



Mi Universidad

Resumen “AINES”

Alexander Gómez Moreno

Parcial I

Terapia Farmacológica

Dr. Adolfo Bryan Medellín Guillen

Medicina Humana

Cuarto Semestre

Comitán de Domínguez, Chiapas a 03 de marzo de 2025

Los fármacos antiinflamatorios no esteroideos (AINES) constituyen un grupo farmacológico heterogéneo con propiedades antipiréticas, analgésicas, antiinflamatorias y antiagregante plaquetario, que comparten un mecanismo de acción común basado en la inhibición de las enzimas ciclooxigenasas (COX). Estas enzimas catalizan la conversión del ácido araquidónico a prostaglandinas, prostaciclina y tromboxanos; además la eficacia y seguridad de estos fármacos varían en función de su estructura química y su selectividad hacia las diferentes isoformas de la COX, lo que determina su perfil de efectos adversos y sus indicaciones terapéuticas.

Por otro lado debemos saber que la inflamación empezara por un estímulo nocivo que puede ser físico, químico o biológico, este estímulo será detectado por las células residentes del sistema inmune, por lo consiguiente se desencadenara la liberación de mediadores inflamatorios como la histamina, citocinas y leucotrienos, los cuales harán cambios característicos de la inflamación. Un componente esencial de esta respuesta es la cascada del ácido araquidónico, ya que entenderemos el mecanismo de acción de estos fármacos; primero empieza la liberación del ácido araquidónico, que se encuentra en las membranas celulares compuestas por fosfolípidos, pero para que este se libere se necesita de la enzima Fosfolipasa A2, que será la encargada de liberar el ácido araquidónico al citoplasma. Una vez que el ácido araquidónico es liberado este tiene que ser metabolizado, por lo que tendrá dos vías, una es la vía de las lipooxigenasas (LOX) donde producirá leucotrienos y lipoxinas; por otra parte la segunda vía que es la de las ciclooxigenasas (COX) que producirá prostaglandinas, prostaciclina y tromboxanos que son mediadores inflamatorios y vasculares importantes, este proceso es catalizado por enzimas como la COX 1 (fisiológica), COX 2 (patológica) y COX 3; entonces el mecanismo de acción de los AINES se basara en la inhibición de las COX. En 2002 se identificó la COX 3, una variante específica del sistema nervioso central, sobre la que actúa el paracetamol, explicando su actividad analgésica y antipirética sin efectos antiinflamatorios significativos.

Los AINES pueden clasificarse atendiendo a su estructura química o a su selectividad sobre las enzimas COX. En función de su estructura, se dividen en varios grupos; dentro de los derivados del ácido salicílico, se encuentra la aspirina, que fue el primer AINE descubierto y aún es

ampliamente utilizado por su efecto antiagregante plaquetario. En la familia de los derivados del ácido propiónico se incluyen el ibuprofeno, el naproxeno y el ketoprofeno, fármacos con actividad antiinflamatoria moderada y un buen perfil de seguridad gastrointestinal en comparación con otros AINE. Los derivados del ácido acético, como la indometacina, el diclofenaco y el ketorolaco, poseen una potente actividad antiinflamatoria, pero presentan un mayor riesgo de efectos adversos gastrointestinales y renales. Los oxicams, como el piroxicam y el meloxicam, se caracterizan por su larga vida media, lo que permite una dosificación menos frecuente. Dentro de los derivados del ácido antranílico, el ácido mefenámico es uno de los más utilizados en el tratamiento del dolor menstrual. Finalmente, los coxibs, como el celecoxib, el etoricoxib y el parecoxib, son inhibidores selectivos de la COX-2, desarrollados con el objetivo de minimizar la toxicidad gastrointestinal sin comprometer la eficacia antiinflamatoria.

Desde el punto de vista de su selectividad sobre las enzimas COX, los AINE se dividen en inhibidores no selectivos de COX-1 y COX-2, inhibidores preferentes de COX-2 y los inhibidores selectivos de COX-2. Los AINE no selectivos, como la aspirina, el ibuprofeno, el naproxeno y el diclofenaco, inhiben ambas isoformas de la enzima, lo que explica su eficacia terapéutica, pero también su perfil de efectos adversos. Los inhibidores preferentes de COX 2, como el meloxicam, poseen una menor actividad sobre COX-1, lo que reduce en cierta medida la toxicidad digestiva. Los inhibidores selectivos de COX-2, conocidos como coxibs, como el celecoxib y el etoricoxib, presentan una mayor seguridad gastrointestinal, aunque su uso se ha visto limitado por el aumento del riesgo cardiovascular asociado a su administración prolongada.

Los AINE pueden presentar interacciones farmacológicas con diversos fármacos. Su administración concomitante con anticoagulantes orales, como la Warfarina, o con antiagregantes plaquetarios, como el clopidogrel, aumenta el riesgo de sangrado. También pueden potenciar la nefrotoxicidad cuando se combinan con inhibidores de la enzima convertidora de angiotensina (IECA), antagonistas de los receptores de angiotensina II (ARA II) o diuréticos. Además, su uso prolongado puede generar hepatotoxicidad, especialmente cuando se administran junto con fármacos como el metotrexato. Por otro lado, los AINE

pueden disminuir el efecto de los antihipertensivos, como los betabloqueantes y los diuréticos, lo que puede comprometer el control de la presión arterial en pacientes hipertensos.

En términos de su perfil de seguridad, los AINE presentan efectos adversos bien documentados; donde la toxicidad gastrointestinal es uno de los más relevantes y puede manifestarse en forma de dispepsia, úlceras gástricas y hemorragia digestiva. Los inhibidores selectivos de COX-2 presentan un menor riesgo de toxicidad digestiva, pero se han asociado con un aumento del riesgo cardiovascular, lo que ha llevado a la retirada de algunos de estos fármacos del mercado. La toxicidad renal es otra preocupación importante, especialmente en pacientes con insuficiencia renal preexistente o en aquellos que reciben tratamiento con fármacos nefrotóxicos. Además, algunos AINE pueden aumentar el riesgo de eventos trombóticos, como el infarto de miocardio y el accidente cerebrovascular, especialmente en pacientes con factores de riesgo cardiovascular.

Estos fármacos utilizan ampliamente en el tratamiento del dolor e inflamación en diversas patologías; son fármacos de primera línea en enfermedades reumatológicas, como la artritis reumatoide y la artrosis; a su vez se emplean en el manejo del dolor musculoesquelético agudo y crónico, la dismenorrea y el dolor postoperatorio. Cada fármaco tiene una posología específica que debe ajustarse según la indicación y el perfil del paciente, en la siguiente tabla se presentaran los fármacos principales con sus dosis:

Fármaco	Selectividad	Indicaciones	Dosis (VO)
Ácido acetilsalicílico	COX-1 > COX-2	Antiinflamatorio, analgesia leve, antiagregante plaquetario	75-325 mg/día (antiagregante) - 500 mg/6h (dolor)
Ibuprofeno	No selectivo	Dolor, fiebre, artritis, dismenorrea	200-800 mg cada 6-8 h (máx. 3.2 g/día)
Naproxeno	No selectivo	Artritis, gota, dolor muscular	250-500 mg cada 12 h (máx. 1.5 g/día)
Indometacina	No selectivo	Artritis, cierre del conducto arterioso	25-50 mg cada 8-12 h (máx. 200 mg/día)

Meloxicam	COX-2 preferencial	Artritis reumatoide, osteoartritis	7.5-15 mg/día
Diclofenaco	No selectivo	Artritis, dolor agudo	50 mg cada 8 h (máx. 150 mg/día)
Ketorolaco	No selectivo	Dolor moderado-severo postoperatorio	10-30 mg cada 6-8 h (máx. 5 días)
Celecoxib	COX-2 selectivo	Artritis reumatoide, osteoartritis	100-200 mg cada 12 h
Etoricoxib	COX-2 selectivo	Artritis, dolor lumbar	60-120 mg/día
Paracetamol	Inhibidor COX-3 (SNC)	Analgésico y antipirético. No antiinflamatorio	500-1000 mg c/6-8 h (máx. 4 g/día)

Para finalizar debemos saber que estos fármacos serán esenciales en la práctica médica por su eficacia en el manejo del dolor, la inflamación y la fiebre, sin embargo, su uso debe ser racional, considerando el riesgo de efectos adversos gastrointestinales, renales, etc. Y también será importante una selección adecuada del fármaco y la dosis según el perfil del paciente donde es clave para maximizar su beneficio terapéutico y minimizar riesgos.

BIBLIOGRAFIA

- I. Regueras E., Velázquez I. y Torres L. (2024). Actualización en farmacología de los antiinflamatorios no esteroideos: actualización. Revista de la Sociedad Española Multidisciplinar del Dolor. SEMDOR.