

FARMACOLOGÍA DE LA ESCALERA ANALGÉSICA

Medicamentos del primer escalón

Aspirina

Actúa mediante la inhibición de la síntesis de prostaglandinas. Su vida media es de 3 a 6 horas. Es muy efectiva en los dolores óseos.

Efectos secundarios:

- Irritación gástrica
- Dolor epigástrico
- Hipoacusia
- Prurito

Dosis máxima:

- 1000 mg (1 gr.) cada 4 horas

Normalmente se utiliza un derivado de la aspirina, que es el acetilsalicilato de lisina debido a que tiene menos efectos secundarios a nivel gástrico.

Nombres comerciales: INYESPRIN ORAL FORTE (sobres de 1.800 mg de acetilsalicilato de lisina equivalente a 1 gr. de ácido acetilsalicílico)

Paracetamol

No tiene actividad antiinflamatoria Es la alternativa cuando no se puede usar por alguna causa la aspirina. Su vida media es de 3 a 4 horas.

Dosis máxima:

- 1000 mg (1 gr.) cada 4 horas.

Nombres comerciales:

- EFFERALGAN (500 mg en comprimidos efervescentes).

Metamizol

Por su actividad espasmolítica es muy efectivo en los dolores viscerales.

Dosis máxima:

- 8 gr. diarios

Nombre comercial:

- NOLOTIL (Cápsulas de 500 mg, supositorios de 1 gr. y ampollas de 2 gr.). Las ampollas se pueden dar por vía oral (son amargas).

Ibuprofeno

Buena analgesia en picos dolorosos. Se pueden dar hasta tres dosis consecutivas con un intervalo de media hora cada una.

Dosis máxima:

- 2.400 mg. diarios

Nombre comercial:

- ESPIDIFEN (sobres de 400 mg de Ibuprofeno-Arginina).

Naproxeno

Dosis máxima:

- 1.250 mg

Nombre comercial:

- NAPROSYN (Comprimidos ranurados, sobres y supositorios de 500 mg).

Medicamentos del segundo escalón

Codeína

- Efectos secundarios:
- Estreñimiento
- Náuseas
- Vómitos
- Mareos

Dosis máxima:

- 60 mg cada 4 horas

Nombre comercial:

- CODEISAN (comprimidos y supositorios de 30 mg de fosfato de codeína)

Dihidrocodeína

Efectos secundarios:

- Estreñimiento
- Náuseas
- Vómitos
- Mareos

Dosis habitual:

- 1 comprimido cada 12 horas. Los comprimidos deben tragarse completos y sin masticar.

Dosis máxima:

- 2 comprimidos cada 12 horas

Nombres comerciales:

- CONTUGESIC (60 mg de tartrato de dihidrocodeína) La dihidrocodeína es un derivado de la codeína.

Tramadol

Agonista opioide con acción no opioide. Efectos secundarios similares a la codeína

Dosis habitual:

- 50/100 mg cada 8/6 horas.

Nombres comerciales:

- ADOLONTA, TRALGIOL (cápsulas de 50 mg, supositorios y ampollas de 100 mg).

NOTA: hay una asociación muy interesante para su uso en Medicina Paliativa: 500 mg de paracetamol + 30 mg de codeína. Permite ahorrar al paciente la ingesta de una medicina.

Nombre comercial:

- COD-EFFERALGAN (comprimidos efervescentes)

Medicamentos del tercer escalón

Morfina

Es el fármaco de elección.

Usos:

- Dolor
- Disnea
- Tos
- Diarrea

Efectos secundarios:

- Estreñimiento
- Náuseas y vómitos
- Astenia
- Sudoración
- Confusión con obnubilación. Puede producirse, sobre todo, al comenzar el tratamiento.

Vida Media:

- La forma oral soluble (solución acuosa de morfina) y la forma oral sólida de liberación inmediata (SEVREDOL) presentan una vida media de 4 horas.
- En cambio, la forma oral de liberación controlada (MST CONTINUS) tiene una vida media de alrededor de 12 horas.

Presentaciones, vías de administración y dosificación

Forma oral soluble: solución acuosa de morfina

Esta forma no está comercializada y debe ser preparada por el farmacéutico. Cuando se use, es conveniente recordar que las dosis deben administrarse cada 4 horas.

Forma oral sólida de liberación inmediata: Sevredol

Preparado:

- Sulfato de morfina de liberación inmediata

Indicaciones:

- Alivio del dolor severo que requiera tratamiento con opioides
- Titulación de dosis al inicio del tratamiento con morfina.
- Tratamiento de "rescate" en casos de episodios de dolor aislados durante el tratamiento con morfina de liberación controlada.

Presentaciones:

- Comprimidos de 10 y 20 mg.

Administración:

- Cada 4 horas.

Esquema de dosificación:

- Un paciente que esté tomando Codeína a dosis máximas (60 mg cada 4 horas) o Dihidrocodeína (dosis de 120 mg/ 12 horas), y no se consiga un adecuado alivio de su dolor, se recomienda suspender estos fármacos e iniciar el tratamiento con morfina (ver tabla de dosis equianalgésicas de opioides en la página 61).
- Inicialmente, se instaurará el tratamiento de ajuste de dosis con la morfina de liberación inmediata (SEVREDOL, un comprimido de 10 ó 20 mg cada 4 horas) hasta el inicio del tratamiento con la morfina de liberación controlada (MST CONTINUS).
- Una vez titulado el paciente con la morfina de liberación inmediata, para calcular la dosis de la morfina de liberación controlada a administrar, se debe calcular la dosis total diaria de la forma inmediata que ha recibido el paciente y dividirla en dos tomas.
Ejemplo: Si el paciente ha recibido una dosis total diaria de SEVREDOL de 60 mg (esto es: 10 mg/4 horas) se deberá pasar a una dosis inicial de 30 mg/12 horas de MST CONTINUS.

Si durante el tratamiento con la dosis analgésica correcta de morfina de liberación controlada (cada 12 horas), el paciente presenta episodios aislados de dolor, se recomienda pautar como dosis de rescate, la administración de 1 comprimido de 10 a 20 mg cada 4 horas de la forma de liberación inmediata, hasta conseguir de nuevo el correcto alivio del dolor.

Nota: En pacientes con dificultad de deglución, los comprimidos de sevredol pueden ser machacados para su disolución en agua.

Forma oral sólida de liberación controlada: MST Continus

Preparado:

- Sulfato de morfina de liberación controlada

Indicaciones:

- Tratamiento prolongado del dolor crónico severo que requiera tratamiento con opioides.

Presentaciones:

- Comprimidos de 10, 30, 60 y 100 mg.

Administración:

- Cada 12 horas.

Esquema de Dosificación:

Una vez realizado el ajuste de dosis al comenzar el tratamiento con morfina (según se indica en el apartado anterior), se continuará el tratamiento con una morfina de liberación controlada que permite la administración de dosis cada 12 horas.

Si el paciente ha estado tratado previamente con morfina parenteral, para compensar la diferencia en biodisponibilidad, se recomienda comenzar con una dosis de la morfina de liberación controlada, incrementada del orden del 50-100%.

Se recomienda comenzar el tratamiento con un comprimido cada 12 horas de MST Continus. Si a las 24-48 horas, la analgesia es insuficiente, se aumentará la dosis en un 50%. El aumento de dosis se hará en función de la respuesta del paciente.

Ejemplo:

- Comenzar con una dosis de 30 mg/12 horas de MST Continus.
- Si el dolor persiste o aumenta: 60 mg/12 horas

- Si el dolor persiste o aumenta: 90 mg/12 horas
- Si el dolor persiste o aumenta: 120 mg/12 horas
- Si el dolor persiste o aumenta: 160 mg/12 horas
- Si el dolor persiste o aumenta: 200 mg/12 horas

Los comprimidos se deben tragar enteros y sin masticar.

Es prácticamente imposible que se produzca una depresión respiratoria cuando se usa morfina oral para controlar el dolor provocado por el cáncer y las dosis han sido rigurosamente adaptadas a cada paciente. Si se produjese alguna vez, se dispone de un antídoto específico, NALOXONE.

Forma parenteral: Cloruro mórfico

- Ampollas de 0.01 gr. (1ml=10 mg).
- Ampollas de 0.02 gr. (1 ml=20 mg).
- Ampollas al 2%, de 2 ml (40 mg) y 20 ml (400 mg).

Cuando se está tratando al paciente por vía oral y se decide pasar a la vía parenteral, hay que administrar de un tercio a un medio de la dosis oral que está tomando el paciente. Esto es debido a que la morfina por vía oral se absorbe sólo de un 30 a un 35% de la dosis administrada.

El grupo de expertos de la Asociación Europea de Cuidados Paliativos ha propuesto las siguientes relaciones de potencia para la morfina, dependiendo de la vía de administración:

- Vía oral a vía rectal, la relación es 1:1
- Vía oral a vía subcutánea, la relación es 2:1
- Vía oral a vía endovenosa, la relación es 3:1

El esquema podría ser el siguiente:

- Morfina oral o rectal 3
- Morfina subcutánea 1,5
- Morfina endovenosa 1.

Conviene recordar las dosis equianalgésicas de los diferentes opioides para calcular la dosis inicial de opioide cuando se ha decidido cambiar de uno a otro.

- MORFINA 10 mg IM equivale a:
 - BUPRENORFINA 0,4 mg
 - CODEÍNA 130 mg
 - DIHIDROCODEÍNA 120 mg
 - HEROÍNA 5 mg
 - FENTANIL 0,1 mg
 - MEPERIDINA 75-100 mg
 - METADONA 10 mg
 - TRAMADOL 100 mg

Vías de administración:

- IV, IM o SC.

Dosificación:

- Cada 4 horas.

Si se hace en infusión continua, se consigue mayor efectividad analgésica y menos efectos secundarios, además de evitar un pinchazo doloroso cada 4 horas.

Coadyuvantes

Son una serie de medicamentos que se pueden utilizar conjuntamente con los analgésicos de los escalones y alguno de ellos incluso es el tratamiento de elección en algunos tipos de dolor.

- Corticoides
- Antidepresivos
- Anticonvulsivantes
- Fenotiazinas
- Baclofeno
- Anestésicos locales
- Bifosfonatos

Corticoides

Usos en Cuidados Paliativos

- Usos generales:
 - Aumenta el apetito
 - Aumenta la fuerza
 - Aumenta la sensación de bienestar
- Usos como analgésicos:
 - En el aumento de la presión intracraneal
 - En la compresión nerviosa
 - En la compresión medular
 - Dolor óseo, hepatomegalia, linfedema
- Usos específicos:
 - Fiebre y sudoración
 - Síndrome de la vena cava superior

Efectos secundarios:

- Digestivos (hemorragias)
- Insomnio (por eso es conveniente pautarlos por la mañana y al mediodía)
- Candidiasis oral

Formas de presentación comercial y dosificación:

A) Dexametasona:

- FORTECORTIN, comprimidos de 1 mg
- FORTECORTIN, ampollas de 4 mg
- FORTECORTIN, ampollas de 40 mg

No tiene actividad mineralocorticoide y por tanto no produce retención hidrosalina.

B) 6 - Metilprednisolona:

- SOLU-MODERIN, ampollas (40, 125 mg y 1 y 2 gr)
- URBASON, comprimidos de 40 mg, 16 mg. y comprimidos retard de 8 mg, ampollas de 20, 40 y 250 mg.

C) Deflazacort:

- DEZACOR, comprimidos de 6 y 30 mg y gotas (1=1mg).
- ZAMENE (igual al anterior).

Equivalencias de los corticoides:

- DEXAMETASONA 0.75 mg equivale a:

- METIL PREDNISOLONA, 4 mg
- PREDNISOLONA, 5mg
- HIDROCORTISONA, 20 mg
- CORTISONA, 25 mg
- DEFLAZACORT, 7,5 mg

El más utilizado es la dexametasona por su potencia.

Dosis orientativas:

- En procesos menores, como la fiebre, la sudoración, anorexia, etc., se puede utilizar de 2 a 4 mg diarios de dexametasona,
- En procesos mayores, como el síndrome de compresión medular o el síndrome de la vena cava superior, se pueden dar de 16 a 24 mg diarios.

Antidepresivos

El que más se utiliza por su efecto analgésico es la Amitriptilina. Este fármaco se puede utilizar en la depresión, la incontinencia y el espasmo de vejiga, pero sobre todo en el DOLOR POR DEAFERENCIACION en el que se utiliza como analgésico de elección. Este es uno de los tipos de dolor en que la morfina apenas es efectiva. Un ejemplo típico de este dolor es la NEURALGIA POSTHERPETICA.

Se le llama dolor disestésico superficial y normalmente sigue el curso de una metámera. El paciente refiere que le provoca dolor incluso el roce de la ropa, una corriente de aire etc.

Esquema de dosificación de la Amitriptilina (Tryptizol) como analgésico		
DOSIS	VEJOS	JOVENES
25 mg/noche	1ª semana	1º día
50 mg/noche	2ª semana	2º a 4º día
75 mg/noche	3ª - 4ª semana	5º a 21º día
100 mg/noche	5ª - 6ª semana	3ª a 4ª semana
150 mg/noche	7ª - 8ª semana	5ª a 6ª semana

El TRYPTIZOL se presenta en comprimidos de 10, 25, 50 y 75 mg. También hay una forma inyectable de 10 mg. La amitriptilina tiene un efecto ventana en algunos pacientes, por el que su acción disminuye con dosis medias y vuelve a actuar con el incremento de la dosis. El efecto se observa a los 3-4 días y hay que esperar 4 semanas para retirarlo por falta de eficacia. Hay que explicar al enfermo que este medicamento no se lo recomendamos como psicofármaco, sino como analgésico.

Anticonvulsiantes

El que se utiliza normalmente es la Carbamacepina, Es una sustancia que tiene una especial apetencia por el SNC. Tiene una gran utilidad en Cuidados Paliativos como analgésico en el dolor neuropático que se presenta "en sacudidas" o "en latigazo".

El paciente lo refiere como un dolor discontinuo en forma de "puñalada intermitente".

El ejemplo típico es la neuralgia del trigémino. Es un dolor insensible a la morfina.

Nombre comercial:

- TEGRETOL

Presentaciones:

- Comprimidos de 200 y 400 mg

Dosificación orientativa:

- Administrar 200 mg por la noche. Si no ha sido suficiente lo anterior, administrar 200 mg en almuerzo y cena. A la semana se puede aumentar a 200 mg tres veces al día.

Fenotiacinas

Principio activo:

- Clorpromacina, es el más utilizado.

Nombre comercial:

LARGACTIL

Propiedades y usos:

- Antiemético
- Sedante nocturno
- Dolor por tenesmo rectal
- Hipo

Efectos secundarios:

- Efectos anticolinérgicos (sequedad de boca, palpitaciones, etc.)
- Reacciones extrapiramidales
- Somnolencia

Presentaciones:

- Comprimidos de 25 y 100 mg
- Gotas. Una gota = 1 mg
- Ampollas de 25 mg

Dosificación:

- Normalmente, se puede dar de 75 a 150 mg diarios repartidos en tres tomas, según la edad del paciente. Siempre empezar por dosis bajas y nocturnas. En algunos casos, se puede llegar a los 300 mg (en insomnios rebeldes). La vía parenteral se utiliza como antiemético cuando es necesario por vómitos continuos y para la sedación terminal. La dosis orientativa para la sedación terminal es de 25 a 50 mg varias veces al día, según respuesta del paciente.