

Administración de AINE por vía tópica

MARIÁN CARRETERO

Vocal de Distribución del COF de Barcelona.



Los antiinflamatorios no esteroideos (AINE) son un grupo de fármacos muy diversos estructuralmente que se dividen en seis grupos y se caracterizan por producir efectos antiinflamatorios, analgésicos y antipiréticos mediante la inhibición de la ciclooxigenasa, enzima que cataliza la síntesis de prostaglandinas a partir del ácido araquidónico. Por lo general, los AINE se administran por vía oral, pero existen también formulaciones para su uso por vía tópica.

Los AINE son utilizados ampliamente en el tratamiento de la inflamación y el dolor musculoesqueléticos de origen reumático o debido a diferentes artropatías y también para el tratamiento del dolor o inflamación producido por lesiones traumáticas y de origen no reumático.

Las enfermedades reumáticas del sistema osteoarticular y musculoesquelético necesitan una terapia directa con el fin de eliminar la inflamación y el dolor asociados a la misma. En el caso de la osteoartritis, las lesiones sintomáticas a menudo se limitan a una sola articulación, por lo que es habitual

prescribir una terapia farmacológica local que pueda evitar reacciones adversas sistémicas y que permita de este modo el uso de agentes antiinflamatorios y analgésicos más potentes. Los principales síntomas de la osteoartritis son dolor y agarrotamiento, además de una alta actividad inflamatoria. El uso de linimentos, geles y cremas de aplicación tópica con diversos principios activos, entre los que se encuentran los AINE, ha sido y sigue siendo el tratamiento habitual del dolor musculoesquelético.

También es habitual el uso de AINE en las lesiones traumáticas originadas por la práctica del

deporte, que vienen acompañadas de dolor e inflamación. El traumatismo más frecuente y más estudiado implica la articulación del tobillo debido a una carga excesiva en el mecanismo articular o a un falso movimiento de éste. La reacción que sigue al trauma se caracteriza por una alteración de la pared capilar, con el consecuente edema y hematoma. La cápsula de la articulación se distiende, retuerce o desgarrar, y la inflamación posttraumática conduce a los clásicos signos de inflamación, dolor y aumento de la temperatura local, que en conjunto alteran la función de la articulación. El tratamiento

de estos traumatismos y contusiones requiere, ante todo, aliviar la presión ejercida sobre la articulación afectada por la inflamación y edemas asociados. Para ello, se emplean fármacos de acción local que poseen una rápida acción antiedematosa y antiinflamatoria, ya que son capaces de penetrar con facilidad a través de las diferentes capas de la piel. El tratamiento inadecuado de una lesión aguda puede provocar que ésta se convierta en crónica, por lo que es importante el tratamiento inmediato de la lesión. En este sentido, los AINE tópicos facilitan una terapia rápida y efectiva.

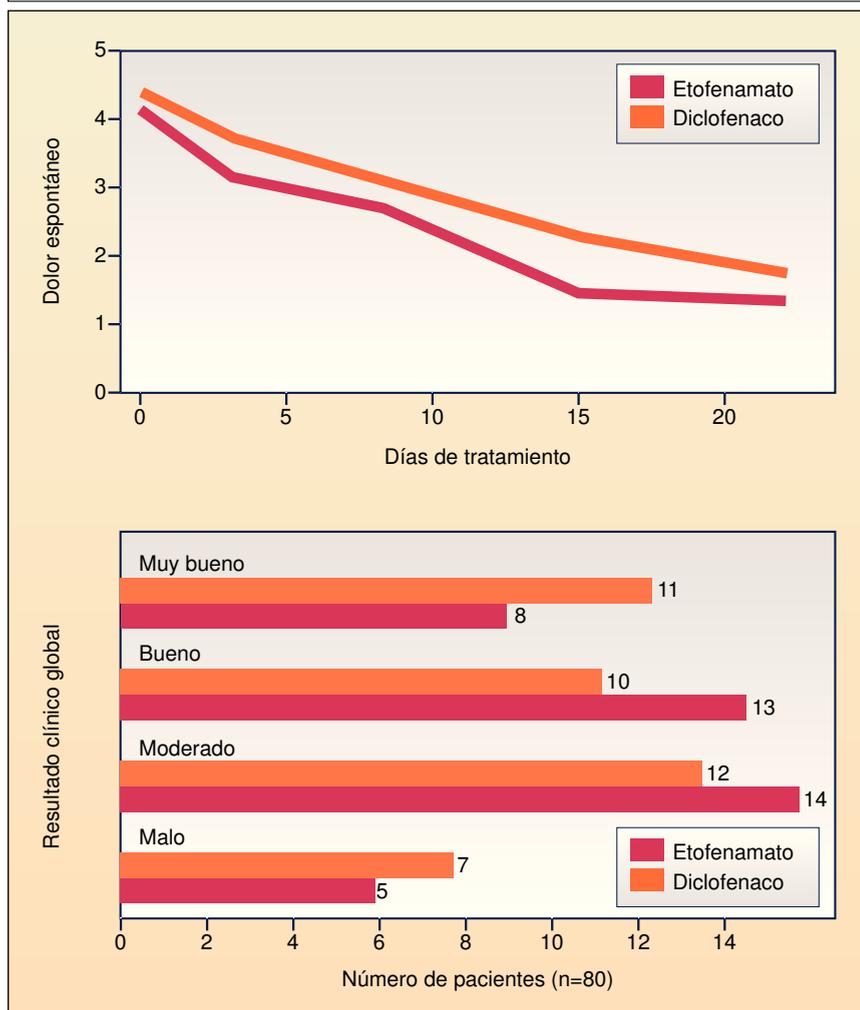
Los síntomas dolorosos asociados a cambios osteoartropáticos de la espina ósea son también susceptibles de ser tratados con AINE tópicos. Tanto los cambios inflamatorios como los cambios degenerativos de los discos intervertebrales y de las estructuras ligamentosas se hallan implicados en la etiología de estos síndromes que, a menudo, producen dolencias transitorias o crónicas y una limitación funcional extendida. La compresión mecánica ejercida sobre las raíces espinales de nervios puede explicar en muchos casos el dolor, las alteraciones sensoriales y la afectación de reflejos tendinosos. El tratamiento de esta sintomatología está basado en el uso de AINE. El 95% de los casos de neuralgia lumbar aguda, ciática y neuralgia crural mejoran la sintomatología dolorosa mediante terapia farmacológica, sin que sea necesario recurrir a la intervención quirúrgica.

Tratamiento con AINE tópicos

El uso extenso de AINE se asocia en ocasiones a riesgo de efectos gástricos. Se ha intentado reducirlos mediante una buena educación sanitaria que evite la ingesta innecesaria de AINE y con la coadministración de agentes gastroprotectores. El uso de AINE por vía tópica reduce notablemente el riesgo de complicaciones gastrointestinales.

Las reacciones adversas asociadas al tratamiento con AINE tópicos pueden dividirse en reacciones cutáneas locales y reacciones sistémicas generalizadas. Las primeras

Eficacia de una dosis única de almotriptán de 6,25 y 12,5 mg y placebo en el tratamiento de la migraña a las 2 horas de la administración



son infrecuentes y de carácter leve, incluyendo eritema, prurito, irritación, sensación de calor o quemazón y dermatitis de contacto. En lo que respecta a las reacciones sisté-

micas, la baja incidencia de efectos adversos sistémicos mostrada por los AINE tópicos está relacionada con la menor concentración plasmática que se alcanza tras la apli-

Clasificación química de los AINE

Clase química	AINE
Ácidos carboxílicos	
Acetilados	Ácido acetilsalicílico
No acetilados	Diflunisal
Ácidos acéticos	Diclofenaco, etodolaco, indometacina, sulindac, tolmetina
Ácidos propiónicos	Fenbufeno, fenoprofeno, flurbiprofeno, ibuprofeno, ketoprofeno, naproxeno, piroprofeno
Ácidos fenámicos	Ácido flufenámico, ácido meclofenámico, ácido mefenámico, etofenamato
Ácidos enólicos	Fenilbutazona
Pirazolonas	Isoxicam, piroxicam, tenoxicam, meloxicam
Oxicams	
Agentes no ácidos	Nabumetona

Eficacia de almotriptán 2 mg subcutáneo (n = 31), almotriptán, 6 mg (n = 29), almotriptán, 10 mg (n = 31), y placebo (n = 32) en el tratamiento de la migraña

Diagnóstico	Número de pacientes	Reducción de dosis de AINE (%)
Síndromes reumáticos no articulares	905	62,5%
Artrosis	1.288	49,7%
Espondiloartrosis	640	51,5%
Poliartritis crónica	572	41,3%
Espondilitis anquilosante	153	37,8%

cación tópica de un AINE comparado con la administración de la misma dosis por vía oral. Las concentraciones plasmáticas de AINE halladas tras su aplicación tópica son por término medio menores del 10% del valor alcanzado mediante la administración oral del fármaco. Se han observado diferencias entre las reacciones adversas producidas por AINE de uso tópico, siendo el etofanato el fármaco que produce menor incidencia de efectos adversos cutáneos y sistémicos.

Diversos estudios prueban la mejor tolerancia del tratamiento con AINE utilizando la vía tópica. Existe evidencia experimental y bibliográfica que demuestra que los AINE administrados por vía tópica alcanzan concentraciones farmacológicamente relevantes en los tejidos blandos. En diferentes ensayos clínicos controlados y multicéntricos los AINE tópicos han sido significativamente más eficaces que el placebo: al menos uno de cada tres pacientes que utilizó un AINE tópico alcanzó un 50% de reducción del dolor frente al placebo.

Los AINE administrados por vía tópica mostraron concentraciones plasmáticas bajas, a la vez que se observaron altas concentraciones en los tejidos adyacentes a la zona de aplicación del fármaco. Diversos estudios que comparan AINE

tópicos y orales no muestran un beneficio estadísticamente significativo de los últimos, considerándose en general su eficacia como equivalente.

Los AINE inhiben la ciclooxigenasa, una enzima clave en la vía de síntesis de prostaglandinas a partir del ácido araquidónico y esta inhibición explica el eficaz efecto antiinflamatorio de los AINE. Pero las prostaglandinas también se hallan implicadas en la función renal al poder modificar flujos sanguíneos renales, aumentar la excreción de iones por inhibición de la reabsorción tubular proximal, oponerse al efecto de la hormona anti-diurética y estimular la liberación de renina. Esta posible toxicidad renal queda casi excluida con la utilización de AINE vía tópica.

Etofenamato

El etofenamato es un nuevo analgésico y AINE que se aplica por vía tópica. Es eficaz para tratar cuadros dolorosos e inflamatorios de origen reumático, traumático, muscular, deportivo y del aparato locomotor. Una de sus principales características es su alta penetración a través de la piel, lo cual produce un rápido alivio de las molestias y una recuperación más precoz de la movilidad. □