

SEMINARIO 3

FARMACOLOGÍA DE LOS ANESTÉSICOS LOCALES

1. ANESTÉSICOS LOCALES INYECTABLES

1.1. GENERALIDADES

1.2. VASOCONSTRICTORES

1.3. SELECCIÓN DEL AL

2. ANESTÉSICOS LOCALES TÓPICOS

(AEROSOL POR FRÍO)

ANESTESICOS LOCALES INYECTABLES: GENERALIDADES

- Bloquean la transmisión nerviosa de forma reversible.
- Infiltrativos y tronculares.
- Posteriormente restauración de la conducción nerviosa.

ANESTÉSICOS LOCALES INYECTABLES: GENERALIDADES

Clasificación:

1. Esteres:

- ✓ **Cocaína:** 1^a anestésico local que se utilizó en 1884 por Hall.
- ✓ **Procaína:** prototipo inicial de los anestésicos locales aunque carece de propiedades anestésicas tópicas.

ANESTESICOS LOCALES

INYECTABLES:

GENERALIDADES

Clasificación:

1. Amidas:

✓ Lidocaína

✓ introducida en 1948

✓ es uno de los AL que más se usan

✓ produce anestesia más rápida, intensa, duradera y amplia que procaína

✓ efectos tópicos muy buenos

✓ Es el agente de elección en pacientes sensibles a los ésteres.

✓ Prilocaína

✓ inicio y duración de su acción un poco + larga que lidocaína

✓ Duración \pm 2 h y 3 veces más potente que procaína

ANESTÉSICOS LOCALES INYECTABLES: GENERALIDADES

Clasificación:

1. Amidas:

✓ Mepivacaína

- ✓ Inicio de acción más rápida y duración + prolongada que lidocaína.**
- ✓ Carece de propiedades tóxicas.**
- ✓ Duración aprox. 2 h y es 2 veces + potente que la procaína**

✓ Bupivacaína

- ✓ 4 veces más potente que lidocaína.**
- ✓ Su inicio de acción es más lenta, pero dura ± 6 h**

ANESTÉSICOS LOCALES

INYECTABLES:

GENERALIDADES

Amidas: riesgos mas bajos, > beneficio < alergias

Los anestésicos del grupo éster se metabolizan en el plasma por la enzima pseudocolinesterasa → ppal metabolito Ac. Paraaminobenzoico → responsable de las reacciones alérgicas.

Los anestésicos del grupo amida se metabolizan en el hígado y no forman Ac.paraaminobenzoico.

Los anestésicos locales se excretan por la orina.

ANESTÉSICOS LOCALES INYECTABLES: **GENERALIDADES**

- Componentes de la solución:

- AL: conc. variable → al ↑ concentración ↑ potencia no toxicidad.
- **Vasoconstrictor**
- Antioxidantes: Sulfitos → captan el O₂ para evitar que se inactive en VC.
- Conservantes antisépticos: para conservarlo estéril
- Estabilizadores ph: NaOH (para ↑), ClH (para ↓)
- Ajuste de la osmolaridad: ClNa para evitar dolor y edema.

ANESTÉSICOS LOCALES INYECTABLES: **VASOCONSTRICTORES**

- Tipos:

- **Simpáticomiméticos: Adrenalina y Noradrenalina**
- **Derivados de la vasopresina: Felipresina**

- Mecanismo de acción:

- **Disminuye el flujo sanguíneo alrededor de la zona anestesiada.**

- Efectos conseguidos:

- **Mayor duración y potencia de la anestesia**
- **Disminuye la hemorragia**
- **Disminuye el riesgo de reacciones adversas sistémicas**

VENTAJAS DE LOS VASOCONSTRICTORES

- Mantienen la concentración anestésica deseada.**
- Aumenta el período de vida útil.**
- Isquemia local en cirugía.**
- Evitar que el AL pase a la corriente sanguínea.**
- Disminuir la concentración relativa de AL para disminuir el efecto tóxico.**
- Necesidad de < cantidad y conc. de las soluciones.**
- Disminución de las microhemorragias.**
- Contrarrestar el efecto vasodilatador de los AL.**

ANESTESICOS LOCALES INYECTABLES: **VASOCONSTRICTORES**

- Contraindicaciones de VC simpáticomiméticos:

➤ **Absoluta:**

- **Hipertiroideos no controlados**
- **Toxicidad o alergias al VC**

ANESTESICOS LOCALES INYECTABLES: **VASOCONSTRICTORES**

- Contraindicaciones de VC simpáticomiméticos:

➤ **Relativa rigurosa:**

- **Antidepresivos tricíclicos**
- **Enfermedades sistémicas graves**
- **Administraremos 1:100.000, DM 50 μ gr, 2'7 carpules**

ANESTESICOS LOCALES INYECTABLES: VASOCONSTRICTORES

- Contraindicaciones de VC simpaticomiméticos:

➤ Relativa moderada:

- Tto con betabloqueantes.**
- Tto con antihipertensivos.**
- Anestesia general con halotano.**
- Administraremos 1:100.000, DM 100 μ gr, 5'5 carpules**

ANESTESICOS LOCALES INYECTABLES: **VASOCONSTRICTORES**

- Contraindicaciones de VC derivados de vasopresina:

➤ **Relativa:**

- **Cardiopatía isquémica: no + 5 carpules de 1'8 ml a 0'03 UI (0'54 μ gr/ml)**

➤ **Absoluta:**

- **3° trimestre de embarazo: es similar a la oxitocina**

ANESTÉSICOS LOCALES

INYECTABLES:

SELECCIÓN DEL ANESTÉSICO LOCAL

1. DURACIÓN DEL TRATAMIENTO

AL de corta duración

- **Mepivacaína 3%:**
 - Menos potente
 - Indicado cuando está contraindicado VC
 - Dosis máxima absoluta: 5'5 carpules (70 kg o más)
 - Cuidado en niños

- **Prilocaina 3% + Felipresina 0'03UI:**
 - Solución de baja potencia
 - Indicado cuando está contraindicado VC simpaticomimético
 - Dosis máxima absoluta: 7'5 carpules en 70 kg o más

ANESTÉSICOS LOCALES

INYECTABLES:

SELECCIÓN DEL ANESTÉSICO LOCAL

AL de acción intermedia

- **Lidocaína + Adrenalina 1:80.000 o 1:100.000**
 - Más utilizado por su potencia y duración y gran seguridad
- **Articaína 4% + Adrenalina 1:100.000**
 - Más potente que el anterior
 - Indicado en: fracaso de técnicas convencionales, dientes hipersensibles, pacientes hipersensibles y susceptibles al dolor
 - DM absoluta: 4'5 carpules

ANESTESICOS LOCALES

INYECTABLES:

SELECCIÓN DEL ANESTÉSICO LOCAL

AL de acción prolongada

- **Bupivacaína 0'5% + Adrenalina 1:200.000**
 - **Reciente comercialización en España**
 - **Duración: 8 horas**
 - **Indicado: necesidad de un efecto anestésico de larga duración**
 - **Contraindicado en menores de 12 años**
 - **Terminado el efecto anestésico queda un efecto residual analgésico muy favorable en postoperatorios quirúrgicos dento maxilares y maxilofaciales.**

ANESTESICOS LOCALES

INYECTABLES:

SELECCIÓN DEL ANESTÉSICO LOCAL

2. NECESIDAD DE HEMOSTASIA:

- **Lidocaína 2% + Adrenalina 1:50.000**
 - **Concentración de adrenalina máxima: 20 μ gr/ml**
 - **Dosis máxima: 5'5 carpules en pac de 50 kg o mas**
 - **Contraindicado en niños**
 - **Indicaciones:**
 - **Cirugía oral**
 - **R y AI radicular**
 - **Obturaciones C III, IV y V**
 - **Impresiones de prótesis fija**

ANESTESICOS LOCALES

INYECTABLES:

SELECCIÓN DEL ANESTÉSICO LOCAL

3. CONTROL DEL DOLOR POSTOPERATORIO:

- **AL de duración prolongada**
- **Etidocaína: anestésico de acción larga.**
- **> toxicidad**
- **Estructura es similar a la de la lidocaína,**
- **Ventajas potenciales frente a la bupivacaína que por su acción larga puede prescindir de los vc, su efecto residual analgésico >, y efecto de toxicidad sistémica <**

ANESTESICOS LOCALES INYECTABLES:

CONTRAINDICACIONES DEL AL O DEL VC

- **Contraindicaciones de los AL:**
 - **Absoluta: alergia**
 - **Alergias cruzadas: escasas pero evitaremos amidas con similitud estructural:**
 - **Lidocaína y prilocaína**
 - **Mepivacaína y bupivacaína**
- **Contraindicaciones de los VC:**
 - **Si CI absoluta: AL sin VC**
 - **Si alergia a sulfito: AL sin VC**

ANESTÉSICOS LOCALES INYECTABLES

DOSIFICACIÓN

- Concentración más baja y menor volumen que proporcione anestesia adecuada.

ANESTÉSICOS LOCALES INYECTABLES

FARMACOCINÉTICA

- **Atraviesa BP y BHE**
- **Se distribuye en leche materna**
- **Metabolismo hepático**

ANESTÉSICOS LOCALES INYECTABLES

INTERACCIONES

- **AL: dosis mínima anestésica si:**
 - **Tto con antihistamínicos: depresor SNC**
 - **Tto con depresores del SNC**
- **VC:**
 - **Antiarrítmicos**
 - **Antihipertensivos**
 - **Hormonas tiroideas**

ANESTÉSICOS LOCALES INYECTABLES

EFFECTOS SECUNDARIOS

- **Si se produce suele ser por:**
 - » **Inyección intravascular accidental**
 - » **Sobredosis**
 - » **Elección inadecuada del AL**
- **Pacientes pediátricos y geriátricos: disminuir la dosis**
- **Las reacciones sistémicas pueden ser inmediatas o a los 30 min**
- **Efectos 2arios:**
 - » **Reacciones alérgicas, exantemas, dermatitis**
 - » **Tumefacción en zona de inyección, párpados, garganta**
 - » **Parestesias**
 - » **Palpitaciones, nerviosismo, temblor (VC)**
 - » **Alergia a sulfito: broncoespasmo**

ANESTÉSICOS LOCALES TÓPICOS

- AL sobre la mucosa oral
- Concentraciones más altas que las infiltrativas

ANESTÉSICOS LOCALES TÓPICOS

- **Benzocaína: (éster)**

- **Rápida acción y mínima absorción**
- **Baja potencia y corta duración**
- **Uso al 20% en gel o solución**

- **Lidocaína: (amida)**

- **2-4% Atomizador al 10%**
- **Características medias**

ANESTÉSICOS LOCALES TÓPICOS

- **Tetracaína: (éster)**

- **1-2 %**
- **Muy potente, comienzo es tardío y muy tóxico**

- **Cocaína: (éster)**

- **20% o más: AL potente, rápido y seguro: su efecto vc ↓ toxicidad sistémica**
- **Necesaria una receta especial**

ANESTÉSICOS LOCALES TÓPICOS: AEROSOL POR FRIO

- **Aerosoles con componente volátil (cloruro de etilo o derivados).**
- **Problemas:**
 - ↓ **duración del efecto anestésico**
 - **CI en niños**
 - **Inhalación**
 - **Mal control de la dosis**
 - **Se dispersa por la boca**

~~VASOCONSTRICTORES : Porcentaje y Dosis Máxima~~

	Concentración	μGr/ml	Mg/ml	D.Máxima
ADRENALINA	1:50.000	20	0.020	200 μgr
	1:80.000	12.5	0.0125	
	1:100.000	10	0.010	
	1:200.000	5	0.005	
FELIPRESINA	1:1.850.000	0.54	0.03UI	0.72 μgr 0.39UI

~~ANESTÉSICOS LOCALES : Porcentaje y Dosis Máxima~~

	D.MAX (mg/kg)	Mg/ml	Mg/carpule
LIDOCAÍNA 2%	4'3	20	36
MEPIVACAÍNA 3%	4'3	30	54
PRILOCAÍNA 3%	5'7	30	54
ARTICAÍNA 4%	4'3	40	72