



**Mi Universidad**

## **RESUMEN**

*Carla Sofia Alfaro Domínguez*

*Parcial I*

*Terapia Farmacológica*

*Dr. Adolfo Bryan Medellín Guillen*

*Medicina Humana*

*Cuarto semestre grupo A*

*La Trinitaria, Chiapas, a 02 de marzo del 2025*

## INTRODUCCION

Los antiinflamatorios no esteroideos (AINE) son una de las clases de medicamentos más utilizadas en la práctica médica debido a sus efectos analgésicos, antiinflamatorios y antipiréticos. Actúan inhibiendo la enzima ciclooxigenasa (COX), reduciendo la síntesis de prostaglandinas, sustancias responsables del dolor, la inflamación y la fiebre. Su uso es amplio en diversas patologías, desde el tratamiento del dolor musculoesquelético hasta enfermedades inflamatorias crónicas como la artritis reumatoide. Sin embargo, su administración prolongada o en dosis inadecuadas puede estar asociada con efectos adversos gastrointestinales, renales y cardiovasculares, lo que resalta la importancia de un uso racional y supervisado de estos fármacos.



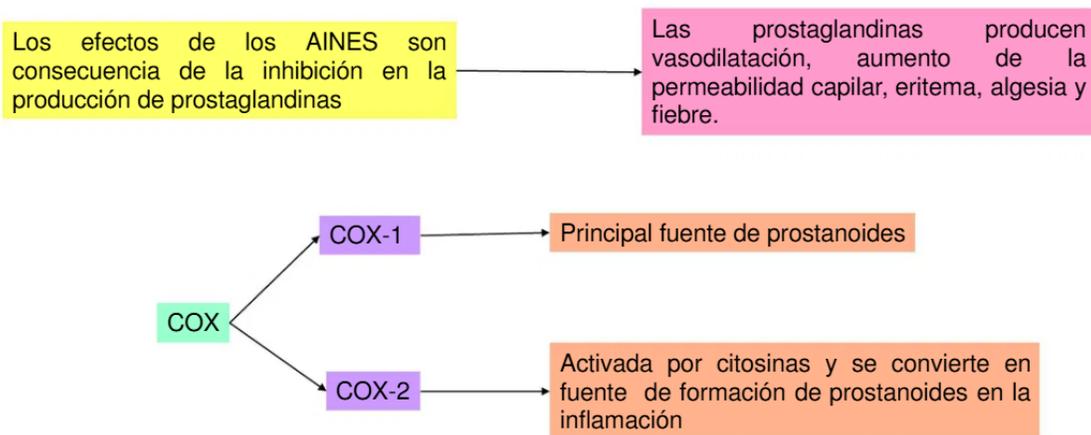
## ¿Qué son los AINE'S?

Los antiinflamatorios no esteroideos (AINE) son una clase de medicamentos ampliamente utilizados para aliviar el dolor, reducir la inflamación y disminuir la fiebre. A diferencia de los corticosteroides, no poseen una estructura esteroidea.

Los AINE constituyen una extensa familia de fármacos débilmente ácidos cuyos efectos farmacológicos se deben principalmente a la inhibición de la ciclooxigenasa (COX), una enzima que cataliza el primer paso de la síntesis de las prostaglandinas a partir del ácido araquidónico y de otros ácidos grasos precursores. La COX es una enzima microsómica que aparece en forma de dímero (dos moléculas unidas para formar una unidad funcional) en la luz y membrana del retículo endoplásmico.

Para que un fármaco sea considerado un AINE , debe tener las 4 propiedades: Analgésico, antiinflamatorio, antiagregante plaquetario y antipiréticos.

## ASPECTOS FARMACOLÓGICOS



## GENERALIDADES:

Los AINE están disponibles para su administración por diversas vías: oral, intravenosa, rectal, sublingual, intramuscular o tópica. Por vía oral, los AINE tienen buena biodisponibilidad, sufren un importante metabolismo de primer paso en los citocromos hepáticos (CYP) y se

unen extensamente a proteínas del plasma. Se metabolizan mediante reacciones de fase I y II (CYP3A4, CYP2C19, CYP2C9), o bien por glucuronidación; su excreción es sobre todo renal y, en su mayoría, en forma de metabolitos

## Clasificación de los AINE:

### Por estructura química:

Grupo terapéutico	Fármaco
Salicilatos	Ácido acetilsalicílico, salsalato, diflunisal, fosfosal, acetilato de lisina
Pirazolonas	Fenilbutazona
Indolacéticos	Indometacina, tolmetín, sulindaco, acemetacina
Arilacéticos	Diclofenaco, aceclofenaco, nabumetona
Arilpropiónicos	Ibuprofeno, naproxeno, ketoprofeno, flurbiprofeno
Oxicams y análogos	Piroxicam, tenoxicam, meloxicam
Fenamatos	Ácido mefenámico, meclofenamato
Inhibidores selectivos de la COX-2	Celecoxib, etoricoxib

## Clasificación por selectividad de las COX

En la actualidad, con objeto de valorar la acción sobre los distintos órganos y la posible toxicidad es muy útil la clasificación atendiendo al grado de inhibición de los AINE a las enzimas de la ciclooxigenasa (COX-1 y COX-2).

1. AINE inhibidores selectivos de la COX-2 o COXIB (celecoxib, etoricoxib y lumiracoxib), que se caracterizan principalmente por una menor toxicidad gastroduodenal.
2. AINE inhibidores intermedios de la COX-2 (nabumetona y meloxicam), en general dependiendo de la dosis de uso.

3. AINE clásicos o no selectivos de la COX-2, con inhibición de ambas enzimas (el resto de AINE).

Es importante recalcar que la COX-1 tiene diferencias de la COX-2

**COX-1:** La COX-1 desempeña un papel importante en la síntesis de los prostanoïdes para propósitos fisiológicos y regula funciones como la protección gastrointestinal, la homeostasis vascular, la hemodinámica renal y la función plaquetaria.

**COX-2:** No se encuentra presente normalmente en la célula pero aparece rápidamente tras la exposición de la célula a agentes como lipopolisacáridos o citocinas proinflamatorias, y regula la producción de los prostanoïdes que participan en la inflamación y en otros procesos no inflamatorios, tanto fisiológicos como patológicos.

## MECANISMO DE ACCIÓN DE LOS AINE'S

Los AINE inhiben las enzimas ciclooxigenasas (COX-1 y COX-2), responsables de la conversión del ácido araquidónico en prostaglandinas, sustancias que median la inflamación, el dolor y la fiebre. La inhibición de estas enzimas conduce a una disminución en la síntesis de prostaglandinas, reduciendo así la inflamación y el dolor.

## CARACTERÍSTICAS INDIVIDUALES SEGÚN SU CLASIFICACIÓN POR ESTRUCTURA QUÍMICA:

**Derivados del ácido acético:** La indometacina es un potente antiinflamatorio, pero su uso puede estar limitado por efectos secundarios como cefaleas y molestias gastrointestinales. El diclofenaco tiene una buena eficacia analgésica y antiinflamatoria, con un perfil de tolerabilidad razonable.

**Derivados del ácido propiónico:** El ibuprofeno es conocido por su eficacia y menor incidencia de efectos adversos gastrointestinales en comparación con otros AINE. El

naproxeno tiene una vida media más prolongada, permitiendo una dosificación menos frecuente.

**Oxicams:** El piroxicam tiene una vida media larga, lo que permite una dosificación diaria, pero puede aumentar el riesgo de efectos secundarios gastrointestinales. El meloxicam, al ser más selectivo para COX-2, puede tener un mejor perfil de seguridad gastrointestinal.

**Derivados del ácido antranílico:** El ácido mefenámico se utiliza principalmente para el tratamiento del dolor menstrual, pero su uso prolongado no es recomendable debido a posibles efectos secundarios.

**Inhibidores selectivos de COX-2 (Coxibs):** El celecoxib está diseñado para minimizar los efectos secundarios gastrointestinales asociados con los AINE tradicionales, aunque puede estar asociado con un mayor riesgo de eventos cardiovasculares en ciertos pacientes.

## **INTERACCIONES FARMACOLÓGICAS:**

Los AINE pueden interactuar con diversos medicamentos:

**Anticoagulantes:** Aumentan el riesgo de sangrado.

**Antihipertensivos:** Pueden reducir la eficacia de medicamentos como los inhibidores de la ECA, bloqueadores de los receptores de angiotensina y diuréticos.

**Corticosteroides:** Incrementan el riesgo de úlceras gastrointestinales.

**Litio:** Los AINE pueden aumentar los niveles plasmáticos de litio, elevando el riesgo de toxicidad.

## EFECTOS SECUNDARIOS

### Efectos secundarios gastrointestinales:

Los AINE pueden causar irritación del tracto gastrointestinal, manifestándose como dispepsia, reflujo gastroesofágico, acidez estomacal, úlceras pépticas y, en casos graves, hemorragias gastrointestinales.

### Efectos secundarios cardiovasculares:

El uso de AINE puede aumentar el riesgo de eventos cardiovasculares, como ataques al corazón y accidentes cerebrovasculares, especialmente cuando se utilizan en dosis altas o durante períodos prolongados.

Además, pueden provocar un aumento de la presión arterial y retención de líquidos, lo que podría empeorar condiciones como la insuficiencia cardíaca.

### Efectos secundarios renales:

El uso prolongado de AINE puede afectar la función renal, llevando a problemas como insuficiencia renal aguda o crónica.

### Efectos secundarios hematológicos:

Los AINE pueden disminuir la agregación plaquetaria, aumentando el riesgo de sangrado.

### Efectos secundarios en la piel:

Aunque menos comunes, algunos AINE pueden causar reacciones cutáneas graves, como erupciones o fotosensibilidad.

## TABLA CON CARACTERÍSTICAS ESPECIALES DE LOS PRINCIPALES FÁRMACOS DE CADA FAMILIA:

Fármaco	Familia química	Indicaciones terapéuticas	Posología habitual
Ibuprofeno	Derivado del ácido propiónico	Dolor leve a moderado, fiebre, artritis	200-400 mg cada 4-6 horas (máx. 3200 mg/día)
Naproxeno	Derivado del ácido propiónico	Artritis, dolor musculoesquelético	250-500 mg cada 12 horas
Diclofenaco	Derivado del ácido acético	Dolor inflamatorio, dismenorrea, artritis	50 mg cada 8 horas
Indometacina	Derivado del ácido acético	Artritis reumatoide, espondilitis anquilosante	25-50 mg dos o tres veces al día
Piroxicam	Oxicam	Artritis reumatoide, osteoartritis	20 mg una vez al día
Meloxicam	Oxicam	Osteoartritis, artritis reumatoide	7.5-15 mg una vez al día
Ácido mefenámico	Derivado del ácido antranílico	Dolor menstrual, dolor agudo	500 mg inicialmente, luego 250 mg cada 6 horas
Celecoxib	Inhibidor selectivo de COX-2	Osteoartritis, artritis reumatoide, dolor agudo	100-200 mg cada 12 horas

## REFERENCIAS BIBLIOGRAFICAS

1. Goodman, L. S., & Gilman, A. (2011). Las bases farmacológicas de la terapéutica (12<sup>a</sup> ed.). McGraw-Hill Interamericana.
2. Olaya Querevalú, M. T. (2020). Manual de Farmacoterapéutica para Principiantes: Antiinflamatorios no esteroideos, analgésicos opioides, antiinflamatorios corticoideos.
3. Rang, H. P., Dale, M. M., Ritter, J. M., & Flower, R. J. (2008). Farmacología (6<sup>a</sup> ed.). Elsevier España