



Faculdade de Imperatriz FACIMP

Fármacos antiinflamatórios esteroidais (AIES)

**Disciplina: Farmacologia
Prof. Dr. Paulo Roberto da Silva Ribeiro
5º Período de Farmácia e Bioquímica
1º Semestre de 2007**

Prof. Dr. Paulo Roberto

1

Principais Ações dos Glicocorticóides

AÇÕES METABÓLICAS

- ✓ Sobre os carboidratos: ↓ a captação e utilização da glicose e ↑ da gliconeogênese = hiperglicemia.
- ✓ Sobre as proteínas: ↑ catabolismo, ↓ do anabolismo
- ✓ Sobre os lipídios: efeito permissivo sobre os hormônios lipolíticos e redistribuição da gordura (Síndrome de Cushing)

Prof. Dr. Paulo Roberto

2

Principais Ações dos Glicocorticóides

AÇÕES REGULADORAS

- ✓ **Sobre o hipotálamo e a hipófise anterior:** ação de retroalimentação negativa, resultando em diminuição da liberação dos glicocorticóides endógenos.
- ✓ **Sobre os eventos vasculares:** vasodilatação reduzida, diminuição da exsudação de líquidos.

Prof. Dr. Paulo Roberto

3

Principais Ações dos Glicocorticóides

AÇÕES REGULADORAS

- ✓ **Sobre os eventos celulares:**
 - nas áreas de inflamação aguda: ↓ do influxo e da atividade dos leucócitos;
 - nas áreas de inflamação crônica: ↓ da atividade nas células mononucleares, ↓ proliferação de vasos sanguíneos, ↓ fibrose.
 - Nas áreas linfóides: ↓ expansão das cels T e B e ação ↓ das cels T secretoras de citocinas.

Prof. Dr. Paulo Roberto

4

Principais Ações dos Glicocorticóides

AÇÕES REGULADORAS

✓ **Sobre os mediadores inflamatórios e imunes:**

- ↓ na produção e ação das citocinas, incluindo muitas interleucinas, TNF γ ;
- ↓ da produção de eicosanóides;
- ↓ da produção de IgG;
- ↓ dos componentes do complemento do sangue;

Prof. Dr. Paulo Roberto

5

Principais Ações dos Glicocorticóides

AÇÕES REGULADORAS

✓ **Efeitos globais:**

- ↓ da inflamação crônica e nas reações autoimunes; entretanto, ocorre também deteriorização da cicatrização
- deteriorização da cicatrização e ↓ nos aspectos protetores da resposta inflamatória.

✓ **AÇÕES ANTIINFLAMATÓRIAS E IMUNOSSUPRESSORAS**

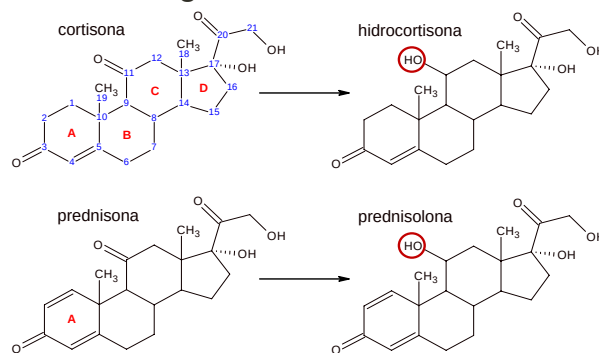
- Inibição da transcrição dos genes COX-2 e de citocinas (interleucinas).

Prof. Dr. Paulo Roberto

6

Farmacocinética

- **Administração: oral, tópica e parenteral**
- **Ligação às proteínas plasmáticas;**
- **globulinas de ligação dos glicocorticóides no sangue;**
- **penetram nas cels por difusão;**
- **metabolizados no fígado.**



Prof. Dr. Paulo Roberto

7

➤ Escolha

- **Uso sistêmico agudo: qualquer agente**
- **Uso sistêmico crônico: prednisona ou metilprednisolona** (experiência de emprego e duração de efeito intermediária)
- **Uso tópico:**
 - ✓ beclometasona e budesonida (inalatório);
 - ✓ triancinolona e metilprednisolona (intra-articular);
 - ✓ hidrocortisona, triancinolona, betametasona, halcinonida e clobetasol (cutâneo)

➤ Princípios de escolha

- ✓ Usar após tentativas com medicamentos de menor risco;
- ✓ Usar as menores doses eficazes, pelo menor tempo possível;
- ✓ Objetivar melhora sintomática e não remissão completa;
- ✓ Descontinuação lenta e gradual no uso prolongado.

Prof. Dr. Paulo Roberto

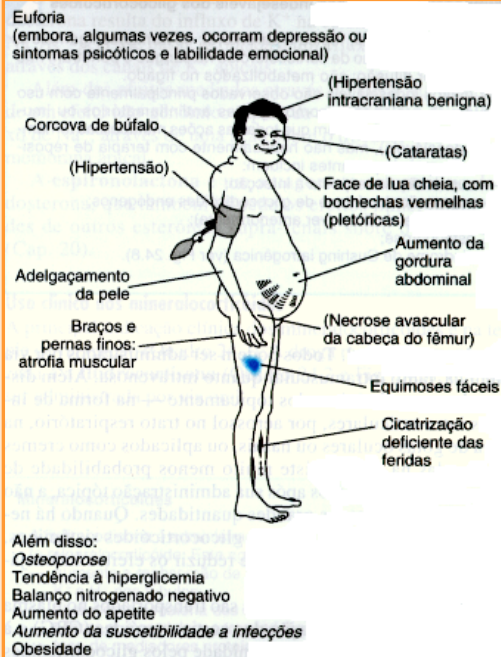
8

Efeitos Indesejáveis

- Os efeitos indesejáveis são observados principalmente com o uso sistêmico prolongado como agentes antiinflamatórios ou imunossupressores:
 - ✓ Supressão da resposta à infecção;
 - ✓ Supressão da síntese de glicocorticóides endógenos;
 - ✓ Ações metabólicas;
 - ✓ Síndrome de Cushing.

Prof. Dr. Paulo Roberto

9



Prof. Dr. Paulo Roberto

10

Propriedades Farmacológicas

Ação Curta (<12 h)	Ef. Antiinflam.	Ef. Mineralocort.
- Hidrocortisona	1	1
- Corticostona	0,8	0,8
Ação Intermediária (18 – 36 h)		
- Prednisona	4	0,3
- Prednisolona	5	0,8
- Metilprednisolona	5	0,5
- Triancinolona	5	0

Prof. Dr. Paulo Roberto

11

Propriedades Farmacológicas

Ação Prolongada (36 – 54 h)	Ef. Antiinflam.	Ef. Mineralocort.
- Betametasona	30	0
- Dexametasona	30	0
- Parametasona	10	0
Mineralocorticóides		
- Fludrocortisona	10	125
- Desoxicorticosterona	0	20

Prof. Dr. Paulo Roberto

12

Principais indicações clínicas

- ✓ **Terapia de reposição para pacientes com insuficiência renal:**
 - **Ministrar juntamente com um mineralocorticoide.**
- ✓ **Terapia antiinflamatória e imunossupressora**
 - **na asma (por inalação, ou, nos casos graves, por via sistêmica)**
 - **topicamente, em condições inflamatórias da pele, dos olhos, ouvidos e nariz.**
 - **nos estados de hipersensibilidade (p. ex., reações alérgicas graves a drogas ou ao veneno de insetos)**
 - **em doenças auto-imunes (artrite reumatóide, anemia hemolítica, púrpura trombocitopênica idiopática)**
 - **na prevenção da doença de enxerto.**

Prof. Dr. Paulo Roberto

13

Principais indicações clínicas

- ✓ **Terapia de doenças neoplásicas:**
 - **em combinação com agentes citotóxicos no tratamento de malignidade específicas (p. ex., Doença de Hodgkin, leucemia linfocítica aguda)**
 - **para reduzir o edema cerebral em pacientes com tumores cerebrais primários e metastásicos (dexametasona)**
 - **como componente do tratamento anti-emético em combinação com a quimioterapia**

**QUANDO UTILIZADOS COMO AGENTES
ANTIINFLAMATÓRIOS E IMUNOSSUPRESSORES, AS
AÇÕES METABÓLICAS TORNAM-SE EFEITOS
INDESEJÁVEIS**

Prof. Dr. Paulo Roberto

14