta frecuente de AINES que actúan sobre esta enzima reduce la producción de PGE2 y PGI2, protectoras de la mucosa gástrica, lo que genera efectos adversos de estos fármacos en forma de úlceras gástrica.
- ❖ COX-2.- actividad sólo durante los procesos de inflamación. Los Coxib que actúan sobre esta enzima tienen menos efectos adversos a nivel gástrico. Es la enzima de preferencia en los vasos sanguíneos para la síntesis de PGI2 que protege frente a la isquemia vascular. Fármacos selectivos COX-2 se asocian a efectos adversos cardiovasculares, como aumento de enfermedad cardiovascular e isquemia.
- ❖ COX-3.- produce diferentes polipéptidos sensibles a los fármacos analgésicos-antipiréticos, pero con bajo efecto antiinflamatorio. Se expresa con más intensidad en la glándula pituitaria y el hipotálamo lo que desencadena efectos antipiréticos del Paracetamol.

ACIDO ACETILSALICILICO.

- Antiinflamatorio, analgésico, antipirético y antiagregante. Inhibe la COX reduciendo la formación de PG, lo que impide la estimulación de receptores de dolor a nivel periférico. Adicionalmente tiene efectos centrales a nivel de hipotálamo. • Los efectos del ASA son dosis dependiente.
- Efecto antiagregante plaquetario: 80-160 mg.
- Efecto analgésico y antipirético: 650-975 mg.
- Efectos antiinflamatorios y acufenos: 3-6 g.
- Hiperventilación y alcalosis respiratorias: 6-10 g.
- Fiebre, deshidratación y acidosis metabólica: 10-12 g.
- Shock, coma, insuficiencia respiratoria, insuficiencia renal y muerte: 20-30 g.

DERIVADOS DEL ACIDO PROPIÓNICO; IBUP, KETOPROF Y NAPROX.

Son inhibidores no selectivos de la COX y ejercen acción analgésica, antiinflamatoria y antipirética. Pueden alterar la función plaquetaria y alargar el tiempo de sangrado. Inhibidores reversibles.

- AAS: cumplen con los 4 efectos esenciales de los AINES, (analgésico, antipirético, antiinflamatorio y antiagregante plaquetario), sin embargo, en el efecto antiplaquetario es irreversible.
- Paracetamol: cuenta con 3 efecto de los AINES (analgésicos, antipiréticos y débil efecto antiinflamatorio), No tiene un efecto antiagregante plaquetario.
- Ibuprofeno: cuenta con 3 efecto de los AINES (analgésicos, antipiréticos y efecto antiinflamatorio), con efecto reversible de 5 hrs en el efecto antiagregante plaquetario.

- Ketoprofeno: cuenta con 3 efecto de los AINES (analgésicos, antipiréticos y efecto antiinflamatorio), con efecto reversible de 2 hrs en el efecto antiagregante plaquetario.
- Naproxeno: cuenta con 3 efecto de los AINES (analgésicos, antipiréticos y efecto antiinflamatorio), con efecto reversible de 20 hrs en el efecto antiagregante plaquetario.
- Piroxicam: cuenta con 3 efecto de los AINES (analgésicos, antipiréticos y efecto antiinflamatorio), con efecto reversible de 50 hrs en el efecto antiagregante plaquetario.
- Celebrex: cuenta con 3 efecto de los AINES (analgésicos, antipiréticos y efecto antiinflamatorio), con efecto reversible de 10 hrs en el efecto antiagregante plaquetario.

DERIVADOS DEL ACIDO ACETICO;

INDOMETACINA: Antiinflamatorio, analgésico y antipirético. Inhibición reversible de la COX. Tiene más tendencia a causar efectos adversos por lo que suele ser fármaco de reserva para situaciones agudas moderadas a graves. Se usa para tratar el conducto arterioso permeable en lactantes por la inhibición de la síntesis de PG.

DICLOFENACO: Comúnmente prescrito para tratar el dolor y la inflamación en condiciones como la artritis reumatoide, osteoartritis y espondilitis anquilosante.

ACECLOFENACO: Similar al diclofenaco, se utiliza para aliviar el dolor y la inflamación en enfermedades como la osteoartritis y la artritis reumatoide.

KETOROLACO: Un AINE potente que se utiliza a corto plazo para el tratamiento del dolor moderado a severo, generalmente después de cirugías o lesiones.

OXICAMS: PIROXICAM Y MELOXICAM.

- Antiinflamatorio con potencia similar al naproxeno o ASA, el meloxicam inhibe COX-1 y 2, con más preferencia por COX-2. A dosis altas es una AINE no selectivo.
- Piroxicam analgésico, antipirético y antiinflamatorio. Reduce la producción de factor reumatoide sistémico y sinovial.

PIROXICAM: Se utiliza para el tratamiento del dolor e inflamación en condiciones como la artritis reumatoide y la osteoartritis. Piroxicam tiene una vida media larga, lo que significa que puede ser tomado una vez al día y aún proporcionar alivio prolongado del dolor y la inflamación. Sin embargo, debido a su vida media larga, también puede tener un mayor riesgo de efectos secundarios gastrointestinales.

MELOXICAM: Similar a piroxicam, meloxicam se utiliza para aliviar el dolor y la inflamación en enfermedades como la artritis reumatoide y la osteoartritis. Meloxicam es conocido por tener un perfil de seguridad algo mejorado en comparación con otros AINES, ya que se asocia con un menor riesgo de efectos secundarios gastrointestinales. Esto lo convierte en una opción popular para tratamientos a largo plazo en pacientes con artritis.

ACIDO HETEROARILACÉTICOS: DICLOFENACO Y KETOROLACO.

- **El diclofenaco:** es más potente que indometacina y naproxeno. Actividad analgésica, antiinflamatoria y antipirética.
- **Ketorolaco:** actividad analgésica potente. Se usa a corto plazo en dolor moderado como postoperatorio; hasta 5 días. Evitar su uso en pediatría y no superar dosis de 40 mg/día.

INHIBIDORES SELECTIVOS: CELECOXIB, ETORICOXIB Y PARECOXIB.

- Efecto analgésico, antipirético y antiinflamatorio, pero no inhiben la agregación plaquetaria porque las plaquetas sólo tienen COX-1. Tienen inhibiciones selectivas COX-2.
- Celecoxib: es 10-20x más potente sobre COX-2. No afecta el tromboxano plaquetario, por lo que carece de actividad anticoagulante. Actividad antiinflamatoria potente sin producir toxicidad digestiva.

PARAMETROS FARMACOCINETICOS DE LOS AINES.

AAS: Cuenta con una vida media de 2-3 hrs (cuenta con metabolitos activos como AS) y puede prolongarse a 15 hrs, su T_{max} se dará a los 20 minutos posterior a ser ingerido.

IBUPROFENO: Cuenta con una vida media de 2 hrs (No cuenta con metabolitos activos) y su T_{max} se dará a los 21 minutos (arginina) 1,5 horas (ibuprofeno solo).

DICLOFENACO: Cuenta con una vida media de 1-2 hrs (cuenta con metabolitos activos como: fenolíticos poco activos) y su T_{max} se dará a los 20 minutos.

KETOTROFENO: Cuenta con una vida media de 2-6 hrs (retal), (No cuenta con metabolitos activos) y su T_{max} se dará a los 0,5-2,6,-7 hrs.

NAPROXENO: Cuenta con una vida media de 10-14 hrs (No cuenta con metabolitos activos) y su T_{max} se dará a los 1-2 hrs

KETOROLACO: Cuenta con una vida media de 4-10 hrs (tiene metabolitos muy pocos activos) y su T_{max} se dará a los 1,2,3 hrs (im), 1,5-4 (oral).

PIROXICAM: Cuenta con una vida media de 57 hrs y su T_{max} se dará 3-5 hrs (oral), 3-5 hrs (rectal), 45 minutos (IM).

PARACETAMOL: Cuenta con una vida media de 1-3 hrs (tienen metabolitos hepatotóxicos) y su Tmax se dará a los 0,5-2 hrs y en niños 1-5 hrs.

CELECOBIX: Cuenta con una vida media de 8-12 hrs (no tienen metabolitos activos) y su Tmax se dará a los 2-3 hrs.

INTERACCIONES.

- La mayoría se excreta por vía renal y pueden aumentar las concentraciones séricas y toxicidad de litio.
- Pueden reducir en aclaramiento del metrotexato y aminoglucósidos. • Interferir en efecto de fármacos antihipertensivos.
- Cuando se administra junto a diuréticos ahorradores de potasio, pueden causar retención de potasio y consecuente hiperpotasemia.
- Dosis elevadas de salicilato, se asocian a efecto hipoglucémico que puede alterar los efectos de antidiabéticos.
- El asa puede aumentar el efecto de la Warfarina y provocar hemorragias.

CONSIDERACIONES ESPECIALES

- El papel del paracetamol inhibiendo la COX-3 está todavía en estudio. Aunque no tiene efecto Al algunos autores consideran que es miembro de los AINES por este mecanismo de acción.
- El paracetamol a dosis >2 gr/día puede aumentar la actividad de los anticoagulantes orales.
- La sobredosis de ASA se puede producir con dosis de >100 mg/kg/día durante más de dos días.
- La sobredosis de Ibuprofeno produce síntomas a dosis superiores a 80-100 mg/kg a las cuatro horas de la ingesta.

- La sobredosis de paracetamol se evalúa en 4 fases. La mínima dosis tóxica es de 6 gr/día en adultos y >100 mg/kg/día en niños. Dosis superiores a 20-25 gr son fatales.

En conclusión, los AINEs son una clase de medicamentos ampliamente utilizados debido a su eficacia en el tratamiento del dolor, inflamación y fiebre. Su mecanismo de acción se basa en la inhibición de las enzimas ciclooxigenasas (COX), lo que reduce la producción de prostaglandinas, compuestos implicados en la respuesta inflamatoria y el dolor. Sin embargo, es importante tener en cuenta que el uso prolongado o incorrecto de los AINEs puede conllevar efectos secundarios significativos, como daño gastrointestinal, renal y cardiovascular. Por ello, su administración debe ser controlada y ajustada según las necesidades individuales de cada paciente.

Bibliografía

Mann J. Murder, Magic and Medicine. Oxford: Oxford University Press; 1992.

Bryan CP. The Papyrus Ebers. New York: Appleton; 1931.