

# **BLOQUE VII: FARMACOLOGÍA DE LA ANESTESIA**

**TEMA 32. ANESTÉSICOS LOCALES** 

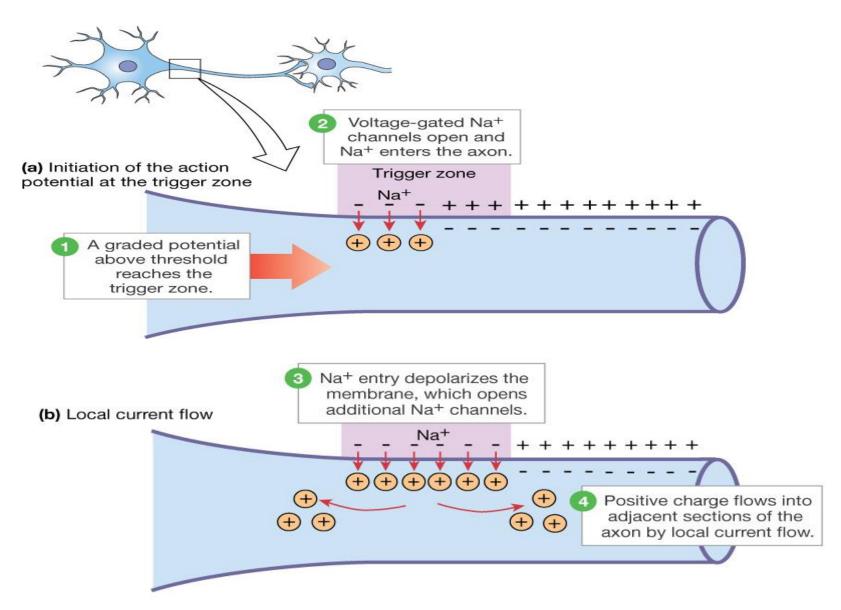
### **TEMA 32. ANESTÉSICOS LOCALES**

- 1. Fisiología básica de la transmisión nerviosa
- 2. Anestésicos locales:
  - 1. Mecanismo de acción
  - 2. Propiedades químicas y farmacocinéticas
  - 3. Técnicas de anestesia local
  - 4. Efectos adversos
  - 5. Fármacos

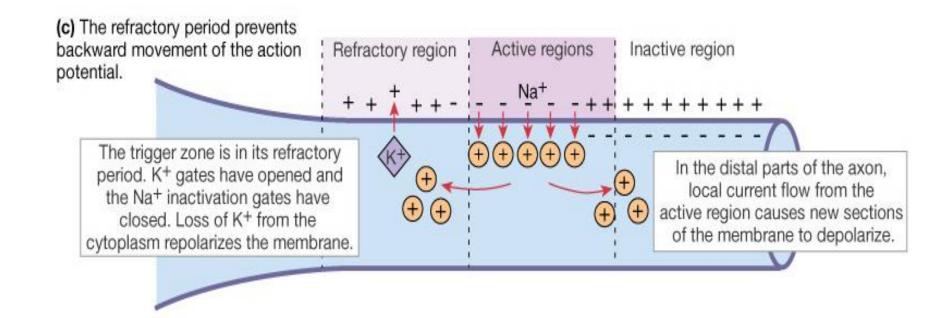
### **BIBLIOGRAFÍA:**

Farmacología en Enfermería. 2ª ed. Ed. Médica Panamericana. Madrid (2020), Capítulo 8.
 Anestesia

## FISIOLOGÍA DE LA TRANSMISIÓN NERVIOSA







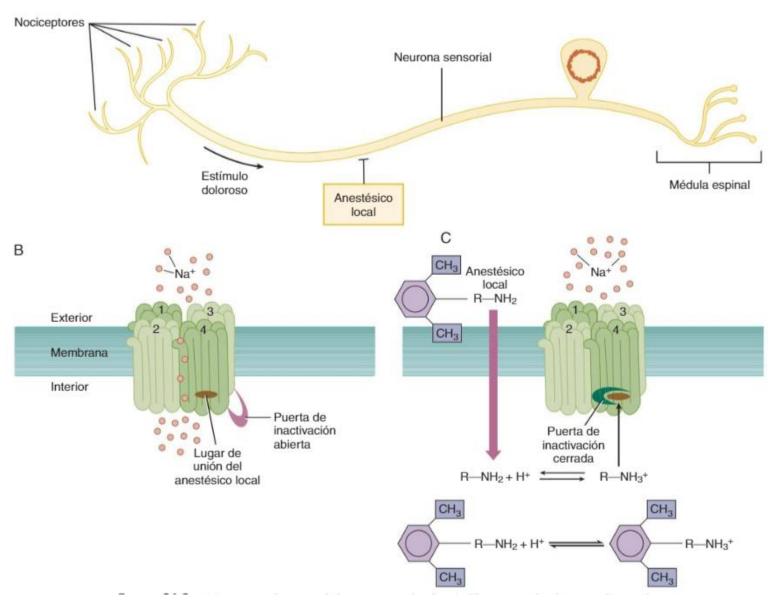


## ORDEN DE BLOQUEO DE LAS FIBRAS NERVIOSAS

Orden de bloqueo	Tipo de fibra	Diámetro	Mielina	Velocidad conducción	Función
1	С	+	-	+	Dolor- Temperatura
2	Αδ	+++	++	+++	Dolor- Temperatura
3	Αβ	++++	+++	++++	Tacto- Presión
4	Αα	++++	+++	+++++	Motora



## **MECANISMO DE ACCIÓN**



Tomado de Brenner G.M. y Stevens C.W. (2019). Farmacología Básica. 5° ed. Ed. Elsevier

### ¿Qué se pide a un anestésico local?

- 1. Que no sea irritante para el tejido y no dañe irreversiblemente las fibras nerviosas
- 2. Que su toxicidad sistémica sea escasa
- 3. Tiempo breve para el inicio de los efectos anestésicos
- 4. Duración del efecto anestésico suficiente pero no excesiva

### Características de la anestesia local:

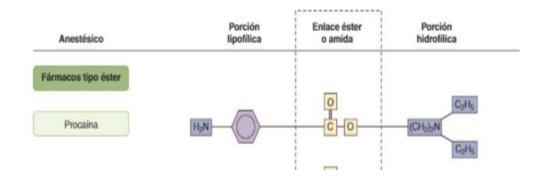
- 1. Pérdida reversible de la sensación dolorosa en la zona de aplicación.
- 2. No hay pérdida de la consciencia ni del control de las funciones vitales
- 3. El grado de afectación nerviosa variará en función de la técnica de aplicación empleada

## PROPIEDADES QUÍMICAS Y FARMACOCINÉTICAS

### La lipofilia determina la potencia y duración de acción

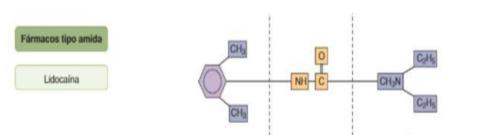
#### **GRUPO ESTER:**

- metabolismo por esterasas plasmáticas
- rápida velocidad de inactivación



#### **GRUPO AMIDA:**

- raramente producen reacciones alérgicas
- mayor duración de acción
- metabolismo hepático CYP-450
- tienden a producir vasoconstricción



Todos se excretan en orina en forma de metabolitos inactivos



<u>pKa</u>: A menor Pka menor periodo de latencia
 Los AL son bases débiles (pKa 7.5 y 9) en ocasiones se añaden soluciones alcalinas

- <u>Liposolubilidad:</u> A mayor liposolubilidad mayor potencia
- Unión a proteínas: A mayor fijación mayor duración del efecto

Tabla 18-2 Características farmacológicas de los principales anestésicos locales

	Liposolu- bilidad	Potencia relativa	pK,	Comienzo de acción	Unión a proteínas (%)	Duración de la acción (min)
Potencia baja y duración corta					_	
Procaína	1	1	8,9	Lento	6	60-90
Potencia y duración intermedias						
Mepivacaina	2	2	7,6	Rápido	75	120-240
Prilocaína	2	2	7,7	Rápido	55	120-240
Lidocaína	3,6	2	7,7	Rápido	65	90-200
Potencia alta y duración larga						
Ametocaína (tetracaína)	80	8	8,6	Lento	80	180-600
Bupivacaina	30	8	8,1	Intermedio	95	180-600
Ropivacaína	3	8	8,0	Intermedio	94	180-600



## **TÉCNICAS DE ANESTESIA LOCAL**

### 1. ANESTESIA TÓPICA O SUPERFICIAL

Presentaciones farmacéuticas: Cremas, sprays, supositorios, gotas y pastillas

- no se extiende a los tejidos subcutáneos
- tiene su Emax después de la aplicación (intervenciones oftálmicas, intubaciones y broncoscopias, sobre mucosas para aliviar el dolor)
- Puede haber reacciones de hipersensibilización en personas alérgicas
- Riesgo de toxicidad sistémica con concentraciones elevadas y en áreas grandes

### 2. ANESTESIA POR INFILTRACIÓN

- inyección directa en el tejido subcutáneo por debajo de la piel
- Indicado en procedimientos quirúrgicos menores (suturar una herida, extracción de cuerpos extraños, en procesos odontológicos)
  - Suele asociarse con un vasoconstrictor

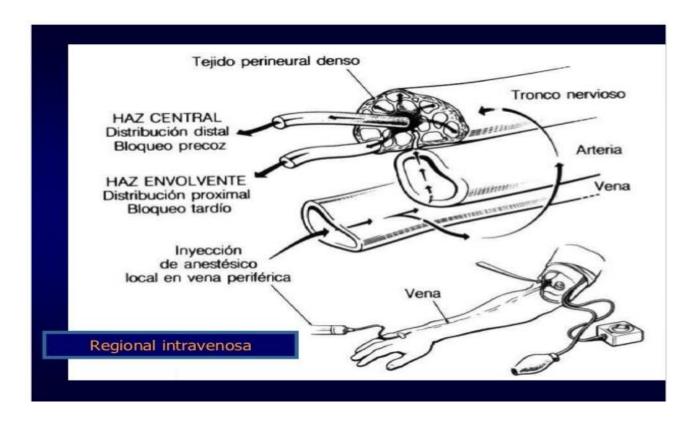
### 3. ANESTESIA POR BLOQUEO NERVIOSO PERIFÉRICO

- inyección del AL en el interior o adyacente a un nervio periférico o a un plexo nervioso
- Se utiliza para bloquear la sensibilidad en una extremidad o áreas extensas de la cara (odontología): se anestesian zonas más amplias
- Bloqueo sensorial y motor
- Permite utilizar dosis menores pero exige una gran precisión



### 4. ADMINISTRACIÓN I.V. REGIONAL

- Indicada para cirugía menor de las extremidades inferiores, manipulación de fracturas
- El AL se inyecta directamente en los vasos sanguíneos, se hace un torniquete para reducir al máximo el retorno venoso.
- Se recupera rápidamente la sensación dolorosa
- Riesgo de toxicidad sistémica



5. <u>BLOQUEO NERVIOSO CENTRAL</u>, se utiliza ampliamente en intervenciones quirúrgicas y obstétricas

### 5.1. ANESTESIA ESPINAL o RAQUÍDEA,

- inyección en el espacio subaracnoideo intratecal, (bloquea las fibras somatosensoriales y motoras en procedimientos quirúrgicos (cirugía de extremidades inferiores estructuras pélvicas).
- La extensión del AL a lo largo del neuroeje se controla por: i) inclinación horizontal del paciente y ii) la gravedad específica de la solución (soluciones hiperbáricas

#### 5.2. ANESTESIA EPIDURAL,

- inyección en el espacio epidural de las regiones lumbar, sacra, cervical o torácica, por infusión continua o dosis repetidas
- Tras administración epidural el AL se absorbe a la circulación sistémica (monitorizar dosis



#### **ANESTESIAS LOCALES**

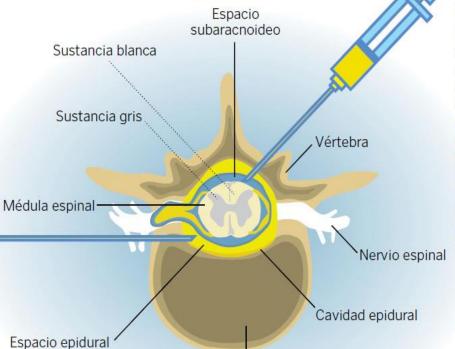
#### Epidural o peridural

Anestesia en la que la inyección de medicamento tiene lugar en el espacio epidural, es decir, fuera del saco de líquido alrededor de la médula espinal.

En este caso el efecto comienza a manifestarse pasados 10 ó 20 minutos.

Con frecuencia, se deja un catéter pequeño por el que se puede recibir más medicamento para controlar el

dolor durante o después del procedimiento.



Cuerpo vertebral

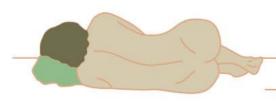
#### Raquídea

Técnica consistente en la inyección de anestesia local en el interior del líquido cefalorraquídeo que baña la médula espinal, concretamente en el espacio subaracnoideo. Es utilizada más frecuentemente para procedimientos cortos y simples.

#### Posición del paciente

#### Decúbito lateral

Comunmente se elige un espacio situado entre la tercera y cuarta vértebra lumbar siempre por debajo de la segunda vértebra lumbar (L2).



#### Decúbito prono

Utilizada junto con la anestesia hipobárica para procedimientos del recto, periné y ano.

#### Posición semisentado

Usada principalmente para pacientes con problemas de sobrepeso y en procesos ginecológicos y urológicos.



### **EFECTOS ADVERSOS derivados del bloqueo nervioso central**:

- Retención urinaria
- Cefaleas, hipotensión (especialmente importante durante el embarazo),
- pérdida de la consciencia y paro respiratorio (si el AL asciende a un lugar elevado de la médula)
- Dolor de espalda
- Riesgo pequeño de infección o meningitis (anestesia espinal)
- Neurotoxicidad en la madre y el neonato (anestesia epidural)

## **EFECTOS ADVERSOS**:

Dependen de la concentración plasmática alcanzada

Se relaciona con:

- La dosis administrada
- La <u>vascularización</u> del área infiltrada



## **UTILIZACIÓN DE VASOCONSTRICTORES para:**

- Localizar el anestésico en el punto deseado, ya que los AL inducen vasodilatación local al disminuir el tono simpático
- Retrasar el paso del anestésico a la circulación sistémica, lo que reduce su toxicidad sistémica
- Aumentar la intensidad y duración de la anestesia
- Reducir el riesgo de hemorragia debido a la intervención quirúrgica

Los vasoconstrictores más utilizados son: **adrenalina** (1/80.000- 1/250.000) y fenilefrina (1/25.000)

No utilizar nunca para anestesiar dedos y zonas acras, pueden provocar necrosis

### **EFECTOS ADVERSOS:**

### Son independientes de la técnica anestésica utilizada

### 1. <u>SISTEMA NERVIOSO CENTRAL</u>:

- Estimulación del SNC: inquietud temblor, euforia
- seguida de inhibición: adormecimiento y sedación
- cefalea, parestesias y náuseas

<u>Concentraciones muy altas</u>: crisis epilépticas seguidas de coma (<u>muerte por insuficiencia</u> <u>respiratoria</u>)

### 2. SISTEMA CARDIOVASCULAR:

Hipotensión e insuficiencia cardiaca

Concentraciones muy altas: inhiben la conducción cardiaca y prolongación del intervalo QRS

### 3. BLOQUEAN LA TRANSMISIÓN NEUROMUSCULAR

Pérdida del tono muscular

Los AL potencian el efecto de los bloqueantes neuromusculares

### 4, <u>REACCIONES DE HIPERSENSIBILIDAD</u>:

5. <u>REACCIONES PSICOMOTORAS Y VASOVAGALES</u> (no relacionadas con el fármaco)

# TIPOS DE ANESTÉSICOS LOCALES (AL):

### 1. AL SÓLO DE USO TÓPICO

### **CLORURO DE ETILO**.

- Insensibilización de los nervios periféricos (-200°C).
- Anestésico tópico en intervenciones quirúrgicas menores y en medicina deportiva
   (1-2 aplicaciones, Emáx 15-20 s)
- Raramente (< 1%) dermatitis de contacto</li>

### EMLA (lidocaina + procaina), crema

- En pediatría (venopunción)
- Inserción de catéteres, desbridamiento de heridas
- Anestesia de mucosas

AMINOAMIDAS	INDICACIÓN CLÍNICA	CONTRAINDICACIONES/ PRECAUCIONES
LIDOCAÍNA Inicio rápido y duración INTERMEDIA (90-200 min)	<ul> <li>Anestesia por infiltración local</li> <li>Anestesia por bloqueo nervioso y anestesia epidural</li> <li>Anestesia regional IV</li> <li>Anestesia tópica (intubación tracto respiratorio, uretra), pastillas para chupar</li> </ul>	<ul><li>Hipotensión</li><li>Náuseas</li></ul>
BUPIVACAÍNA Inicio intermedio y duración larga (180-600 min)	<ul> <li>Anestesia por infiltración</li> <li>Anestesia de conducción</li> <li>Anestesia espinal y epidural</li> <li>Bloqueo diagnóstico y terapéutico (tratamiento del dolor)</li> <li>Anestesia epidural y caudal para parto vaginal</li> </ul>	Reducir la dosis en presencia de enfermedad hepática o renal.



AMINOAMIDAS	INDICACIÓN CLÍNICA	CONTRAINDICACIONES/ PRECAUCIONES
MEPIVACAÍNA Inicio rápido y duración intermedia (120-290 min)	<ul> <li>Anestesia por infiltración</li> <li>Bloqueo nervioso periférico</li> <li>Anestesia epidural y caudal.</li> <li>Anestesia en odontología por infiltración o bloqueo troncular</li> <li>Bloqueo simpático</li> </ul>	<ul> <li>Reducir la dosis un 30% en obstetricia</li> <li>Presenta efecto vasoconstrictor</li> </ul>
LEVOBUPIVACAINA Inicio intermedio y duración larga (120-600 min)	<ul> <li>Dolor agudo (perfusión o bolo epidural)</li> <li>Bloqueo nervioso periférico</li> <li>Anestesia epidural e intratecal</li> <li>Bloqueo peribulbar en cirugía oftálmica</li> <li>Infiltración local</li> </ul>	
<u>ROPIVACAINA</u>	Tratamiento del dolor agudo en adultos y pediatría (epidural, infiltración y bloqueo nervioso	



AMINOÉSTERES	Indicación Clínica	Contraindicaciones/ Precauciones
PROCAINA Inicio lento y duración corta (60-90 min)	<ul> <li>Anestesia por infiltración (dolor asociado a heridas, cirugía menor, quemaduras)</li> <li>Bloqueo nervioso periférico</li> </ul>	Es la que más afecta al SNC
BENZOCAÍNA Baja potencia, pobre absorción	Tópicamente sobre mucosas (quemaduras, prurito, patologías cutáneas, anestesiar membranas mucosas, tos)	Reacciones de hipersensibilidad
TETRACAÍNA Inicio rápido y duración larga (180-600 min)	<ul> <li>Anestesia tópica (cateterismos, cistoscopias, sondajes uretrales, intubación, oftalmología)</li> <li>Coadyuvante en preparados lubricantes urológicos</li> </ul>	Reacciones anafilácticas

