

UNIDAD IV: DOLOR Y ANESTESIA

Lección 17

Anestésicos locales

Guión

1. CONCEPTO.
2. CLASIFICACIÓN.
3. MECANISMO DE ACCIÓN. EFECTOS FARMACOLÓGICOS
4. FARMACOCINÉTICA. EMPLEO JUNTO CON VASOCONSTRICTORES
5. REACCIONES ADVERSAS
6. APLICACIONES TERAPÉUTICAS

1. CONCEPTO



Erythroxylon coca

Cocaína

En 1860 se aísla de la planta.

En 1884, Koller demostró sus efectos anestésicos locales sobre la córnea





- “Fármacos que **bloquean, de forma reversible, la transmisión nerviosa** en cualquier parte del SN en que se apliquen”
 - Solo afecta a las **neuronas próximas** al lugar de la administración
 - Suprimen el dolor **sin deprimir la conciencia**
 - **Menos riesgos** que la anestesia general

Tipo éster

- **Procaína** (acción corta).
- **Cocaína** (acción intermedia).
- **Tetracaína** (acción larga).

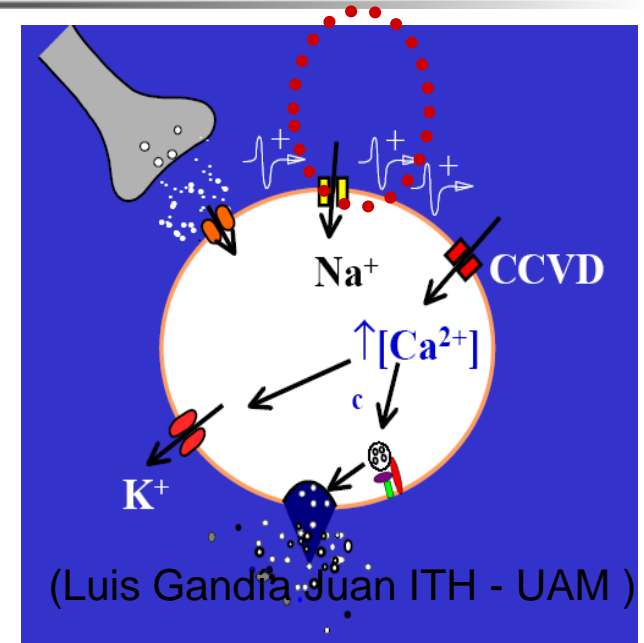
Tipo amida

- **Lidocaína** (acción corta).
- **Mepivacaína** (acción intermedia).
- **Bupivacaína** (acción larga).

¿DIFERENCIAS?

3. MECANISMO DE ACCIÓN

- Actúan sobre receptores de membrana:



– **Bloquean los canales del sodio**

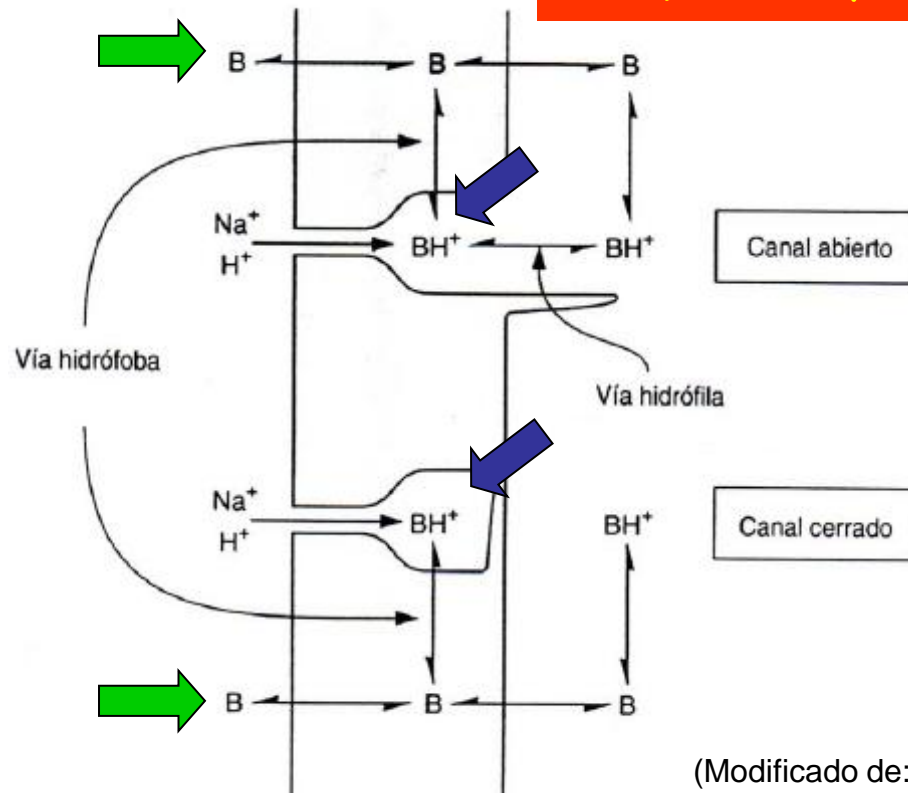
- Impiden la despolarización y prolongan el periodo refractario...

Factores que condicionan la acción

- **Liposolubilidad**
 - Potencia y duración de acción
- **pKa (7,5 - 9)**
 - Comienzo de la acción

Asociación con bicarbonato 1 M

¿Cómo les afecta la inflamación?



(Modificado de: Luis Gandía Juan ITH - UAM)

Efectos

- **Más sensibles** las fibras amielínicas o poco mielinizadas que transmiten **sensaciones dolorosas** (además tacto y temperatura)
 - **Cualquier fibra nerviosa**, si el anestésico local alcanza **suficiente concentración** se podría afectar.

- Sensitivas
- Simpáticas
- Motoras

4. FARMACOCINÉTICA

- Absorción
 - Paso desde el punto donde es administrado a sangre, depende de
 - Zona de inyección: \uparrow/\downarrow vascularización
 - Tipo de anestésico
 - Dosis o concentración
 - Velocidad de la inyección
- Distribución
 - Amplia. Todos atraviesan la BHE
- Eliminación
 - Según preparados.
 - Éster: mediante pseudocolinesterasa a metabolitos inactivos que se excretan por orina
 - Metabolitos alergizantes
 - Amidas: metabolización hepática a **metabolitos activos** que se excretan por orina.

Empleo junto con vasoconstrictores

¿Cuándo termina la acción?

- **El abandono del sitio de acción** → el efecto tiende a desaparecer →

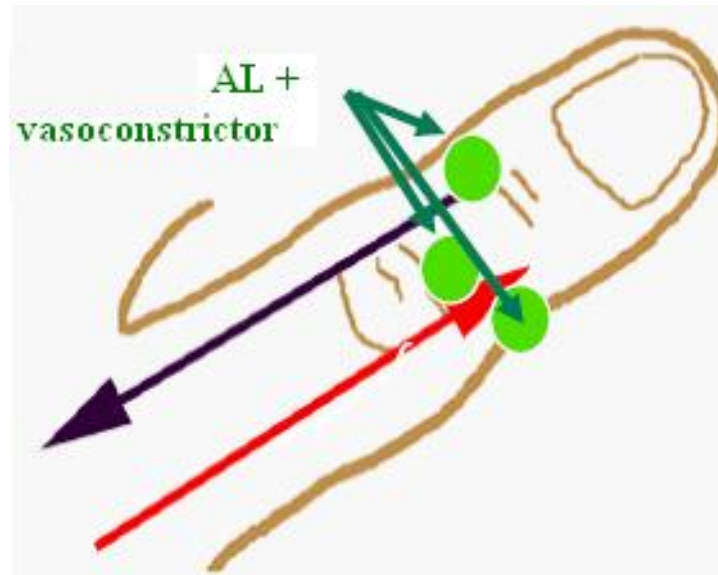
Se distribuye al resto del organismo
→ **efectos a otros niveles:** cerebro,
corazón... **RAM**

AL junto con vasoconstrictores

- **Adrenalina (¿Mecanismo de acción?):**
 - Disminuye el flujo sanguíneo → ↓ el paso a circulación sistémica...

- La acción comienza antes, dura más, es más intensa.
- **Menos riesgo de efectos sistémicos**
- Dosis menores

AL junto con vasoconstrictores



(Modificado de <http://www-personal.umich.edu/~mshlafer/nupharm.html>)

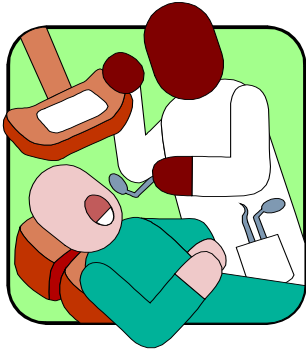
- Riesgo de **isquemia** en territorios con irrigación terminal (dedos)

Contraindicación

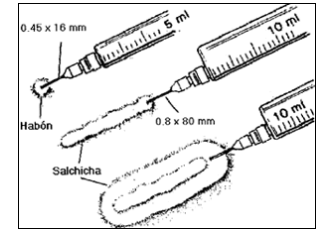
5. RAM

- Neurológica:
 - Temblor y convulsiones → coma y parada cardiorrespiratoria
- Cardiovasculares: Depresión cardíaca y vasodilatación, con hipotensión y arritmias
 - La cocaína es la excepción (¿por qué?)
- Reacciones alérgicas
 - Preparados de tipo éster (alergias cruzadas entre ellos):
dermatológicas, asmáticas o shock anafiláctico.

6. APLICACIONES TERAPÉUTICAS Y TIPOS DE ANESTESIA LOCAL.



- Anestesia superficial o tópica
- Anestesia por infiltración
- Anestesia regional intravenosa
- Bloqueo nervioso periférico
- Anestesia medular (subaracnoidea)
- Anestesia epidural



(<http://www.cfnavarra.es/salud/anales/textos/vol22/suple2/suple6.htm>)

Hipotensión
Bradicardia
(-) respiratoria

Retenc. urinaria
Cefaleas

