

# Analgésicos

*Clasificación y uso*

Los analgésicos son uno de los grupos farmacológicos de mayor consumo en España: en 2007 los analgésicos publicitarios (EFP) representaron el 14,5% de la cuota del mercado EFP (se dispensaron un total de 19.528.007 unidades). La autora estudia los distintos tipos de dolor, los analgésicos más relevantes y los consejos sobre paliación del dolor que pueden ofrecerse desde la oficina de farmacia.

ESTILITA ESTEVA

FARMACÉUTICA COMUNITARIA.

La palabra analgésico procede etimológicamente del prefijo griego a-/an-(carencia, negación) y de algos (dolor). Según la Asociación Internacional para el Estudio del Dolor (IASP), éste se define como la experiencia sensorial y emocional desagradable asociada a una lesión hística real o po-



tencial, o descrita en términos de dicho daño. Por tanto, el dolor no es solamente una sensación, es una experiencia. Además, no se trata únicamente de algo sensorial, sino que también es algo emocional. En ocasiones, el dolor no precisa de una lesión para manifestarse, puede existir en ausencia de ella.

El dolor es una experiencia subjetiva de gran complejidad. Presenta un componente nociceptivo, responsable de la transmisión de estímulos al sistema nervioso central que permiten defenderse ante situaciones nocivas o peligrosas para el organismo, y un componente emotivo y afectivo, que se caracteriza por irritabilidad, ansiedad y rabia en el caso de un dolor agudo y que puede derivar incluso en depresión cuando se transforma en un dolor crónico.

Los dos componentes del dolor son: sensorial y emocional. El primero, que equivale a nocicepción (estimulación de las vías nerviosas que conducen los estímulos dolorosos), se debe al estímulo de las terminaciones sensoriales. Normalmente hay una relación entre el estímulo sensorial y la intensidad del dolor (excepto en el dolor por inflamación o por lesión nerviosa). El componente emocional equivale a la vivencia individual que hace el paciente del estímulo nociceptivo. A menudo es el componente más importante, especialmente en casos de dolor crónico.

## Clasificación

En función de su duración, se diferencia entre el dolor agudo y el crónico (tabla 1):

### Dolor agudo

- Derivado de una lesión tisular.
- Forma parte de los mecanismos que protegen al organismo de su destrucción.
- Suele desaparecer con la curación del proceso que lo causó.

**Tabla 1. Características de los dolores agudos y crónicos**

Dolor agudo	Dolor crónico
Síntoma	Enfermedad
Estimulación vías nociceptivas	Puede persistir después de la lesión
Función protectora (señal alarma)	No función protectora
De corta duración (menos de 1 mes)	Larga duración (más de 3-6 meses)
Origen conocido (lesión tisular)	Origen incierto
Ansiedad, irritabilidad	Depresión, alteración del comportamiento

- Ejemplos: posoperatorio, dolor traumático, cefaleas tensionales, odontalgias y lumbalgia aguda.

### Dolor crónico

- Persiste más allá de la curación de la lesión.
- A menudo es difícil establecer una alteración hística que lo justifique.
- Se deben considerar dolores crónicos aquellos que cursan con brotes durante un largo período de tiempo.
- Ejemplos: migrañas, dismenorreas, dolores osteoarticulares (artritis reumatoide, artrosis, lumbalgia crónica), dolor neuropático (neuralgia del trigémino, neuropatía diabética, neuralgia postherpética, distrofia simpática refleja) y fibromialgia.

Desde el punto de vista fisiopatológico se distinguen varias fases:

- **Dolor de fase I o dolor fisiológico o nociceptivo.** Se caracteriza por estímulos nocivos breves y una buena correlación entre el estímulo y la intensidad. Ejemplos: dolor de pinchadas leves y estímulos térmicos sin lesión.
- **Dolor de fase II o dolor inflamatorio.** Se caracteriza por estímulos nocivos persistentes y poca correlación

## Fisiopatología del dolor

- Se genera en las estructuras periféricas denominadas nociceptores.
- Viaja al sistema nervioso central a través de las fibras aferentes primarias A $\delta$  y C.
- Se procesa en el asta posterior de la médula espinal, donde se encuentra sometido a influencias excitatorias e inhibitorias.
- Se procesa en el encéfalo por vías específicas, principalmente la espinotalámica.
- Los estímulos llegan al tálamo y posteriormente hasta la corteza somatosensitiva.
- Existe una modulación encefálica por diferentes áreas cerebrales.
- A partir del mesencéfalo y de los núcleos del rafe existen vías inhibitorias que se proyectan hacia la médula.
- El estímulo persistente causa cambios plásticos en las neuronas nociceptivas que podrían estar implicadas en el mantenimiento del dolor crónico.



entre el estímulo y la intensidad. Ejemplos: dolor posoperatorio, dolor traumático y dolor reumático.

- **Dolor de fase III o dolor neuropático.** Se caracteriza por una lesión nerviosa o central y por la ausencia de correlación entre el estímulo y la intensidad del dolor. Ejemplos: periférico (neuropatía diabética, síndrome del túnel carpiano) y central (dolor talámico y distrofia simpática refleja).

### Tratamiento farmacológico

- La vía oral es siempre la de elección.
- Las formas de liberación sostenida son útiles en el dolor crónico.
- Las formas efervescentes y las líquidas suelen dar lugar a concentraciones plasmáticas adecuadas con más rapidez que las formas sólidas.
- Se debe recordar que la tolerancia oral de los AINE mejora con la ingesta de alimentos y reduce los trastornos gastrointestinales.
- La vía parenteral es útil en caso de intolerancia oral o cuando sea preciso un efecto rápido.
- La vía rectal presenta una absorción más inexacta en comparación con otras vías.
- La vía tópica basada en el uso de parches es conveniente en el dolor crónico.
- En el caso de los AINE tópicos, se puede considerar que su eficacia es limitada y depende de la correcta realización del masaje.

Los analgésicos se clasifican en primarios, secundarios y coadyuvantes.

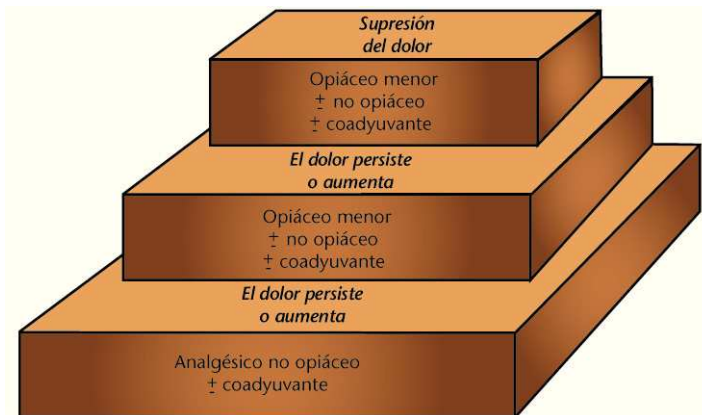


### Analgesicos primarios

Los analgésicos primarios tienen como efecto farmacológico principal aliviar el dolor. Son de amplio espectro, es decir, útiles en numerosos tipos de dolor. Se distinguen tres tipos:

## La escalera analgésica de la OMS

Se diseñó inicialmente para combatir el dolor oncológico. Sin embargo, en la actualidad se utiliza en la mayoría de pacientes que presentan dolor. Consiste en una graduación progresiva de la terapéutica analgésica de acuerdo con la respuesta obtenida por el paciente. Implica el empleo inicial de paracetamol y AINE, para pasar después a las asociaciones con opioides menores (codeína, etc.) y posteriormente a los opioides mayores (morfina, etc.).





### CONSEJOS DESDE LA FARMACIA

La elección de un analgésico para el tratamiento de la sintomatología dolorosa debe realizarse siempre de modo individualizado. Es necesario preguntar al paciente una serie de cuestiones que permitirán seleccionar el medicamento publicitario más adecuado y proporcionar consejo sanitario. Por ejemplo:

- ¿Qué síntomas presenta?
- ¿Cuándo comenzaron?
- ¿Dónde se localizan?
- ¿Cuál es su intensidad?
- ¿Está tomando algún medicamento?
- ¿Tiene alguna enfermedad?

En relación con la posología conviene:

- Establecer con claridad la posología eficaz y la máxima posible.
- Considerar la administración a demanda o pautada.
- Determinar el intervalo de administración.
- Aconsejar cuándo y cómo tomar los analgésicos.
- Supervisar la duración del tratamiento.

Respecto a las interacciones farmacológicas, el consejo farmacéutico debe ir encaminado a:

- Averiguar los fármacos de prescripción y los de autoprescripción (incluidos los productos fitoterapéuticos) que toma el paciente.
- Desaconsejar la administración de medicamentos sin control médico previo.

- Desaconsejar totalmente el consumo de alcohol conjuntamente con la toma de opioides.

Sobre las contraindicaciones, desde la oficina de farmacia habrá que:

- Asegurarse de que las condiciones fisiológicas o patológicas del paciente no son una limitación al tratamiento.
- Aconsejar sobre las situaciones de precaución (conducción de vehículos o manipulación de máquinas peligrosas).
- Determinar si existen antecedentes que puedan restringir su uso (alergias).

El farmacéutico también puede orientar sobre las precauciones de uso:

- Aconsejar cómo, cuándo y durante cuánto tiempo deben tomarse los medicamentos.
- Supervisar el establecimiento de medidas o medicación coadyuvante (protectores gástricos, antieméticos, laxantes, etc.)
- Detectar la presencia de reacciones adversas o de falta de respuesta terapéutica.

Finalmente, es conveniente que desde la farmacia se detecten las situaciones que aconsejan la visita médica, se deriven los pacientes al médico cuando se sospecha la existencia de enfermedad grave, evitar la automedicación y que los padres mediquen por su cuenta a los niños pequeños.

- Analgésicos-antitérmicos puros: paracetamol.
- Analgésicos-antiinflamatorios (AINE): ácido acetilsalicílico (AAS), ibuprofeno, iCOX selectivos (celecoxib y rofecoxib). Los AINE actúan bloqueando el enzima ciclooxigenasa (COX) e impidiendo la síntesis de prostanoïdes (prostaglandinas y tromboxanos). La COX tiene tres isoenzimas: COX-1, COX-2 y COX-3. LOS AINE bloquean de forma diferencial los tres isoenzimas lo que condiciona sus propiedades farmacológicas.
- Opioides: agonistas puros de los receptores opioides (morfina, codeína, metadona, fentanilo), parciales (buprenorfina), agonistas-antagonistas (pentazocina) y mixtos (tramadol).

Efectos indeseables:

- Frecuentes: náuseas, vómitos, estreñimiento, sedación, miosis y picor.
- Se presenta tolerancia por: analgesia, náuseas, vómitos, sedación y depresión respiratoria.
- No se presenta tolerancia por: miosis y estreñimiento.

Debido a estos efectos indeseables, se recomienda la administración de antieméticos al inicio del tratamiento y de laxantes en tratamientos de media y larga duración.

### Analgésicos secundarios

Los analgésicos secundarios tienen otras indicaciones, pero pueden disminuir algún tipo de dolor específico. Son de espectro reducido y los hay de varios tipos:

- Antidepresivos: amitriptilina y clorimipramina.

Se debe recordar que la tolerancia oral de los AINE mejora con la ingesta de alimentos y así se consigue reducir los trastornos gastrointestinales



## Analgésicos relevantes

Se describen a continuación los detalles sobre dosificación, posología y precauciones de los analgésicos de uso más habitual.

- **Ácido acetilsalicílico (AAS) y derivados (salicilatos).** La dosis oral para adultos es de 500 mg cada 4 h.

No se debe administrar en caso de úlcera duodenal, asma, problemas de coagulación sanguínea, últimas semanas de embarazo, niños menores de 12 años con infección vírica o lactantes (se excreta en la leche materna).

- **Paracetamol.** No es un AINE y es el analgésico más utilizado en el mundo. En los territorios de influencia anglosajona se conoce como acetaminofeno. La dosis por vía oral en adultos es de 325-650 mg cada 4 h. La dosis oral infantil es de 20-40 mg/kg/día.

Es de elección en pacientes que siguen un tratamiento anticoagulante, ya que no altera la síntesis de protrombina ni la agregación plaquetaria, así como en ulcerosos y en pacientes renales. Es el analgésico y antipirético infantil ya que no causa síndrome de Reye. No se debe administrar en caso de insuficiencia hepática y/o renal y no se deben superar los 4 g diarios.

- **Ibuprofeno.** En adultos, por vía oral, la dosis más frecuente es de 600-1.200 mg repartidos en varias tomas, y no se recomienda superar los 1.200 mg diarios. La dosis oral infantil es de 10 mg/kg/6 h con las comidas.

No se debe administrar a pacientes que presenten úlcera duodenal, asma, problemas de coagulación o en el último trimestre de embarazo.

- **Metamizol.** Es un derivado pirazolónico que actúa impidiendo la formación de prostaglandinas, ya que inhibe la enzima ciclooxigenasa. Es analgésico y antipirético, con un débil efecto antiinflamatorio. Está indicado en el tratamiento de dolor agudo. La dosis oral en adultos es de 575 mg cada 6-8-12 h. La dosis parenteral suele ser de 2 g cada 8 h.

No se debe administrar en los siguientes casos: porfiria (trastorno del metabolismo de los pigmentos sanguíneos que forman parte de la hemoglobina), deficiencia de la enzima glucosa 6-fosfatodeshidrogenasa y antecedentes de anemia aplásica o agranulocitosis (disminución del número de glóbulos blancos en sangre).

- **Tramadol.** Es un fármaco agonista de los receptores opioides que también actúa sobre las vías serotoninérgicas. De acción central, actúa sobre las células nerviosas específicas de la médula espinal y del cerebro. Está indicado en el tratamiento del dolor de intensidad moderada a severa. La dosis oral en adultos suele ser de 50 a 100 mg cada 6-8 h. La forma *retard* se inicia con tratamientos de 50-100 mg cada 12 h y se puede aumentar hasta 150-200 mg cada 12 h, dependiendo de la intensidad del dolor. La dosis inyectable en adultos es inicialmente de 100 mg, pudiéndose administrar durante la hora posterior 50 mg cada 10-20 min, sin sobrepasar una dosis total de 250 mg. Posteriormente de 50 a 100 mg cada 6-8 h.

No se debe administrar en casos de insuficiencia hepática grave y de epilepsia no controlada con tratamiento. ■

- Antiepilépticos: carbamazepina, lamotrigina, gabapentina y topiramato. Están indicados en el tratamiento del dolor que tiene un origen neurógeno o neuropático. El mecanismo fundamental de acción de los antiepilépticos, en los síndromes neurógenos, es su acción sobre el sistema de propagación de la descarga neuronal, ya que al bloquear los canales de Na dependientes del voltaje estabilizan la membrana neuronal y suprimen la hiperexcitabilidad neuronal anómala.
- Corticoides.
- Vasodilatadores: antagonistas del calcio.
- Vasoconstrictores: derivados ergóticos.

- Relajantes musculares: diazepam, tetrazepam y ciclobenzaprina (antidepresivo tricíclico empleado como relajante muscular).
- Anestésicos locales: lidocaína y prilocaína.

Los coadyuvantes o auxiliares se administran conjuntamente con los analgésicos primarios y/o secundarios para potenciar sus efectos analgésicos o para contrarrestar sus efectos indeseables. Se emplean:

- Psicofármacos: neurolepticos, ansiolíticos y anfetaminas.
- Corticoides.
- Antieméticos y laxantes. ■