

ANESTESICOS LOCALES DEL GRUPO AMIDA

De La Cruz Mamani Lita Noemí¹

RESUMEN

Desde la prehistoria se ha deseado eliminar la sensación de dolor, especialmente en procedimientos quirúrgicos cortos y la oportunidad de lograrlo se presentó tras el descubrimiento de los anestésicos locales, los que a su vez se clasifican en dos grupos: los del grupo éster y los del grupo amida, cada uno de los cuales, presentan ciertas similitudes, al igual que ciertas diferencias que los caracterizan. Sin embargo, los anestésicos del grupo amida han logrado revolucionar el campo de los anestésicos locales, mejorando las propiedades clínicas y disminuyendo los efectos adversos que los anestésicos del grupo éster provocaban en el metabolismo del ser humano, es por ello, que los del grupo amida se han convertido en uno de los más utilizados a la hora de realizar los procedimientos quirúrgicos.

A la fecha, se han desarrollado diferentes tipos de anestésicos locales del tipo amida como ser la: prilocaína, mepivacaína, bupivacaína, oxetacaína, etidocaína, ropivacaína y levobupicaína; cada uno con sus indicaciones, limitaciones, formas de presentación y efectos que su uso produce en el metabolismo del ser humano, por lo tanto, es obligación de todo profesional en salud conocer sus características para determinar una selección adecuada del anestésico local a utilizar.

PALABRAS CLAVE

Anestésicos locales grupo amida.
Lidocaína. Mepivacaína. Bupivacaína.

INTRODUCCION

En la búsqueda de bloquear la sensación de dolor en áreas específicas del cuerpo, de forma temporal y reversible se introdujeron los anestésicos locales en 1880, siendo la cocaína el primer anestésico observado por Carl Koller en 1884.¹ Años más tarde, se sintetizó la procaína gracias a Einhorn, no obstante, se continuó investigando en busca de minimizar los efectos adversos que provocaba la procaína en el cuerpo, como las alergias y su limitado tiempo de anestesia, por lo que se introdujeron los anestésicos locales del tipo amida en 1943, tras ser sintetizada la lidocaína por Nils Löfgren y Bengt Lundqvist.^{1,2,8}

El descubrimiento de la lidocaína, se basó en la estructura química que presentan los anestésicos locales, que consiste en una: porción lipófila que tiene un tipo de unión con la cadena intermedia o pivote alifático de tipo éster, a partir del cual, se desarrolla la unión de tipo amida y una porción hidrófila.^{1,3-6}

Hasta la fecha se han desarrollado a partir de la estructura química de la lidocaína varios tipos de anestésicos, entre ellos están la: prilocaína, mepivacaína, bupivacaína, oxetacaína, etidocaína, ropivacaína y levobupicaína, con propiedades y diferencias particulares.^{1,4} Aun ahora las tendencias de desarrollo en farmacología intentan introducir al mercado, anestésicos con efecto morfínico, mejorando de este modo las acciones de los anestésicos del grupo amida.¹

¹ Univ. Tercer Año Facultad de Odontología UMSA

**TABLA COMPARATIVA ENTRE
GRUPO AMIDA Y ESTER**

	Grupo amida	Grupo éster
Estructura química	Enlace (-COO-)	Enlace (-NHCO-)
FARMACOCINÉTICA		
Distribución	Amplia	Limitada
Vida Media	2 horas	< 30 min
Potencia de acción	+++	+
Metabolismo	Microsomas hepáticos (Hígado), pulmón.	Enzima Pseudocolinesterasaplasmática (plasma).
Excreción	Vía renal con eliminación en menor porcentaje de anestésico puro.	Vía renal con eliminación en mayor porcentaje de anestésico puro.
FARMACODINAMIA		
Mecanismo de acción	Bloqueo de los canales de sodio y propagación de potenciales de acción.	Bloqueo de los canales de sodio y propagación de potenciales de acción.
Periodo de latencia	De acción rápida e intermedia.	De acción lenta e intermedia.
Duración de acción	Menos de 1 hora excepto la tetracaína 3 horas.	Desde 1 a mas de 3 horas.
Modo de acción	Fibras de conducción dolorosa, fibras de sensibilidad térmica, fibras propioceptivas y fibras motoras	
EFECTOS ADVERSOS		
Toxicidad	+++	++
Reacciones Alérgicas	A veces (metilparabeno)	Con mucha frecuencia (paraminobenceno)
EFECTOS GENERALES		
Sistema Nervioso Central	Somnolencia, confusión, temblores, agitaciones, convulsiones, etc.	Somnolencia, vomito, etc. En caso de la cocaína depresión de zonas corticales y subcorticales.
Aparato cardiovascular	Depresión miocárdica, descenso aurículo-ventricular, paro cardiaco	de la presión arterial, bloqueo
Sistema nervioso autónomo y placa motora	Impiden liberación de acetilcolina. Bloqueo de receptores nicotínicos, serotónicos, muscarínicos e histamínicos.	Bloqueo de receptores nicotínicos, serotónicos, muscarínicos e histamínicos.
Aparato respiratorio	depresora e hipotensora a dosis altas	Depresión respiratoria a dosis medianas
Indicaciones	En tratamiento con beta bloqueantes adrenergéticos	En caso de enfermedades hepáticas, embarazo.
Contraindicados	Insuficiencia hepática Ancianos Insuficiencia renal Glomérulo nefritis Alteraciones miocárdicas	Procedimientos quirúrgicos de larga duración Alérgicos al PABA(ácido para amino benzoico) En caso de tratamiento con sulfamidas

Fuente:Elaboración propia ^{1, 2, 3, 5, 6, 7,9,10.}

ANESTESICOS DEL GRUPO AMIDA

Dentro de los anestésicos del tipo amino-amida se encuentra la:

- Lidocaína:** Es un anestésico del grupo amida, el primero en sintetizarse en 1946, conocida comercialmente con el nombre de lignocaína o xilocaína.^{3, 5,10} Puede ser utilizada como una base o clorhidrato

para producir el efecto de analgesia. En la actualidad, es uno de los anestésicos más empleados en la odontología, por el tipo de anestesia prolongada, profunda y de gran potencia que posee.

Presenta un pK de 7.8 que le permite penetrar en la mucosa de forma más efectiva, por lo que el inicio de su acción es rápida y el tiempo de duración de acción es de 1-3 horas.^{5,6} Asimismo, el metabolismo de este fármaco es hepático por un proceso de desalquilación que lo fragmenta en monoetilglicina y la xilidida, siendo este último el que origina la anestesia local y la toxicidad.⁶ El tipo de absorción es levemente más rápida por vía parenteral y su acción es más rápida y larga cuando se asocia a un vasoconstrictor como la epinefrina, ya que incrementa su velocidad de absorción y disminuye su toxicidad.⁷ La vida media en el torrente sanguíneo es de 1.6 horas y su eliminación es por vía urinaria, donde un 10 al 20 % de lidocaína se excreta intacta por la orina.^{9,10}

La lidocaína es considerada también un agente antiarrítmico y antifibrilante, ya que es capaz de acortar la duración del potencial de acción de las fibras nerviosas de Purkinje, disminuyendo la frecuencia auricular y de ésta manera, convertir estas arritmias a ritmo sinusal.^{1,6} Presenta también propiedades convulsivantes y de analgesia general, cuando se presentan en dosis elevadas en el cuerpo, y con el uso de bloqueantes neuromusculares tiende a potenciar la acción de los mismos.^{1,5, 9}

Dentro de los *efectos secundarios*, la somnolencia es la más común en el uso de este tipo de anestésico, así como la caída de la presión arterial, y

reacciones alérgicas que no son comunes tras su uso como anestésico.^{1, 2, 5, 9}

En dosis medianas tiene una acción estimulante caracterizada por náuseas, vómitos, confusión, temblores y convulsiones. Su sobredosis puede provocar decaimiento, inconciencia y finalizar con un paro respiratorio.⁵

La lidocaína se presenta en diversas formas: inyectables (0.51%), gel (2%), pomada (5%), aerosol (10%). La concentración adecuada para la anestesia regional intravenosa es de 0.25-0.5%, para la anestesia epidural es de 1-2% y en caso de anestesia espinal al 5% con incorporación de dextrosa al 75%. En la práctica odontológica la dosis es al 2% con adrenalina 1:100000.^{1,6}

2. **Prilocaina:** Es un anestésico local del tipo amida, conocido también con el nombre de Citanest, con propiedades farmacológicas parecidas a la lidocaína.^{6,10} Tiene un pK de 7.9 que le permite tener una acción rápida de alrededor de 2 min, con una duración aproximada de 2-3 horas. Se metaboliza en el hígado como también en el pulmón y es excretado por la vía renal.¹⁰

La prilocaína tiene la propiedad de estabilizar la membrana neuronal a través de la inhibición del flujo de los iones, que se requieren para la iniciación del potencial de acción.¹⁰

Su principal *efecto secundario* es la metahemoglobinemia, por lo cual, su uso ha disminuido progresivamente.^{3, 6} Otro efecto adverso serio es la parestesia de labios y tejidos blandos que duran hasta un año, acompañándose de

trastornos nerviosos y cardiovasculares.

La prilocaína viene en concentraciones del 0.5-1 % para anestesia por infiltración, al 0.5% en caso de anestesia intravenosa y al 1.5-2% para el bloqueo de nervios periféricos. Para la anestesia dental esta disponibles al 4% con adrenalina 1: 200.000. La dosis máxima recomendada es de 400 mg sin vasoconstrictor y 600 mg con vasoconstrictor.¹

3. **Mepivacaina** : Es el segundo anestésico local del grupo amida más utilizado después de la lidocaína y que ha sido comercializado con los siguientes nombres: carbocaína, arestocaína, isocaína y scandicaína.¹⁰ Posee un pK de 7.6, que lo lleva a tener un inicio de acción rápida de 1 a 2 min. Se inactiva en el hígado y es eliminado por vía urinaria en forma pura en un 1- 16% del total del anestésico. Su vida media en el torrente sanguíneo es de 1.9 horas, por lo su duración de acción es de aproximadamente 1.5 – 2 horas.^{5,9}

Dentro de sus propiedades, se encuentra su efecto vasoconstrictor que le otorga un tiempo de duración prolongado, sin el uso de un vasoconstrictor está indicado en pacientes en los que el vasoconstrictor esta contraindicado.¹

Los efectos adversos del uso de éste anestésico se presentan tras la sobredosis que provoca una estimulación, seguida de una depresión del sistema nervioso central.⁵ La mepivacaína viene en soluciones con concentraciones al 3 y 2 % con levonordefrina 1:20.000 UI la cual es la dosis recomendada en tratamientos dentales.¹

4. **Bupivacaina** : Este anestésico es un clorhidrato derivado de la lidocaína, con capacidad de producir analgesia prolongada. Tiene un pK. 8.1, que da lugar a un inicio retardado de 6 -10 min. Su biotransformación es a nivel hepático, con una duración de acción mayor a las 3 horas.^{5, 9,10} Entre sus propiedades se encuentra el alivio al dolor postoperatorio, bloqueos simpáticos y anestesia epidural obstétrica.¹

Su sobredosis produce reacciones toxicas, depresión circulatoria, convulsiones, etc.¹⁰ La Bupivacaína se presenta en concentraciones entre 0.25%, 0.5% y 0.75% para anestesia de tipo infiltrativa, bloqueos nerviosos periféricos y anestesia epidural, caudal y subaracnoidea.^{1,6}

5. **Oxetacaina** : Es un anestésico de tipo amida, con una química de doble amida que lo limita en su uso para la anestesia superficial.⁵ Generalmente es empleado para aliviar el dolor asociado a una úlcera oral, aunque también es utilizado por vía tópica en el tratamiento de las hemorroides. El único inconveniente en su uso es la toxicidad que presenta, ya que es mayor a los demás anestésicos.⁵
6. **Etidocaina** : Es un anestésico local derivado de la lidocaína de acción prolongada, utilizada anteriormente en la anestesia general. Tiene una duración de acción de 2 horas, gracias a su propiedad de vasodilatador, el cual es mayor a la lidocaína y mepivacaína.⁶ Viene en inyectables al 0.5% y al 1.5% para bloqueos nervioso periférico de tipo infiltrativo y la anestesia epidural. No se utiliza en anestesia raquídea.¹ La dosis máxima recomendada es de 300 mg con vasoconstrictor, debido a

que puede producir, hormigueo o entumecimiento de la cara o la boca, disnea, etc.¹

7. **Ropivacaína:** Es un anestésico de tipo amida, que fue sintetizado posterior a la bupivacaína y se caracteriza por presentar la forma de S- enantiómero puro, lo que le permite tener menor toxicidad a nivel cardiovascular y sistema nervioso central, además de mayor bloqueo sensorial que bloqueo motor.¹ Los efectos adversos más frecuentes en su uso es la bradicardia, retención urinaria, náuseas, vómitos, disneas, elevación de la temperatura, etc.⁷

Viene en ampollas de 10 y 20 ml en concentraciones al 0.2%, 0.5%, 0.75% y 1%, siendo utilizada para la analgesia epidural y del plexo braquial.¹

8. **Levobupivacaína:** Es un anestésico que pertenece al grupo amida, que se caracteriza por la larga duración y su parecido a la bupivacaína.

Posee menor toxicidad a nivel cardiovascular y sistema nervioso central en comparación con la bupivacaína. También es utilizado en combinación con opioides para la analgesia epidural en el trabajo de parto.² Se presenta desde soluciones de 0.25%, 0.50% y 0.75%, utilizadas en técnicas de infiltración, bloqueo del plexo braquial, anestesia peribulbar y bloqueo epidural del miembro inferior y abdominal. 1

ELECCION DE ANESTESICOS LOCALES

La selección de un adecuado anestésico va a ser dependiente de varios factores entre ellos: el tiempo requerido para el procedimiento quirúrgico, el lugar de absorción del fármaco, el pH de los

tejidos adyacentes a la zona a anestesiarse, el mecanismo de acción y las vías de excreción del fármaco para evitar complicaciones en caso de que el paciente presente una enfermedad de base o esté en tratamiento con otros medicamentos.⁴ Por ello es importante conocer las características necesarias de cada uno de los anestésicos locales, para un uso correcto y eficaz a la hora de realizar los diferentes procedimientos quirúrgicos.

De ésta manera, los anestésicos están disponibles para cualquiera de los requerimientos del profesional en salud por ejemplo, en caso de una anestesia infiltrativa, el uso de la lidocaína o la bupivacaína es recomendable, pero si es necesaria una anestesia raquídea, la mejor elección es la tetracaína. Por el contrario, si es necesaria la anestesia epidural se suele emplear la lidocaína o la bupivacaína que ofrece mayor tiempo de insensibilidad.^{1,2}

Fármaco	Recomendaciones en uso clínico
Lidocaína	Tópica, infiltración, anestesia regional intravenosa, bloqueo nervioso periférico, anestesia epidural y subaracnoidea.
Prilocaína	Infiltración, anestesia regional intravenosa, bloqueo nervioso periférico, anestesia epidural.
Mepivacaína	Infiltración, bloqueo nervioso periférico, anestesia epidural y subaracnoidea.
Bupivacaína	Infiltración, bloqueo nervioso periférico, anestesia epidural y subaracnoidea.
Etidocaína	Infiltración, bloqueo nervioso periférico, anestesia epidural.
Ropivacaína	Infiltración, bloqueo nervioso periférico, anestesia epidural.
Levobupivacaína	Infiltración, bloqueo nervioso periférico, anestesia epidural y subaracnoidea.

Fuente: Velásquez.; Lorenzo P.; Moreno A.; *Farmacología Básica y Clínica. Fármacos anestésicos locales*

BIBLIOGRAFIA

1. Velásquez.; Lorenzo P.; Moreno A.; Farmacología Básica y Clínica. Fármacos anestésicos locales. 17^{va} edición. España. Editorial Médica Panamericana. 2005:10; 181 – 191.
2. Katzung G. Farmacología básica y clínica. Anestésicos Locales. Cap. 26. 10^{ma} edición. México. Editorial El Manual Moderno S. A. 2007: 425-435.
3. Rang H.P.; Dale M.M.; Ritter J.M.; Moore P. K.; Farmacología. Anestésicos Locales y otros fármacos que afectan a los canales de sodio. 6^{ta} edición. España. Editorial Elsevier S.A. 2008:44; 638-644.
4. Wesley, G.;Graig, B.;Jhonson, A. Farmacología Médica. Farmacología de la anestesia local.Cap. 37. 13^{ra} edición. Madrid- España. Editorial Mosby.1993:397-405.
5. Litter, M. Compendio de Farmacología. Farmacología del sistema nervioso periférico. Anestésicos locales y agentes bloqueantes neuromuscular o curarizantes. 4^{ta} edición. Buenos Aires. Editorial El ateneo.2001: 15;194-200.
6. Goodman A. Las Bases Farmacológicas de la Terapéutica. Anestésicos Locales. 7^{ma} edición. Buenos Aires. Editorial Médica Panamericana. 1987:15; 577 – 596.
7. Tripathi K.D. Farmacología en Odontología Fundamentos. Anestésicos locales. 1^{ra} edición. Madrid-España. Editorial Médica Panamericana. 2008: 25;366 – 378.
8. Smerilli, A.,Sacot, N. Anestésicos Locales: Historia, Acción Farmacológica, Mecanismo de Acción, Estructura Química y Reacciones Adversas. Rev. de la Facultad de Odontología (UBA) [Internet]. 2004;[consulta el 25 de octubre del 2012]; 19 (46). 19-24. Disponible en:<http://www.odontologia.uba.ar/revista/2004vol19num46/docs/desglose/ANESTESICOS.pdf>
9. Tima, M. Anestésicos locales su uso en odontología. Rev. Anónima [Internet]. 2007; [consulta el 26 de octubre del 2012] 18:1-41 .Disponible en: http://www.sibudec.cl/ebook/UDEC_Anestesicos_Locales.pdf
10. Orsini, C. Texto de Apoyo Anestésicos Locales Fisiología, Farmacología, y Clasificación. [Internet].[consulta el 3 de noviembre del 2012] Disponible en:http://odonto11unab.bligoo.cl/media/users/13/682366/files/83139/Texto_de_apoyo_clase_Anest_sicos_Locales.pdf