



Mi Universidad

Resumen

Casandra Solis Pinto

Parcial 1

Farmacología Terapéutica

Dr. Adolfo Brayan Medellín Guillén

Medicina Humana

Cuarto Semestre

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

AINES (Antiinflamatorios No Esteroideos)

¿Qué son los Antiinflamatorios Fármacos No Esteroideos (AINES)?

Los AINES (Antiinflamatorios No Esteroideos) son una familia farmacológica diseñada para inhibir las enzimas COX, que son cruciales en la cascada del ácido araquidónico. Esta inhibición reduce la síntesis de prostaglandinas (PG), sustancias que intervienen en la inflamación, el dolor, la fiebre y en algunas funciones de protección del organismo, como la preservación de la mucosa gástrica.

Clasificación de los AINES

1. Por su estructura química:

- **Ácido acetilsalicílico (ASA):**

- Es el AINE clásico y uno de los más conocidos, con propiedades antiinflamatorias, analgésicas, antipiréticas y antiagregantes.

- **Derivados del ácido propiónico (como ibuprofeno, ketoprofeno y naproxeno):**

- Son inhibidores no selectivos de las enzimas COX que ofrecen alivio del dolor, la inflamación y la fiebre.

- **Derivados del ácido acético (por ejemplo, indometacina):**

- Tienen una potente acción antiinflamatoria, aunque con mayor riesgo de efectos adversos, y se usan en situaciones agudas o moderadas a graves.

- **Oxicams (como piroxicam y meloxicam):**

- Tienen una eficacia antiinflamatoria comparable a otros AINES; el meloxicam muestra mayor selectividad hacia COX-2 a dosis bajas, pero a dosis altas actúa de forma no selectiva.

- **Ácido heteroarilacético (ej. diclofenaco y ketorolaco):**

- El diclofenaco es muy potente y el ketorolaco se utiliza principalmente a corto plazo en el manejo del dolor postoperatorio.

- **Inhibidores selectivos de COX-2 (como celecoxib, etoricoxib y parecoxib):**

- Estos fármacos tienen un efecto antiinflamatorio y analgésico sin afectar la función plaquetaria (ya que las plaquetas sólo poseen COX-1) y ofrecen una menor toxicidad gastrointestinal, aunque pueden aumentar el riesgo cardiovascular.

2. Por su selectividad sobre las enzimas COX:

- **No selectivos (COX-1 y COX-2):**

- La mayoría de los AINES tradicionales actúan sobre ambas enzimas. Esto puede ser útil para reducir la inflamación, pero la inhibición de la COX-1 (constituida de forma continua en tejidos como la mucosa gástrica y los riñones) puede provocar efectos secundarios como úlceras gástricas.

- **Selectivos para COX-2:**

- Conocidos como "coxibs", tienen mayor afinidad por la COX-2, la cual se expresa principalmente durante procesos inflamatorios, y en teoría generan menos efectos secundarios a nivel gástrico.

- **COX-3:**

- Aunque el paracetamol no se considera un AINE en el sentido estricto (ya que carece de efecto antiinflamatorio notable), actúa sobre una variante llamada COX-3, que se expresa en el sistema nervioso central, lo que le confiere propiedades analgésicas y antipiréticas.

Mecanismo de Acción de los AINES

La acción principal de los AINES es la inhibición de la enzima ciclooxigenasa (COX), la cual convierte el ácido araquidónico y otros ácidos grasos precursores en prostaglandinas. Dependiendo de la enzima inhibida, se observa lo siguiente:

Inhibición de COX-1:

- La COX-1 se encuentra de manera constitutiva en muchos tejidos, especialmente en la mucosa gástrica y los riñones.

- Su inhibición reduce la producción de prostaglandinas como PGE2 y PGI2, que son fundamentales para la protección de la mucosa gástrica, lo que puede provocar efectos adversos como úlceras y hemorragias gastrointestinales.

Inhibición de COX-2:

- La COX-2 se expresa en respuesta a procesos inflamatorios.
- Su inhibición reduce la inflamación, el dolor y la fiebre, con menor impacto sobre la protección gástrica.

Inhibición de COX-3:

- Se relaciona principalmente con los efectos antipiréticos y analgésicos, siendo el mecanismo de acción del paracetamol, aunque con poco efecto antiinflamatorio.

Características Individuales de Cada Grupo de AINES (según su estructura química)

1. Ácido Acetilsalicílico (ASA):

- Acciones: Antiinflamatorio, analgésico, antipirético y antiagregante plaquetario.
- Mecanismo: Inhibe irreversiblemente las COX, reduciendo la síntesis de prostaglandinas y tromboxanos.
- Indicaciones terapéuticas: Prevención de eventos cardiovasculares, dolor leve a moderado, fiebre.
- Posología: Dosis bajas (75–100 mg/día) para prevención cardiovascular; dosis más altas para dolor y fiebre, siempre con cuidado de efectos gastrointestinales.

2. Derivados del Ácido Propiónico (Ibuprofeno, Ketoprofeno, Naproxeno):

- Acciones: Efectos analgésicos, antipiréticos y antiinflamatorios.
- Mecanismo: Inhibición reversible y no selectiva de las COX.
- Características: Pueden afectar la función plaquetaria y prolongar el tiempo de sangrado.

- Indicaciones terapéuticas:** Dolor leve a moderado, procesos inflamatorios agudos, fiebre.
- Posología: Ibuprofeno (200–400 mg cada 4–6 horas); Naproxeno (250–500 mg cada 12 horas), ajustándose según la indicación y edad.

3. Derivados del Ácido Acético (Indometacina):

- Acciones: Potente antiinflamatorio, analgésico y antipirético.
- Mecanismo: Inhibición reversible de las COX, con alta potencia, pero mayor incidencia de efectos secundarios gastrointestinales y renales.
- Indicaciones terapéuticas: Situaciones agudas de inflamación severa, por ejemplo en ciertos cuadros de artritis, y en neonatos para cerrar el conducto arterioso permeable.
- Posología: Dosis ajustadas según la gravedad y edad; en neonatos, se emplea específicamente bajo supervisión médica.

4. Oxicams (Piroxicam, Meloxicam):

- Acciones: Efectos antiinflamatorios, analgésicos y antipiréticos.
- Mecanismo: Inhibición de COX-1 y COX-2; el meloxicam es más selectivo para COX-2 a dosis bajas, aunque a dosis altas pierde selectividad.
- Indicaciones terapéuticas: Tratamiento de la artritis y otras condiciones inflamatorias crónicas.
- Posología: Meloxicam suele administrarse una vez al día, y piroxicam se usa en dosis diarias controladas, siempre monitorizando la tolerancia gastrointestinal.

5. Ácido Heteroarilacético (Diclofenaco, Ketorolaco):

- Acciones: Potentes efectos analgésicos, antiinflamatorios y antipiréticos.
- Mecanismo: Inhibición no selectiva de las COX, con diclofenaco considerado más potente que otros AINES como la indometacina o el naproxeno.
- Indicaciones terapéuticas: Tratamiento de dolor moderado a severo, inflamaciones agudas y crónicas.

- Posología: Diclofenaco en dosis divididas (por ejemplo, 75–150 mg/día); ketorolaco se utiliza a corto plazo (máximo 5 días, 10–30 mg cada 4–6 horas, evitando su uso prolongado y en pediatría).

6. Inhibidores Selectivos de COX-2 (Celecoxib, Etoricoxib, Parecoxib):

- Acciones: Efectos analgésicos, antipiréticos y antiinflamatorios sin interferir con la función plaquetaria.
- Mecanismo: Inhibición selectiva de la COX-2, lo que reduce la inflamación y el dolor, con menor riesgo de úlceras gastrointestinales.
- Características: Celecoxib es 10-20 veces más potente sobre COX-2, pero estos fármacos se han asociado a efectos cardiovasculares adversos.
- Indicaciones terapéuticas:** Condiciones inflamatorias donde se requiere minimizar la toxicidad gastrointestinal, como en pacientes con riesgo de úlceras o sangrados.
- Posología: Celecoxib generalmente se administra en dosis de 100–200 mg al día, dependiendo de la gravedad del cuadro clínico, y Etoricoxib y Parecoxib se ajustan según la indicación y la respuesta del paciente.

Interacciones Farmacológicas

Los AINES pueden interactuar con otros medicamentos y sistemas del organismo de diversas maneras, por ejemplo:

- **Excreción renal:** Muchos AINES se eliminan principalmente por vía renal, lo que puede aumentar las concentraciones y la toxicidad de fármacos como el litio.
- **Aclaramiento de otros fármacos:** Pueden disminuir el aclaramiento de medicamentos como el metotrexato y algunos aminoglucósidos.
- **Antihipertensivos:** Pueden interferir con el efecto de los fármacos antihipertensivos.
- **Diuréticos ahorradores de potasio:** Al administrarse conjuntamente, pueden causar retención de potasio y conducir a hiperpotasemia.

- **Salicilatos en dosis altas:** Se asocian a efectos hipoglucémicos que pueden interferir con la acción de los antidiabéticos.
- **Warfarina:** El ASA puede potenciar su efecto, aumentando el riesgo de hemorragias.

Consideraciones Especiales

Paracetamol:

Aunque no posee efectos antiinflamatorios potentes, actúa sobre la COX-3 en el sistema nervioso central y se le incluye a veces en el grupo de AINES por su acción analgésica y antipirética. Sin embargo, dosis mayores a 2 g/día pueden aumentar la actividad de los anticoagulantes orales.

Sobredosis

- **ASA:** Puede producir toxicidad con dosis >100 mg/kg/día durante más de dos días.
- **Ibuprofeno:** Síntomas de toxicidad a dosis superiores a 80-100 mg/kg dentro de las primeras 4 horas.
- **Paracetamol:** La dosis tóxica mínima es de 6 g/día en adultos y >100 mg/kg/día en niños; dosis mayores a 20-25 g son potencialmente fatales.

Efectos de los AINES Selectivos COX-2

Aunque disminuyen el riesgo gastrointestinal, se han asociado con un aumento en eventos cardiovasculares (enfermedad coronaria e isquemia).

Tabla con características especiales de los principales fármacos de cada familia

FARMACO	GRUPO QUIMICO	SELECTIVIDAD COX	INDICACIONES TERAPÉUTICAS	POSOLOGIA
Ácido acetilsalicílico	Salicilatos	No selectivo (inhibición irreversible de COX-1)	Prevención cardiovascular, dolor, fiebre	<p>Adultos:</p> <ul style="list-style-type: none"> Analgesia/antipirético: 325-650 mg cada 4-6 horas según necesidad, hasta un máximo de 4 g/día. Antiagregante plaquetario: 75-100 mg/día. <p>Pediátrico:</p> <ul style="list-style-type: none"> No recomendado en niños menores de 12 años por riesgo de síndrome de Reye, excepto en condiciones específicas como enfermedades cardíacas, siempre bajo supervisión médica. <p>Niños mayores >12 años :</p> <ul style="list-style-type: none"> 300-600 mg cada 4-6 horas, con un máximo de 4 g/día.
Ibuprofeno	Ácidos Propiónicos	No selectivo	Dolor leve a moderado inflamación, fiebre	<p>Adultos:</p> <ul style="list-style-type: none"> 200-400 mg cada 4-6 horas, hasta un máximo de 2,400 mg/día. <p>Pediátrico (según peso):</p> <ul style="list-style-type: none"> 5-10 mg/kg cada 6-8 horas, con un máximo de 40 mg/kg/día. <p>Niños mayores (>6 años):</p> <ul style="list-style-type: none"> 200-400 mg cada 4-6 horas, con un máximo de 2,400 mg/día.
Naproxeno	Ácidos Propiónicos	No selectivo	Artritis, dolor muscular, dismenorrea	<p>Adultos:</p> <ul style="list-style-type: none"> 250-500 mg cada 12 horas. Máximo 1,000 mg/día. <p>Pediátrico (para enfermedades inflamatorias):</p> <ul style="list-style-type: none"> 10 mg/kg/día en dosis divididas (debe ajustarse según la edad y el peso del niño).
Diclofenaco	Fenilacéticos	No selectivo (con cierto efecto sobre COX-2)	Artritis reumatoide, osteoartritis, dolor postoperatorio	<p>Adultos:</p> <ul style="list-style-type: none"> 50-75 mg cada 8-12 horas, con un máximo de 150 mg/día. Formulaciones de liberación retardada o tópicas tienen dosis específicas. <p>Pediátrico:</p> <ul style="list-style-type: none"> No recomendado en niños menores de 6 años. Niños mayores: 0.5-2 mg/kg cada 8 horas.

FARMACO	GRUPO QUIMICO	SELECTIVIDAD COX	INDICACIONES TERAPÉUTICAS	POSOLOGIA
Indometacina	Indolacosáridos	No selectivo	Artritis inflamatoria, gota, espondilitis anquilosante	<p>Adultos:</p> <ul style="list-style-type: none"> • 25-50 mg cada 8 horas. Máximo 200 mg/día. <p>Pediátrico:</p> <ul style="list-style-type: none"> • Niños: 0.5-1 mg/kg cada 6-8 horas.
Piroxicam	Oxicams	No selectivo	Artritis reumatoide, osteoartritis.	<p>Adultos:</p> <ul style="list-style-type: none"> • 10-20 mg al día, generalmente en una sola dosis. <p>Pediátrico:</p> <ul style="list-style-type: none"> • No recomendado para niños menores de 12 años sin supervisión médica.
Celecoxib	Coxibs	Selectivo COX-2	Artritis, dolor agudo, dismenorre	<p>Adultos:</p> <ul style="list-style-type: none"> • 100-200 mg cada 12 horas. <p>Pediátrico:</p> <ul style="list-style-type: none"> • A partir de 2 años: 3-6 mg/kg/día en 1-2 dosis.
Etoricoxib	Coxibs	Selectivo COX-2	Artritis reumatoide, osteoartritis, espondilitis anquilosante	<p>Adultos:</p> <ul style="list-style-type: none"> • 60-120 mg/día, en dosis única. <p>Pediátrico:</p> <ul style="list-style-type: none"> • No recomendado en menores de 16 años.
Nabumetona / Meloxicam	Otros (selectividad intermedia en el caso de meloxicam)	Variable (meloxicam tiene leve selectividad COX-2)	Alternativas en dolor inflamación; adecuados par pacientes con riesgo GI moderado	<p>Adultos:</p> <ul style="list-style-type: none"> • 750 mg/día en una sola dosis, pudiendo aumentar hasta 1,000 mg/día si es necesario. <p>Pediátrico:</p> <ul style="list-style-type: none"> • Nabumetona: No recomendado en niños. • Meloxicam: En niños mayores de 6 años: 0.2 mg/kg/día.

Bibliografía:

- 01.** *Revista de la Sociedad Española Multidisciplinar del Dolor.* (n.d.). [Www.mpainjournal.com](http://www.mpainjournal.com). <https://www.mpainjournal.com/actualizacion-en-farmacologia-de-los-antiinflamatorios-no-esteroides-actualizacion1192>