

Licenciatura en Medicina Humana

Materia:

Terapéutica Farmacológica

Trabajo:

Resumen de Anestésicos Locales

Docente:

Dr. Alfredo López López.

Alumno:

Carlos Alfredo Solano Díaz.

Semestre y Grupo:

4° "A"

Tuxtla Gutiérrez, Chiapas a; 28 de Septiembre de 2020.

Actualmente el dolor físico está considerado como una señal de alerta o como un complejo proceso de defensa indicativo de que algo no funciona como debiera, sin embargo, su percepción sensitiva es subjetiva y se asocia a una componente emocional.

El dolor es una experiencia sensorial y emocional desagradable, asociada a una lesión tisular real o potencial, o que se describe como ocasionada por dicha lesión»

ANESTÉSICOS LOCALES

Los anestésicos locales son fármacos capaces de bloquear de manera reversible la conducción del impulso nervioso en cualquier parte del sistema nervioso a la que se apliquen, originando una pérdida de sensibilidad y siendo la recuperación de la función nerviosa completa una finalizado su efecto.

ESTRUCTURA

Estructuralmente, las moléculas de los actuales anestésicos locales están integradas por tres elementos básicos:

- Un grupo hidrofóbico: un anillo aromático, determinante de la liposolubilidad, difusión y fijación de la molécula. a mayor liposolubilidad mayor potencia.
- Un grupo hidrofílico: una amina secundaria o terciaria, que modula la hidrosolubilidad y por consiguiente su difusión sanguínea e ionización.
- Una cadena intermedia con un enlace de tipo éster amida, responsable de la velocidad de metabolización del fármaco y, por tanto, determinante de la duración de la acción y su toxicidad.

Los anestésicos locales son bases débiles que poseen un valor de pKa variable entre 7,5-9, y están ionizados parcialmente a pH fisiológico.

El factor pH es, por tanto, un elemento importante a la hora de determinar la efectividad del anestésico local, los tejidos inflamados y/o infectados poseen un pH ácido, y en esas zonas se ve reducido el efecto anestésico del fármaco administrado.

FARMACOCINÉTICA

Su absorción depende tanto de la dosis, como de la concentración y de la vascularización del tejido donde se administre.

Así la vía subcutánea es la que presenta menor absorción. Esta se incrementa siguiendo la siguiente pauta: ciática, plexo braquial, epidural, paracervical, intracostal, traqueal e intravenosa.

Ciertos anestésicos locales pueden formularse combinados con epinefrina (adrenalina), vasoconstrictor que reduce la absorción sistémica del fármaco. Esta combinación es efectiva, especialmente en tejidos muy vascularizados, para alcanzar concentraciones más altas del fármaco en el lugar de administración, prolongar su efecto anestésico y a la vez disminuir los efectos adversos a nivel sistémico derivados de su administración, su eliminación, en ambos casos, es mayoritariamente renal y una pequeña proporción con las heces.

ESTÍMULO NERVIOSO Y MECANISMO DE ACCIÓN

Los estímulos nerviosos generan un impulso, un potencial eléctrico o potencial de acción que por medio de la fibra nerviosa se propaga manteniendo la misma intensidad inicial.

La estructura de bicapa fosfolipídica de la membrana celular impide la libre circulación de iones del interior al exterior celular por su alta hidrofobicidad, por lo

cual los cambios en la permeabilidad de la membrana son el resultado de la apertura y cierre de canales iónicos ionóforos– que permiten el paso de iones a través de la membrana.

Al producirse un estímulo nervioso se inicia la despolarización de la membrana: se activan los canales de Na^+ , permitiendo la introducción al espacio intracelular de iones Na^+ . Al alcanzarse la máxima despolarización, la permeabilidad del canal de sodio disminuye bloqueando la entrada de este ión al interior celular.

Paralelamente, el canal de potasio incrementa su permeabilidad facilitando que el ión potasio pase del espacio intracelular al extracelular por gradiente de concentración. El paso siguiente es la repolarización de la membrana: el restablecimiento de las condiciones iniciales, siendo los iones Na^+ y K^+ transportados, en dirección inversa, gracias a la bomba de Na-K y pasando el canal de sodio de estado inactivo a estado de reposo.

Los anestésicos locales actúan a este nivel. Impiden la propagación de los potenciales de acción en las membranas neuronales mediante el bloqueo de los canales de Na^+ voltaje dependientes, disminuyendo así la entrada de ión Na^+ al espacio intracelular.

La forma no ionizada del anestésico es la que actúa como vehículo transportador para atravesar la fase lipídica de la membrana neuronal, no obstante, una vez se halla en el interior del canal, la forma ionizada es la causante de la interacción con el receptor y, por lo tanto, de la actividad farmacológica.

FACTORES QUE DETERMINAN LA ACCIÓN DEL ANESTÉSICO LOCAL

La acción del anestésico local se verá condicionada por varios factores:

- El tamaño/tipo de la fibra sobre la que actúa:
- Cantidad de fármaco disponible en el lugar de acción o concentración mínima inhibitoria.
- Características farmacológicas del propio anestésico, de los excipientes y de la forma galénica en la que se vehicula.
- La frecuencia del impulso: la repetición del impulso y por tanto la mayor actividad del canal de sodio en respuesta al cambio de potencial facilita que el fármaco alcance más rápidamente el lugar específico de acción.

CLASIFICACIÓN

Los anestésicos tópicos se pueden clasificar en: aminoamidas y aminoésteres.

AMINOAMIDAS

En este subgrupo se encuentran:

- Lidocaína: derivado del ácido acético, considerado el prototipo de anestésico de duración corta. Se utiliza a dosis que varían según la respuesta del paciente y el lugar de administración, en iniltración local y en el bloqueo nervioso. Tiene una duración de la acción intermedia. Su utilización tópica está muy extendida para tratar el picor y el dolor asociado a heridas, quemaduras, picaduras, hemorroides
- Prilocaína: anestésico derivado del ácido propiónico utilizado en cirugía ambulatoria por su corta acción y rápida recuperación. Su mezcla eutéctica con

lidocaína proporciona una anestesia local efectiva sobre piel intacta muy recurrida en pediatría dermatológica.

- Mepivacaína: se utiliza tanto con fines terapéuticos como diagnósticos, en anestesia local por infiltración, bloqueo nervioso central y periférico, anestesia endovenosa regional y anestesia epidural y caudal.
- Bupivacaína: anestésico local de larga duración indicado en anestesia subaracnoidea para efectuar intervenciones en extremidades inferiores, perineo, abdomen inferior; parto vaginal normal y cesárea y cirugía reconstructiva de las extremidades inferiores.
- Levobupivacaína y ropivacaína: anestésicos de última generación, comercializados en su forma enantiomérica pura (S) con la finalidad de mejorar el perfil de seguridad de este tipo de fármacos (menor cardiotoxicidad y efectos adversos a nivel sistema nervioso central).
- Articaína: anestésico de alta intensidad y corta duración, caracterizado por poseer un grupo éster adicional en su molécula que lo hace susceptible de ser metabolizado por las colinesterasas plasmáticas originando un metabolito inactivo.

AMINOÉSTERES

En este grupo (cocaína, benzocaína, procaína, tetracaína, 2-cloroprocaína):

- Cocaína: puede decirse que fue el primer anestésico local de la medicina moderna, utilizado en técnicas oftalmológicas y odontológicas.

- Benzocaína: se utiliza tópicamente sobre mucosas o para aliviar afecciones bucofaríngeas y dolores osteomusculares. Presenta una baja potencia y una pobre absorción, por lo cual su uso se limita al tratamiento de afecciones menores.
- Procaína o novocaína: presentan una alta efectividad y baja toxicidad, sin embargo, aunque su acción es rápida, la duración de la acción es corta, la cual puede incrementarse si se combina con un vasoconstrictor.
- Tetracaína: se administra generalmente como anestésico tópico en piel y mucosas y también se utiliza en oftalmología y como coadyuvante en preparados lubricantes urológicos.

REFERENCIAS BIBLIOGRÁFICAS

- Brunton, L., Hilal, R., & Knollmann, B. Las Bases Farmacológicas de la Terapéutica (13a Edición. ed.). Mexico: Mc Graw Hill.