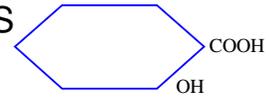


## ANTIINFLAMATORIOS NO ESTEROIDALES ( 2 )

Lunes 9, Mayo 2011

*Dr. Fernando Gallardo R.*

## SALICILICOS



- Acido salicilico ( acido orto hidroxibenzoico)
- Salicilato de sodio
- Salicilato de metilo
- Acido acetilsalicílico

## Acido acetilsalicilico (Aspirina®)

- Utilizado por más de 100 años en Medicina
- Analgésico ( 500 mg cada 6 horas)
- Antipirético, ( 500 mg cada 6 horas)
- Antiinflamatorio, (1 gr cada 6 horas)
- Inhibidor de la agregación plaquetaria (100 mg c/24 horas)
- Reducido costo
- Habitual standard de comparación con otros A.I.N.E.

## Acido acetilsalicílico ( Aspirina)

- Administración oral
- Se hidroliza liberando ácido acético y ion salicilato
- Salicilato :
  - Conjugación con ácido glicurónico
  - Conjugación con glicina
  - Oxidación → Acido gentísico

## Reacciones adversas

- Irritación gastrointestinal
- Efectos renales en tratamientos prolongados
- Reacciones de hipersensibilidad
- Hemorragias, por inhibir la agregación plaquetaria
- Síndrome de Reye en niños (encefalopatía, hepatotoxicidad)

## DERIVADOS PIRAZOLONICOS

- Dipirona o Metamizol  
( compr 300 mg. amp. 1 gr, Analgésico, sin acción antiinflamatoria)
- Propifenazona  
( Supos. 440 mg, Antipirético)
- Fenilbutazona → Oxifenbutazona  
( Antiinflamatorios)

## DIPIRONA

- Administración oral o parenteral
- Analgésico más utilizado a nivel hospitalario en Chile
- Carece de efecto antiinflamatorio y como no afecta a COX, no causa irritación gástrica
- RAM : Potencial depresor medular: leucopenia, agranulocitosis, anemia aplásica ( Retirado del mercado en U.S.A. hace más de 30 años )

## DERIVADOS DE ACETANILIDA : ( Paracetamol o Acetaminofeno)

- Analgésico y antipirético, vía oral
- Carece de efecto antiinflamatorio en clínica
- No actúa sobre COX; no irrita la mucosa gástrica
- No afecta la agregación plaquetaria
- No es depresor medular
- 500 mg cada 6 horas,
- Aceptado su uso en Pediatría

## BIOTRANSFORMACION DEL PARACETAMOL

- En un 95% se conjuga con ácido glicurónico y se elimina en la orina.
- En un 5% se oxida en el sistema microsomal y forma un metabolito hepatotóxico, benzoquinona imina el cual es neutralizado por el glutatión
- Dosis altas ( 10 gramos en el adulto, 5 gr en niños produce hepatotoxicidad )
- Precaución en su uso en alcohólicos, y pacientes con daño hepático
- Tratamiento de hepatotoxicidad : N-acetilcisteína, grupos SH neutralizan metabolito hepatotoxico

## DERIVADO DEL INDOL : Indometacina

- Marcado efecto inhibitor sobre las ciclooxigenasas determina marcada acción antiinflamatoria
- Menor actividad analgésica.
- Administración oral, alto % fijación proteínas plasmáticas
- R.A.M.: gastrointestinal, cefaleas, tinnitus, mareos, depresión S.N.C.
- Usos : Reumatología - persistencia del ductus arterioso aguda

## DERIVADOS FENILPROPIONICOS

- Ibuprofeno 400 mg c/6-8hrs
- Naproxeno 250 mg c/8-12 hrs
- Naproxeno sódico 550 mg cada 12 hrs ( Atac®)
- Ketoprofeno 50 mg c/8 hrs (Profenid) 100 mg c/12 hrs
- Flurbiprofeno 100 mg c/ 12 hrs

## DERIVADOS FENILPROPIONICOS

- Tienen las 3 acciones clásicas de los AINE
- Inhiben a COX<sub>1</sub> y COX<sub>2</sub> (50%)
- Posible efecto analgésico central
- Buena tolerancia gástrica ( no debe administrarse en ulcerosos)
- Ibuprofeno y naproxeno aceptados para utilizarlos en Pediatría
- Ketoprofeno disponible para vía parenteral

## OTRAS FAMILIAS DE AINES

■ Fenamatos	}	- Acido mefenámico (Tanston-Sicadol-Templadol)	250 mg c/6 hrs
		- Ac.meclufenámico	100 mg c/12 hrs
		- Clonix. de lisina (Nefersil-Dentagesic)	125 mg c/6 hrs
■ Fenilacéticos		Diclofenaco (Voltaren)	50 mg c/6 hrs
■ Enólicos		Piroxicam (Feldene)	20 mg c/24 hrs
■ Pirrolacéticos		Ketorolaco (Burten)	10 mg c/6 hrs

## NIMESULIDA

- Bloqueador selectivo (95%) de la COX<sub>2</sub>
- Actividad analgésica y antiinflamatoria
- Administración oral y rectal
- R.A.M:
  - Irritación gastrointestinal (menor)
  - Hipersensibilidad
- Presentación : Compr 100 mg , Supos 200 mg
- Dosis habitual : 100 - 200 mg cada 12 horas
- N.comerciales : Nisural®-Ainex® - Nisulid® -

## MELOXICAM : ( Hyflex® -Mobex® - Tenaron® )

- Bloqueador selectivo de la COX2
- Derivado enólico
- Efecto antiinflamatorio predominante
- Menor irritación gastrointestinal y menor daño renal en comparación a otros A.I.N.E.
- Vida media larga
- Presentación : Compr. de 15 y 7,5 mg  
Ampollas y supos. de 15 mg
- Dosis : 7,5 - 15 mg cada 24 horas

## COXIBS: fármacos disponibles

- Celecoxib  
( Celebra®, compr 200 mg)
- Etoricoxib (Arcoxia®)  
Compr. 60, 90 y 120 mg (No aprobado por la FDA)

## Celecoxib ( Celebra® )

- Bloqueador específico de la COX<sub>2</sub>
- Aprobado inicialmente por la FDA en 1999 como antiinflamatorio, y en 2002 como analgésico
- No irrita la mucosa gástrica.
- Presenta grupo sulfonamida en su molécula
- Cápsulas de 100 y 200 mg.
- Dosis habitual: 1 comprimido cada 24 horas.
- Administración sólo en adultos.

## AINE ACEPTADOS EN PEDIATRIA

- Paracetamol : 25-50 mg/kg/día
- Dipirona : 50-100 mg/kg/día
- Ibuprofeno : 5-10mg/kg/día
- Naproxeno : 15 mg/kg/día)
- Diclofenaco : 1-2 mg/kg/día

## AINE y embarazo

- Paracetamol
- Dipirona
- Acido acetilsalicílico (exceptuando las ultimas semanas del embarazo)

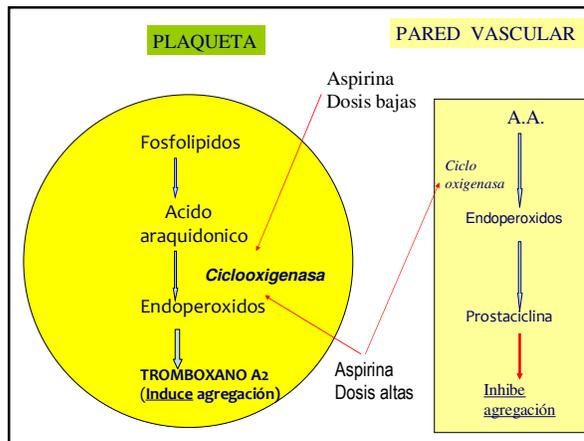
## Tiene el rofecoxib un efecto protrombotico ?

O carece de efecto antiagregante plaquetario ?

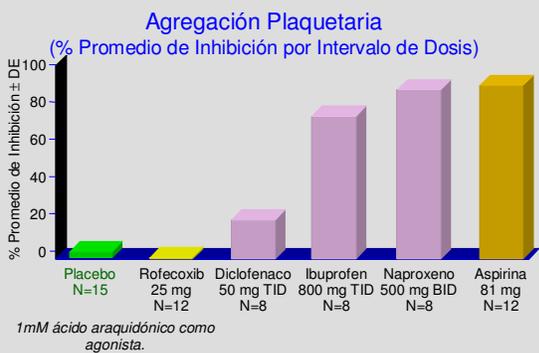
## COX2 SE EXPRESA FISIOLÓGICAMENTE EN EL ORGANISMO

- Riñon
- Endotelio vascular
- S.Nervioso Central

*Bloqueo en la síntesis de prostaciclina (PGI<sub>2</sub>) en los vasos puede contribuir al efecto protrombotico de los AINES*



## Inhibición de la agregación plaquetaria



## Interacciones de los AINE con otros medicamentos

- En pacientes recibiendo anticoagulantes orales, hipoglicemiantes o metotrexato, los AINE producen un efecto sinérgico (desplazamiento de su fijación a las proteínas plasmáticas)
- AINE, al bloquear síntesis de PGs antagonizan el efecto de algunos medicamentos hipotensores como hidroclorotiazida, furosemida y a los inhibidores de la enzima de conversión (ECA), enalapril, captopril (*prostaglandinas liberan renina*)