

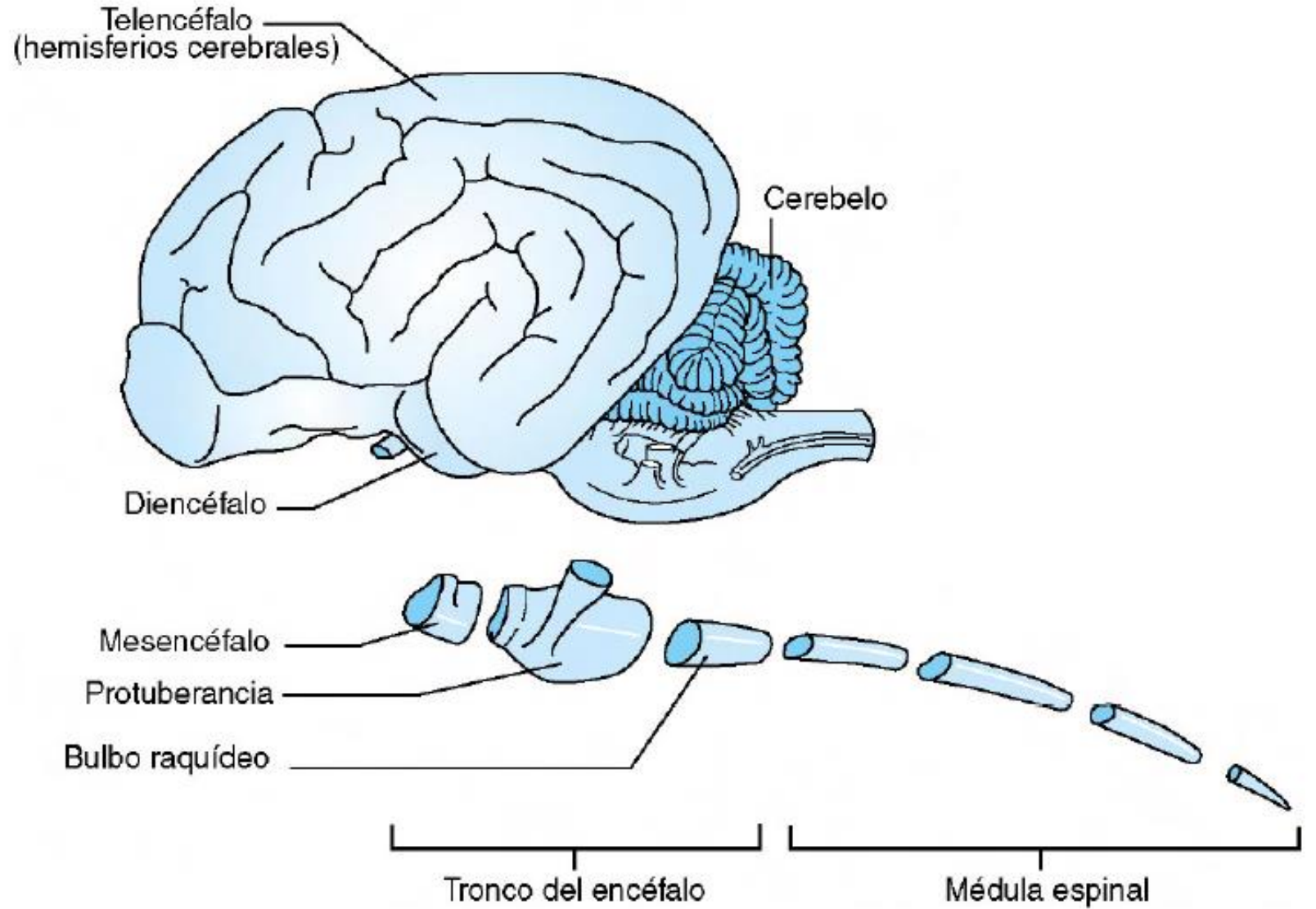
Anestésicos Locales

Victor Mauricio León Serpa, MVZ, Esp Sanidad Animal

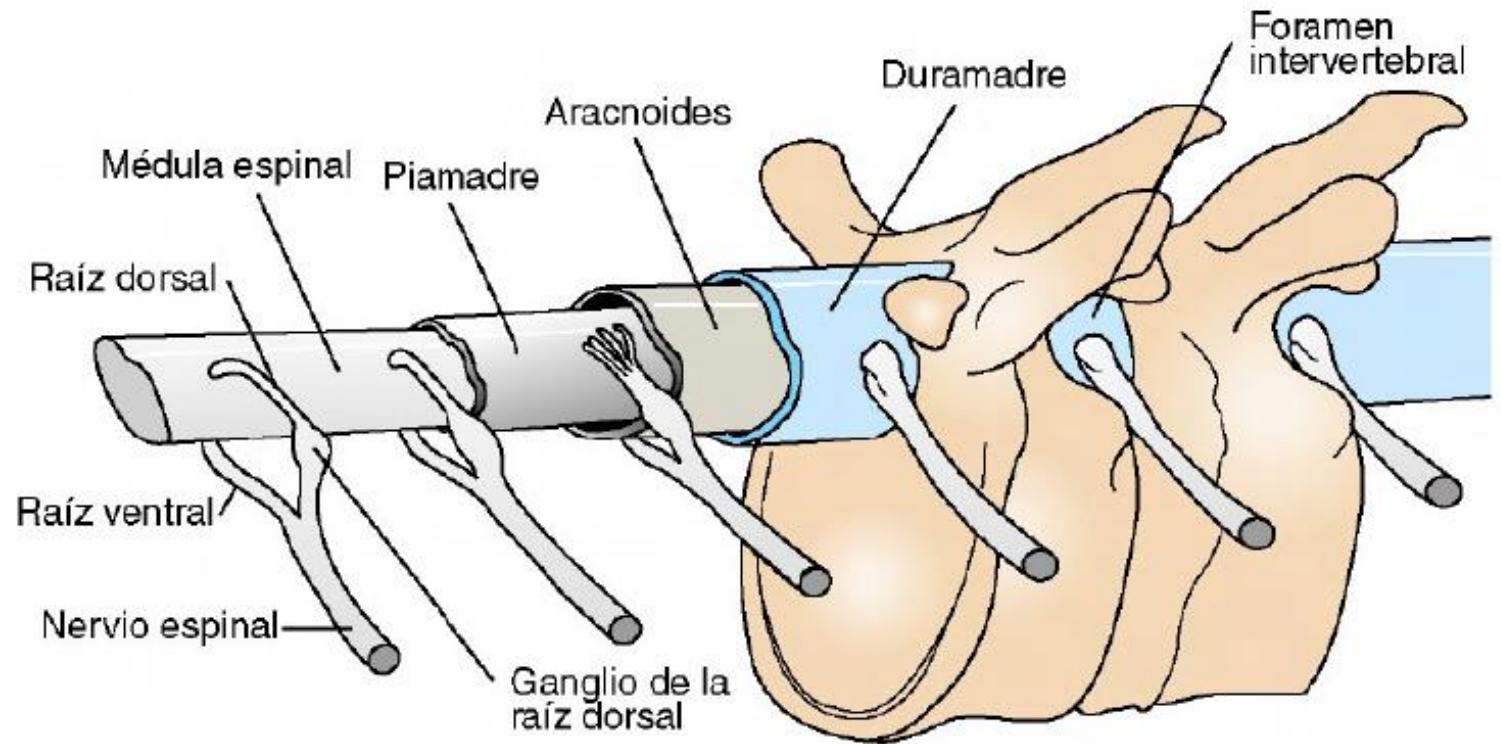
Introducción

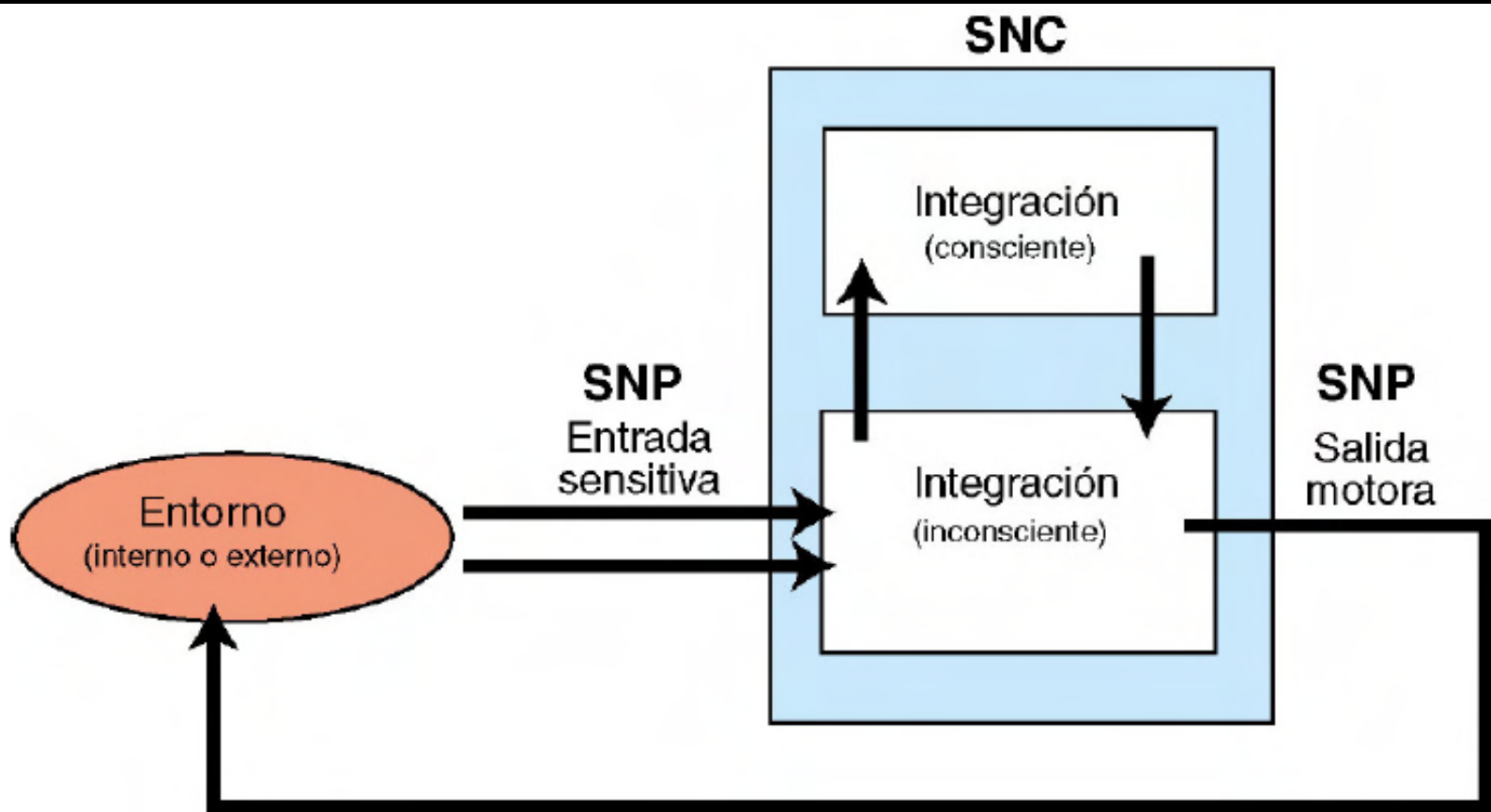
Victor Mauricio León Serpa, MVZ, Esp Sanidad Animal

El SNC puede dividirse en seis regiones principales: la médula espinal, el bulbo raquídeo, la protuberancia, el mesencéfalo, el diencefalo y el telencéfalo (hemisferios cerebrales).



La médula espinal y las tres membranas meníngeas en el interior del canal vertebral. Los potenciales de acción generados sobre los aferentes sensoriales penetran en la médula espinal por medio de los axones de las raíces dorsales. Los generados en eferentes motoras salen de la médula espinal por los axones de las raíces ventrales



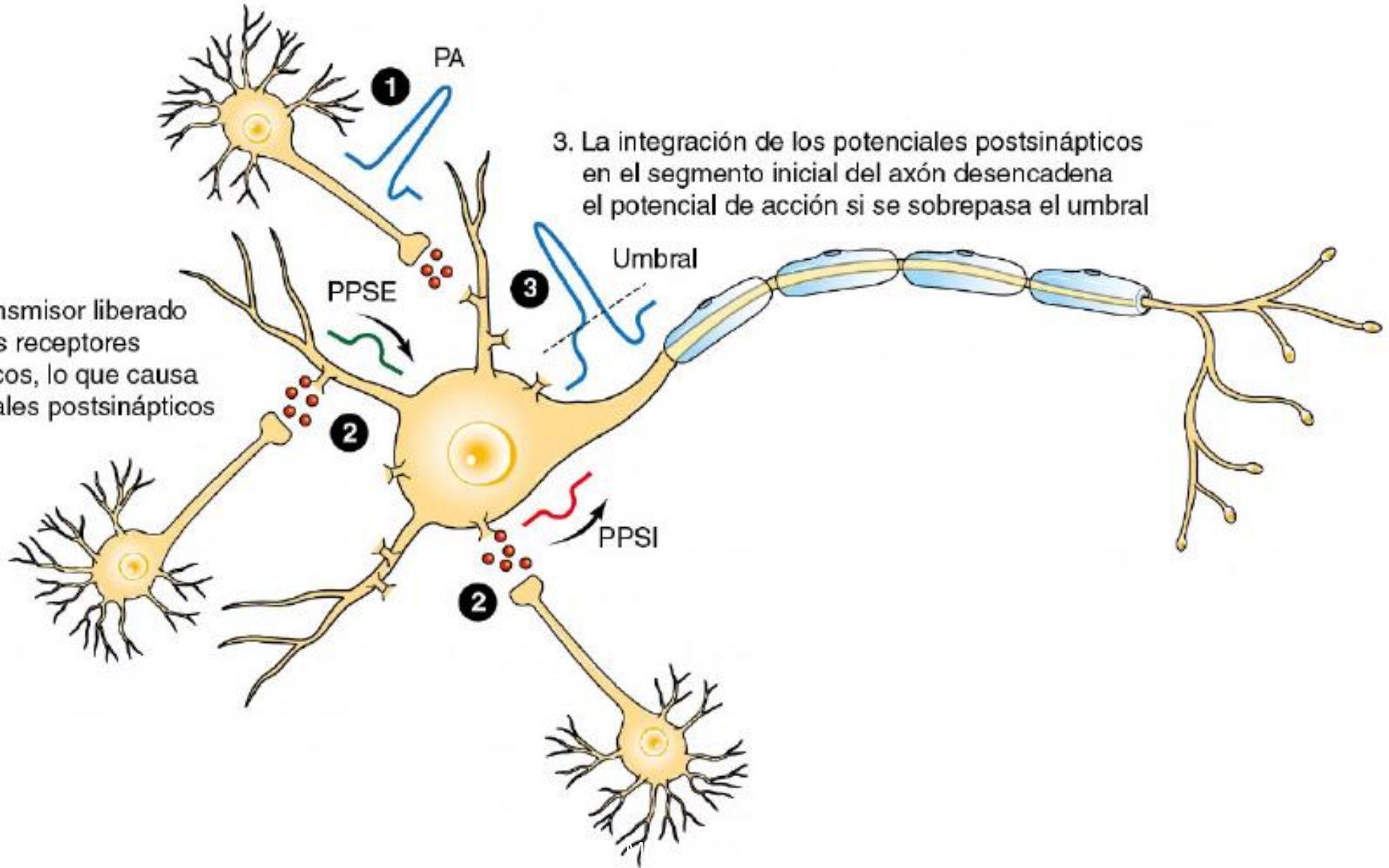


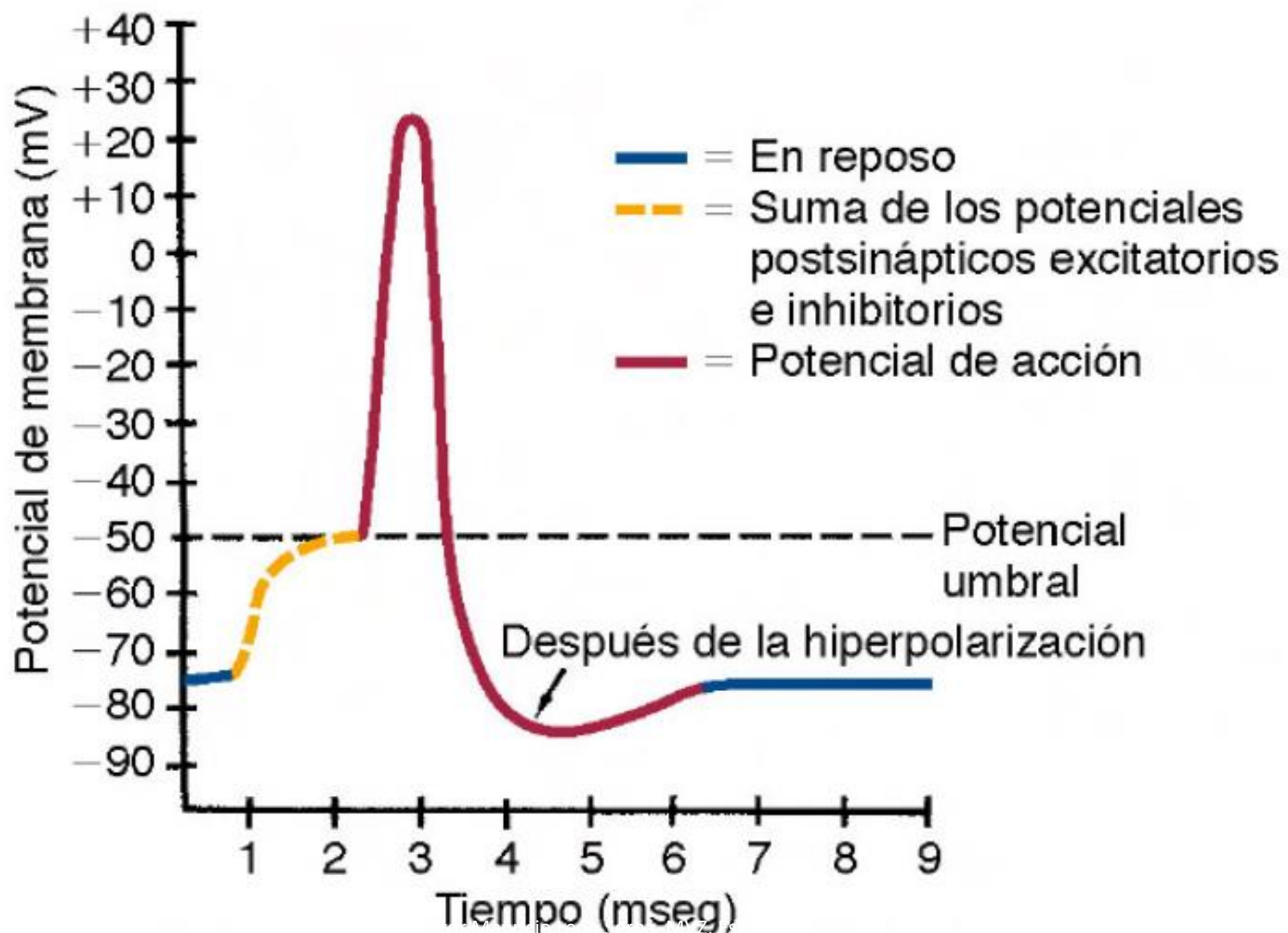
Organización funcional general del sistema nervioso. La información sensorial y la respuesta motora son básicamente responsabilidad del SNP. Uno de los cometidos principales del SNC es la integración.

1. El potencial de acción alcanza el terminal presináptico que lleva a la liberación del neurotransmisor

2. El neurotransmisor liberado se une a los receptores postsinápticos, lo que causa los potenciales postsinápticos

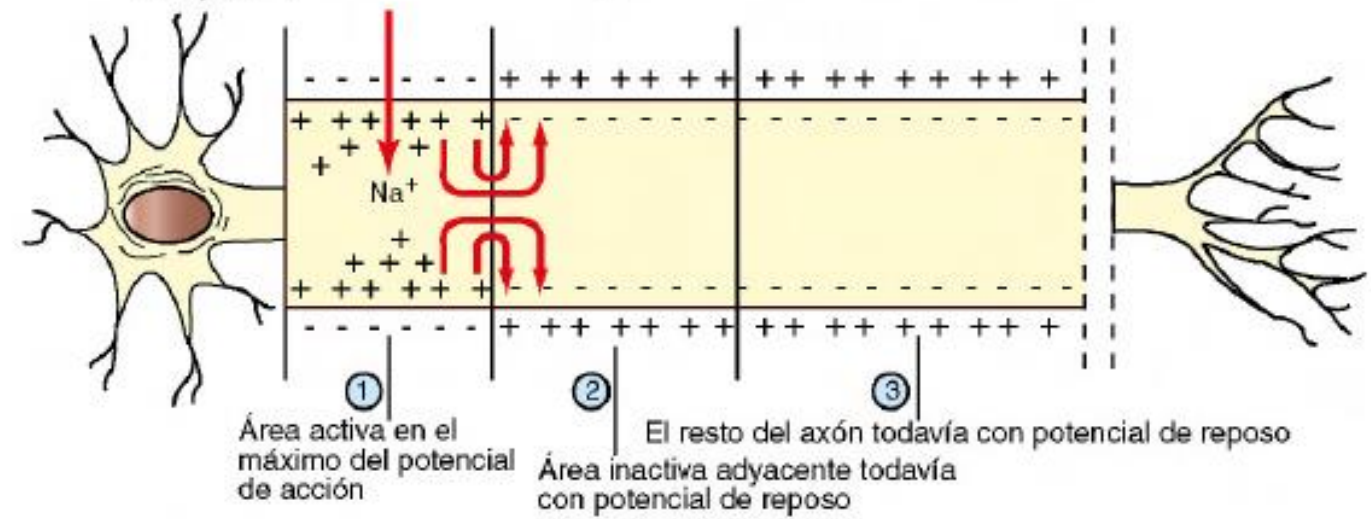
3. La integración de los potenciales postsinápticos en el segmento inicial del axón desencadena el potencial de acción si se sobrepasa el umbral





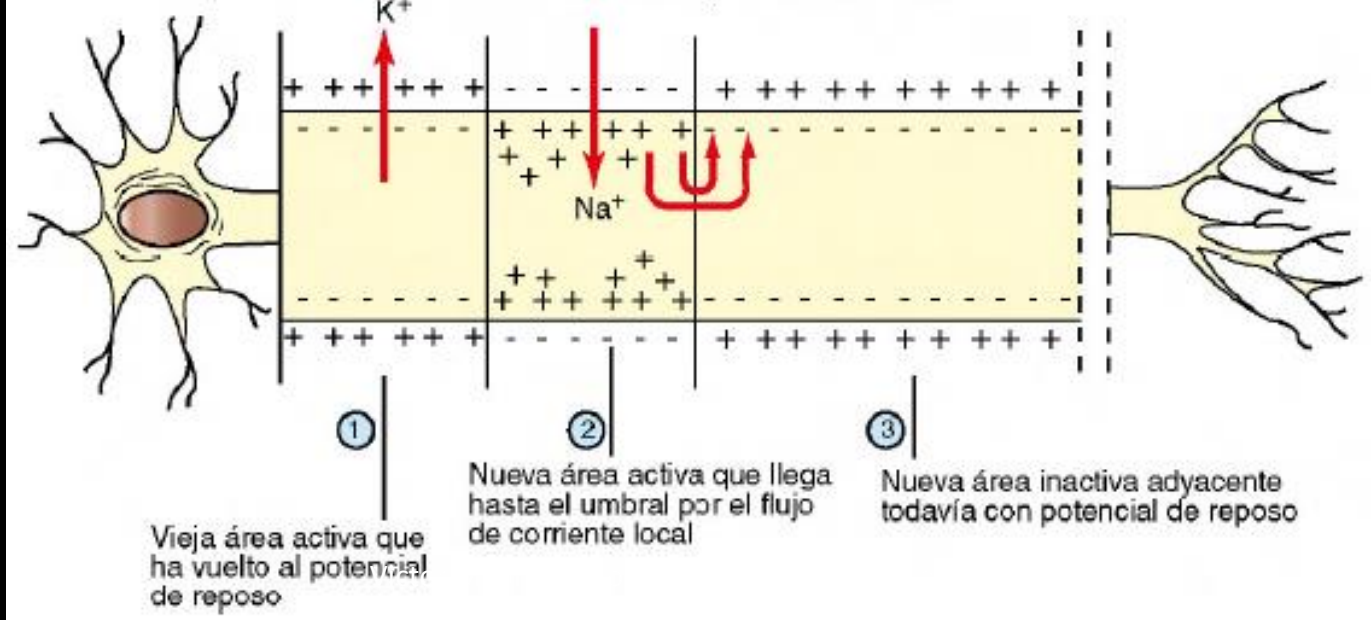
Tiempo 1

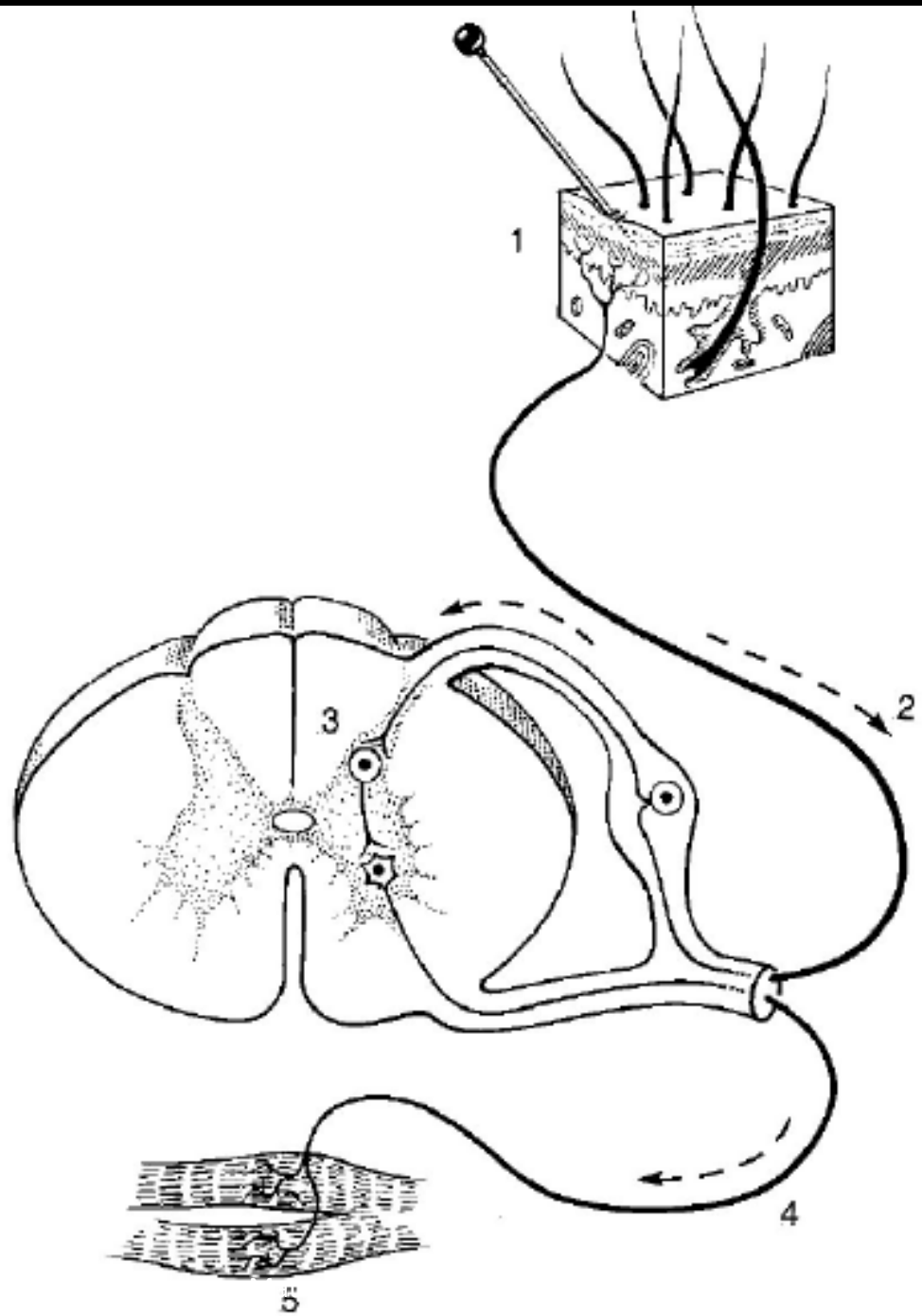
El potencial de acción en la región 1 hace que el exceso de cargas positivas internas migre pasivamente hacia la región 2

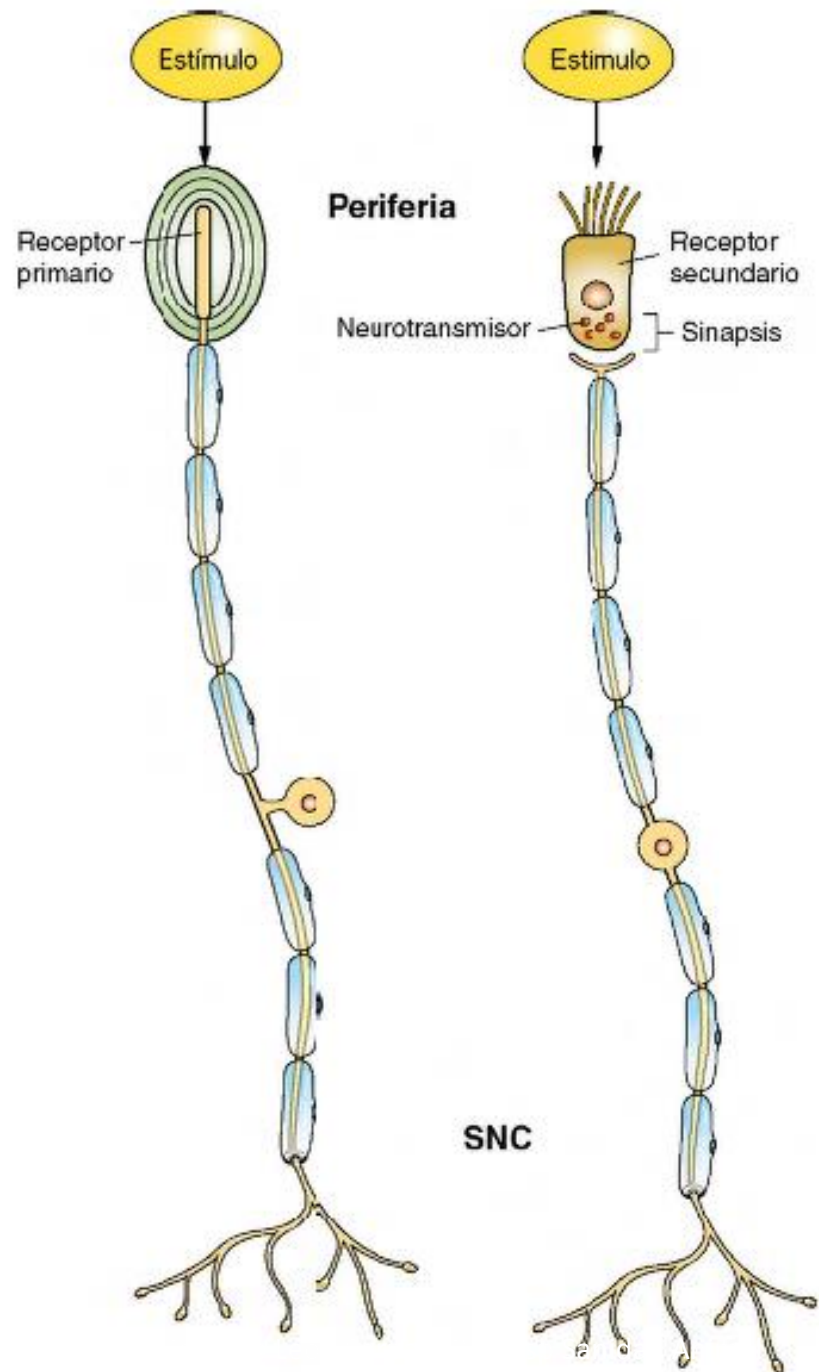


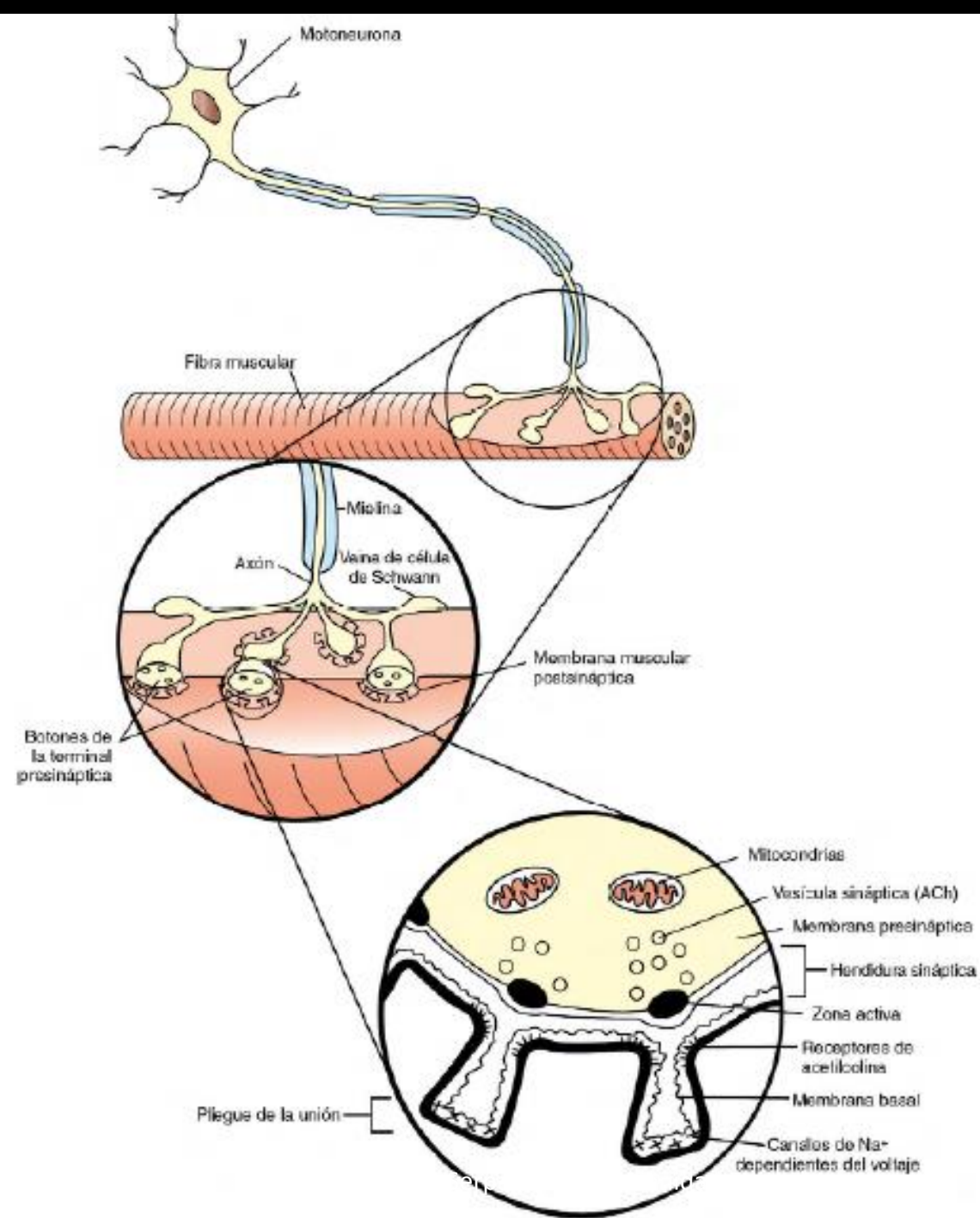
Tiempo 2

El flujo de corriente local desde la región 1 despolariza la región 2 hasta el nivel umbral, desencadenando el potencial de acción









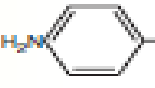

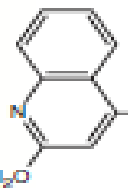
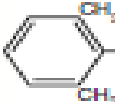

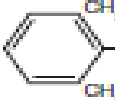

Dinamia de los anestésicos locales

Victor Mauricio León Serpa, MVZ, Esp Sanidad Animal

Química

Las moléculas de anestésicos locales constan de una porción aromática unida por un enlace éster o amida a una cadena lateral básica

Anestésicos locales

Región aromática	Enlace éster o amida	Cadena lateral de amina básica	
	$\text{O}=\text{C}-\text{O}-$	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$	Procaina
	$\text{O}=\text{C}-\text{O}-$	$-\text{C}(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{COOCH}_3$	Cocaína
$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}-$	$\text{O}=\text{C}-\text{O}-$	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$	Tetracaina (amentrocaina)
	$\text{O}=\text{C}-\text{NH}-$	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$	Cincocaina (dibucaína)
	$\text{NH}-\text{C}(=\text{O})-$	$-\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$	Lidocaina (lignocaina)
	$\text{NH}-\text{C}(=\text{O})-$	$-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{NHCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$	Prilocaina
	$\text{NH}-\text{C}(=\text{O})-$	$-\text{CH}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3)\text{N}$ (piperidine ring)	Eupivacaína
	$\text{O}=\text{C}-\text{O}-$	$-\text{CH}_2\text{CH}_3$	Benzocaina

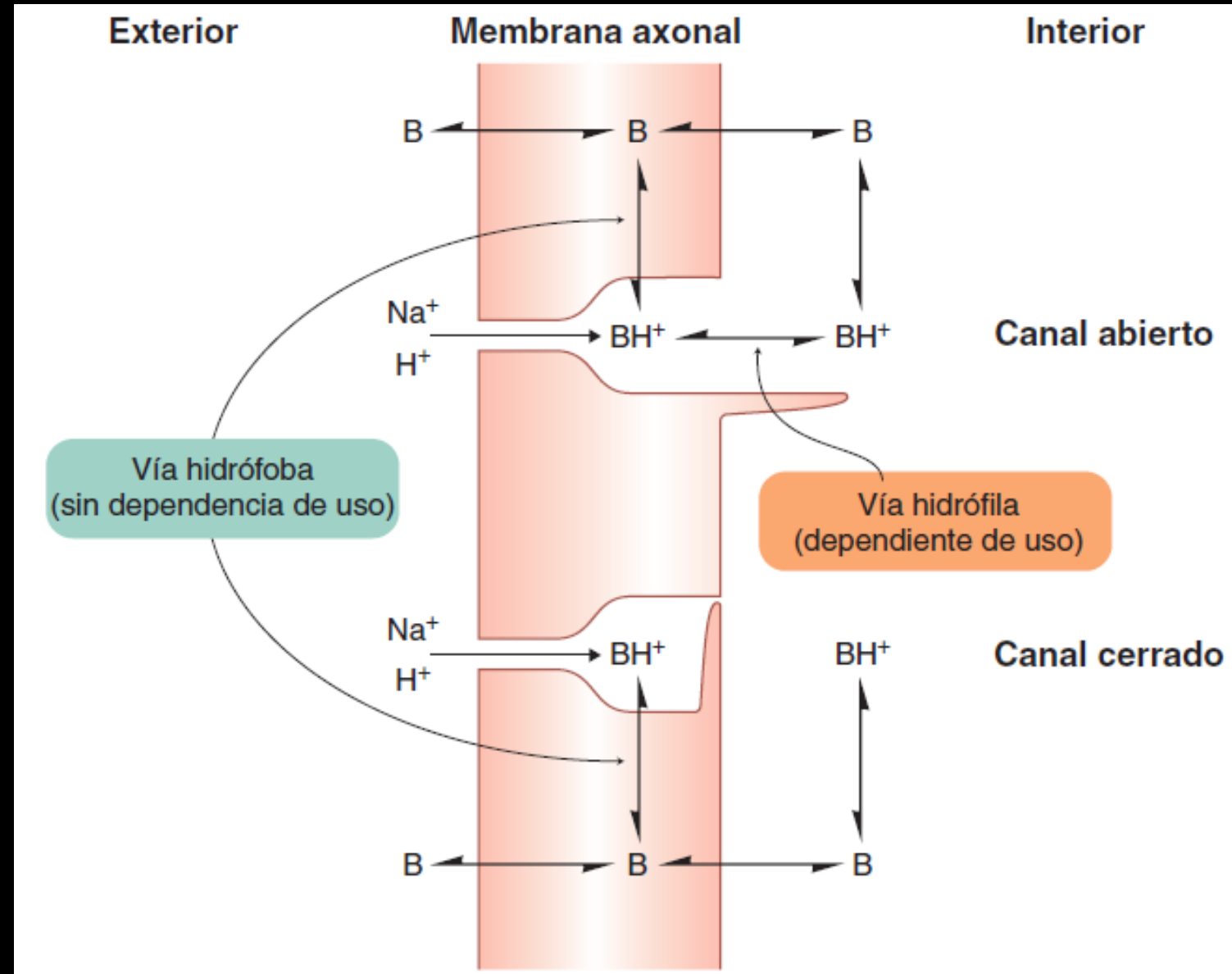
Son bases débiles, con valores de pKa situados en general entre 8 y 9, por lo que a pH fisiológico se encuentran ionizadas.



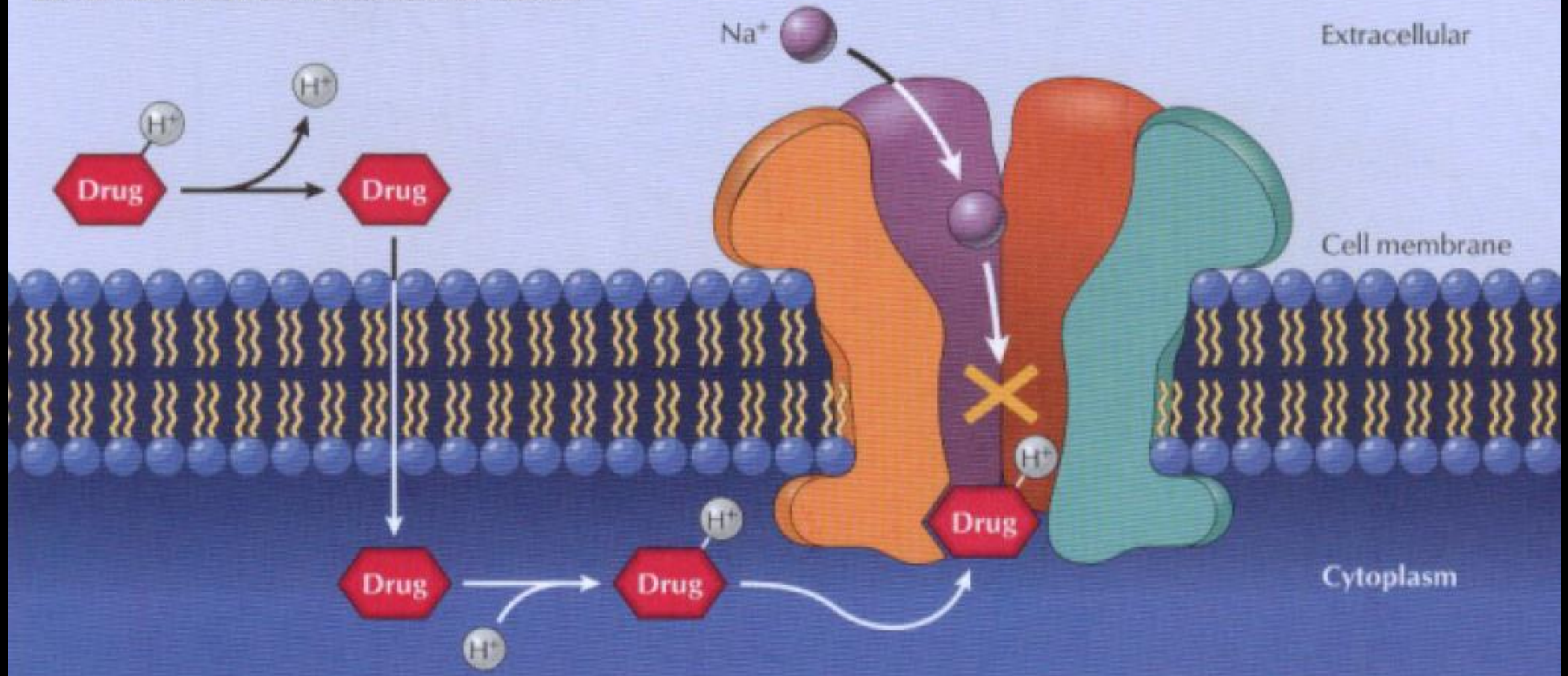
Mecanismo de Acción

La acción de los anestésicos locales tienen la propiedad de bloquear los canales de sodio de una manera «dependiente del uso».

La dependencia de uso significa que, cuanto mayor sea el número de canales abiertos, mayor será el bloqueo



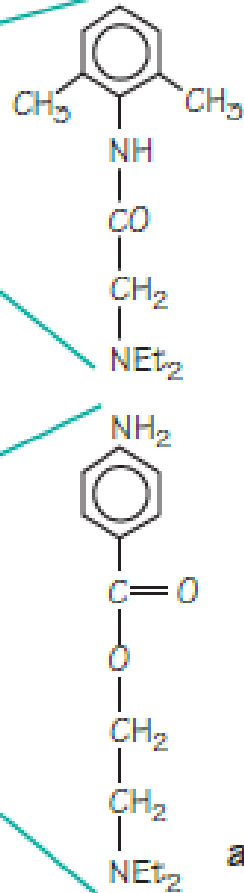
Local Anesthetic Mechanism of Action



Local anaesthetics

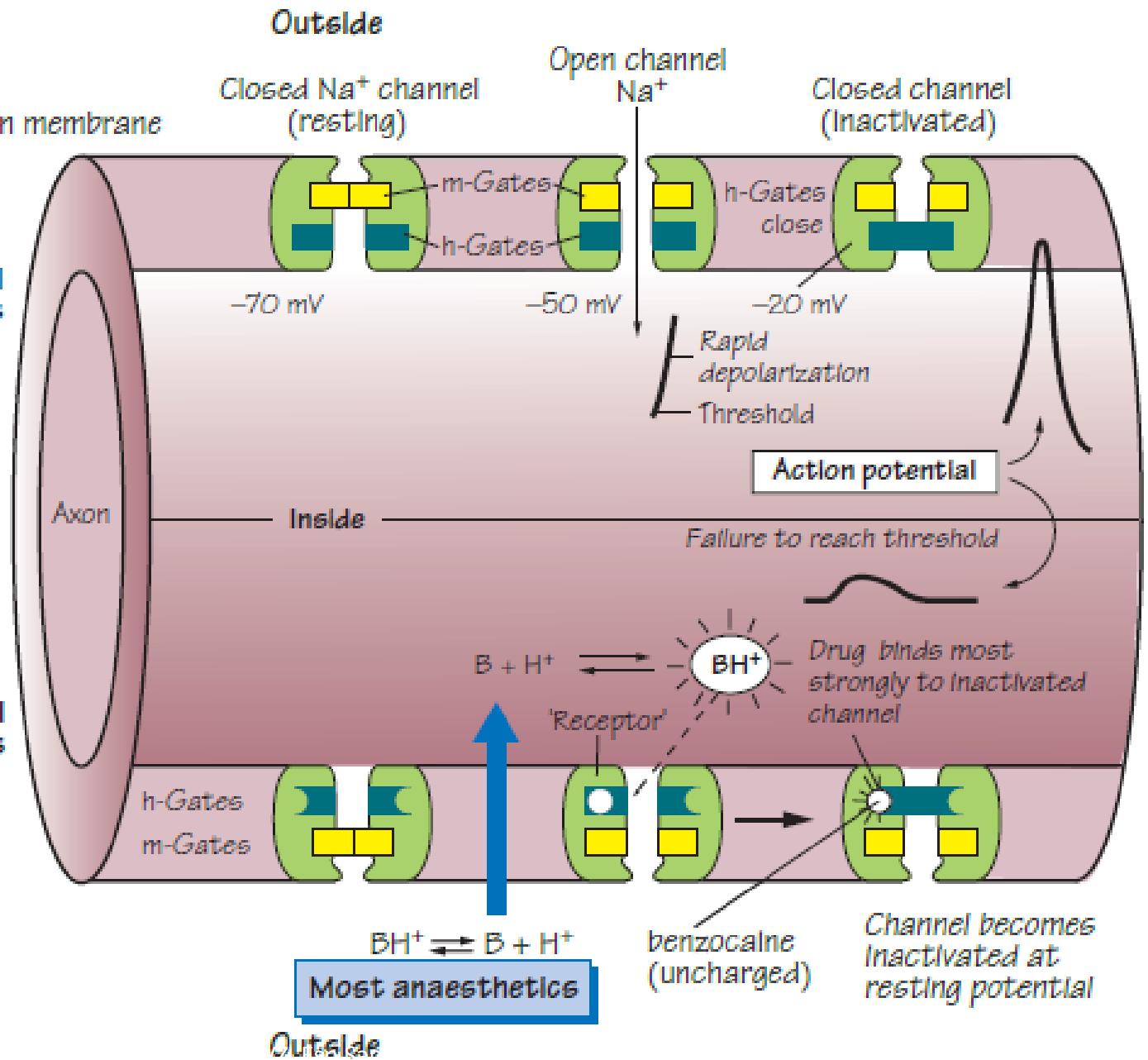
Class	Drug	pK _a
AMIDES	lidocaine	7.9
	prilocaine	7.9
	ropivacaine	
	levobupivacaine	
	bupivacaine	8.1
ESTERS	cocaine	
	benzocaine	
	tetracaine	8.5
	procaine	8.9

Chemistry



Local anaesthetics

Normal events



Cinética de los anestésicos locales

Victor Mauricio León Serpa, MVZ, Esp Sanidad Animal

Consideraciones generales

- Utilizar soluciones y material de inyección estériles.
 - No inyectar en zonas inflamadas.
 - Utilizar agujas no dañadas.
 - Utilizar un calibre de aguja tan pequeño como sea posible.
- Aspirar para detectar la salida de sangre antes de la inyección.
 - Utilizar la concentración eficaz más baja del fármaco anestésico local.
 - Utilizar la cantidad de anestésico local más pequeña que sea posible (considérese el uso de un vasoconstrictor).

Clasificación de los anestésicos locales

GRUPO.	FÁRMACO.	SOLUBILIDAD EN LIPIDOS.	POTENCIA.	pKa	DURACIÓN
Éster.	Procaína.	1	Baja.	8.9	Corta.
	Cloroprocaína.	8	Intermedia.	9.1	Corta.
	Tetracaína.	53	Alta.	8.4	Larga.
Amida.	Lidocaína.	3.7	Intermedia.	7.8	Intermedia.
	Mepivacaina.	1.3	Intermedia.	7.7	Intermedia.
	Bupivacaina.	34	Alta.	8.1	Larga.

Absorción

- Los anestésicos locales se absorben variablemente a partir de:
 - Piel lesionada.
 - Membranas mucosas.
 - Superficies serosas.
 - Epitelio respiratorio.
 - Depósito intramuscular.
 - Depósito subcutáneo.
 - Administración intravenosa.
- El pKa se correlaciona con la velocidad de perfusión en el tejido.

Distribución

- La unión a proteínas se correlaciona con el tiempo del efecto anestésico. Ya que de esta forma se unirá un mayor tiempo a las proteínas de los canales de sodio.
- La epinefrina es adicionada con algunos anestésicos locales (por ejemplo, lidocaína) para prolongar la duración del efecto anestésico. La vasoconstricción local inducida por la epinefrina limita la absorción sistémica del fármaco, manteniendo la concentración local.

Metabolismo

- Los anestésicos locales de características éster son hidrolizados por colinesterasas (pseudocolinesterasas) en el plasma, en menor extensión en el hígado.
- Los anestésicos locales de características amida son metabolizados por las enzimas microsomales, principalmente del hígado.

Fármacos usados para alargar la duración de los anestésicos locales

Victor Mauricio León Serpa, MVZ, Esp Sanidad Animal

- Adrenalina (epinefrina) o L - noradrenalina (levarterenol) 1:50000 (mg/50 ml de suero fisiológico) o 1:200000 (1mg/200 ml de suero fisiológico).

Efectos de la vasoconstricción

- Los vasoconstrictores retrasan la absorción, lo que reduce la toxicidad y aumenta el margen de seguridad.
- Los vasoconstrictores incrementan la intensidad y prolongan la actividad anestésica.
- Los vasoconstrictores aumentan el riesgo de arritmias cardíacas y de fibrilación ventricular.

Fármacos usados para acelerar el efecto de los anestésicos locales

Victor Mauricio León Serpa, MVZ, Esp Sanidad Animal

Hialorunidasa

- Incrementa el área de difusión, lo que da lugar a la desensibilización de un área total más amplia.
- Con frecuencia consigue una anestesia rápida.
- Habitualmente acorta el tiempo de anestesia debido al aumento de la absorción, a menos que se utilice un vasoconstrictor.

Anestésicos locales específicos

Victor Mauricio León Serpa, MVZ, Esp Sanidad Animal

Ligados a Esteres

Clorhidrato de procaína (Novocaína®).

- Prototipo de todos los demás anestésicos locales.
- Fármaco estándar para la comparación de los efectos anestésicos.
- Hidrolizado en plasma por la pseudocolinesterasa.

Clorhidrato de clorprocaína (Nesacaína®)

- Toxicidad mínima.
- Buena penetración.
- Hidrolizada por la pseudocolinesterasa.

Ligados a Esteres

Clorhidrato de tetracaína (Pontocaína®)

- Diez quince veces más potente que la procaína.
- Relativamente tóxico.
- Efecto anestésico prolongado.
- Hidrolizado por la pseudocolinesterasa.

Ligados a Aminas

Clorhidrato de lidocaína (Xilocaína ®, Lignocaína ®)

- El fármaco más estable de este grupo: no se descompone por ebullición, ácidos ni álcalis.
- Penetración superior en comparación con la procaína: efectos evidentes en un tercio del tiempo; los efectos persisten una vez y media más ; se extiende por un campo más amplio.
- Lesión tisular o irritación mínimas.
- Ausencia de alergia o hipersensibilidad.
- Efectos sedantes.
- Anti arrítmico.
- Metabolizado en el hígado.

Ligados a Aminas

Clorhidrato de mepivacaína (Carbocaína ®)

- Similar a la lidocaína.
- Ausencia de irritación o lesión tisular.
- Metabolizado en el hígado.

Clorhidrato de dibucaína (Nupercainal ®)

- Veinte veces más potente que la procaína.
- El efecto anestésico es de tres a cinco veces más prolongado.

Ligados a Aminas

Bupivacaína (Marcaína ®)

- Comienzo intermedio.
- Menor potencia del efecto anestésico motor.
- El efecto anestésico dura 4 - 6 horas.
- Metabolizado en el hígado.

Ripovacaína (Noropin ®)

- Similar a la bupivacaína.
- Menos cardiotoxico.

Tabla de anestésicos locales

AGENTE (NOMBRE GENÉRICO)	NOMBRE COMERCIAL	NOMBRE QUÍMICO	RELACIÓN DE POTENCIA (PROCAÍNA = 1)
Procaína	Novocaína.	Éster ácido paraaminobenzoico del dietilaminoetanol	1 : 1
Clorprocaína.	Nesacaína.	Pararmino-2 éster ácido clorobenzoico del B-dietilaminoetanol.	2,4 : 1
Lidocaína.	Xilocaína.	Dietilaminoacetato-2,6 xilidido.	2 : 1
Mepivacaína.	Carbocaína.	Monoclorhidrato de 1-metil-2',6'-pipecoloxilidido.	2,5 : 1
Tetracaína.	Pontocaína.	Parabutlamino benzoildimetilaminoetanol - HCl.	12 : 1
Hexilcaína.	Ciclaína.	1-ciclo-hexamino 2-propilbenzoato.	1-2 : 1
Dibucaína.	Nupercaína.	Ácido a-butil-oxicin-coninico de dietileno-diamida.	20 : 1
Bupivacaína.	Marcaína.	1-butilo-2',6'-pipecoloxilidido- HCl.	8 : 1
Ropivacaína.	Naropina.	S-(-)-1-propil-2', 6'-pipecoloxilidido HCl monohidrato.	8 : 1

Anestésicos tópicos

Victor Mauricio León Serpa, MVZ, Esp Sanidad Animal

Anestésico tópicos utilizados habitualmente

- Butacaína (sulfato de butia).
- Tetracaína (pontocaína).
- Piperocaína (meticaína).
- Propracaína (oftaína).
- Cetacaína (benzocaína).
- Crema EMLA (mezcla de lidocaína y prilocaína).

Métodos de aplicación de anestésicos locales

Victor Mauricio León Serpa, MVZ, Esp Sanidad Animal

Anestesia superficial

- Pulverizada o extendida sobre las mucosas (boca, nariz).
- En gotas en el ojo.
- Mediante infusión en la uretra.
- Inyectada por vía subsinovial (membranas sinoviales).
- Inyectada por vía intrapleural.

Anestesia por infiltración

- Infiltración difusa del área quirúrgica :
 - Tejidos sensibles: piel, troncos nerviosos, vasos sanguíneos, periostio, membranas sinoviales, membranas mucosas que rodean orificios (boca, nariz ano).
 - Tejidos no sensibles: subcutáneo, grasa, músculos, tendones, fascia, hueso, cartílago, peritoneo visceral.
- Técnicas.
 - Ampolla (depósito muy localizado de una pequeña cantidad).
 - Incisiones cutáneas :
 - Extirpación quirúrgica de tumores superficiales.
 - Alineación de huesos fracturados.

Anestesia regional

- Infiltración lineal.
- Infiltración anestésica de campo : contraindicaciones :
 - Fisuras óseas.
 - Fracturas óseas.
- Infiltración anestésica epidural.
- Infiltración anestésica paravertebral.

Otros

- Anestesia intrarticular.
- anestesia subsinovial.
- Anestesia regional intravenosa.
- Refrigeración o anestesia hipotérmica.

Usos terapéuticos

- Anestesia.
 - Anestesia tópica.
 - Anestesia infiltrativa.
 - Bloqueo de nervios periféricos.
 - Anestesia espinal.
 - Anestesia neurolítica.

Usos terapéuticos

- **Control de arritmias.**
- **Facilitación de la anestesia general.** La inyección IV de lidocaína es usada para disminuir la dosis necesaria de tiobarbituratos para inducir la anestesia y prevenir arritmias ventriculares asociadas con el uso de tiobarbituratos en perros.

Efectos adversos

- **SNC. Contracciones de los músculos esqueléticos** son el primer signo de toxicidad, pero las convulsiones tónico-clónicas son inminentes y ofrecen el primer signo clínico.
- **Sistema cardiovascular.** Los signos de toxicidad usualmente ocurren con altas concentraciones plasmáticas y están asociadas a signos del SNC.
 - Prolongación de los intervalos PR y QRS.
 - Hipotensión y caída de la fuerza del miocardio (efecto inotrópico negativo).
- **Metahemoglobinemia.** Puede ocurrir luego del uso de prilocaína o benzocaína en gatos y conejos.

Usos terapéuticos

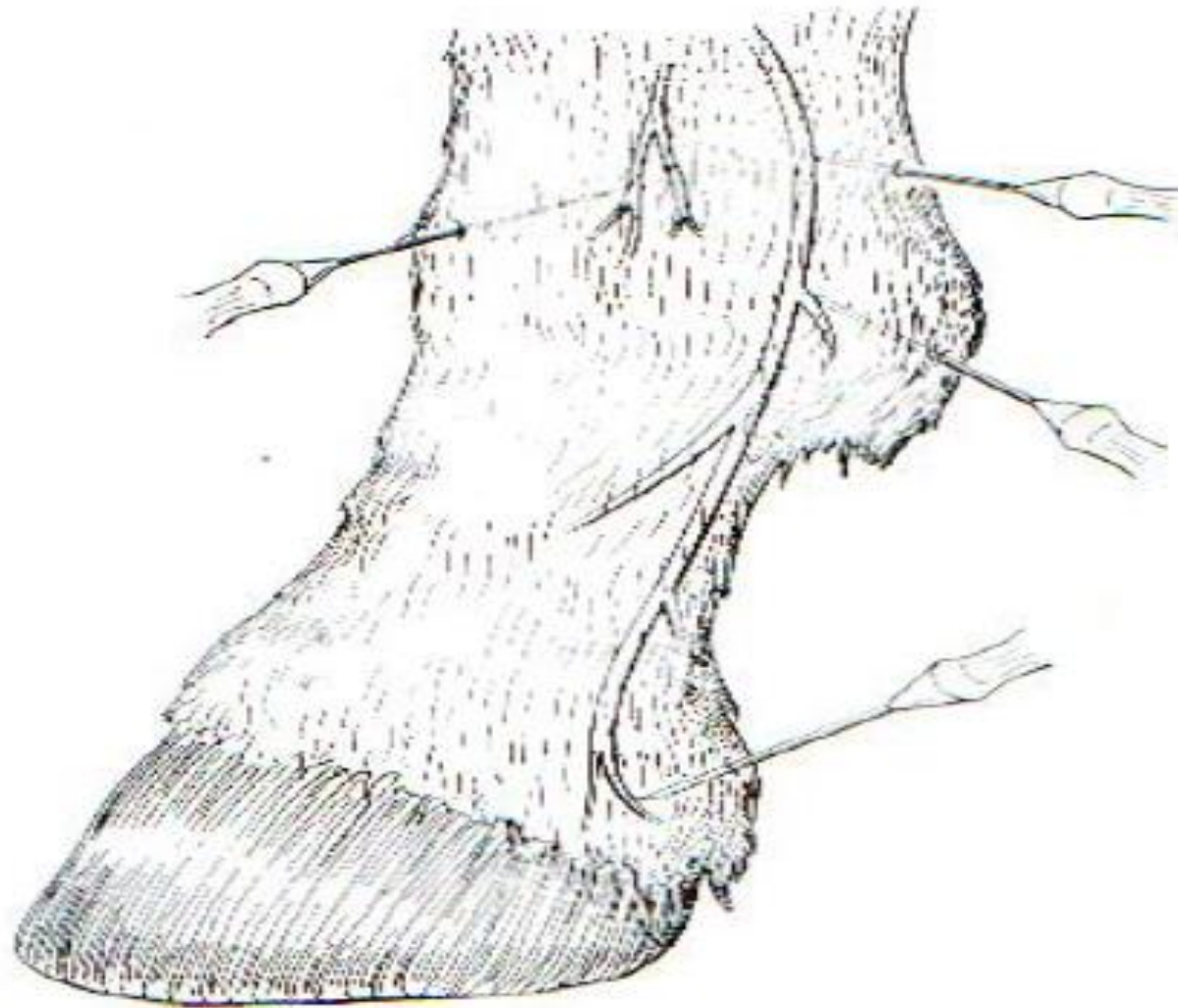
Victor Mauricio León Serpa, MVZ, Esp Sanidad Animal

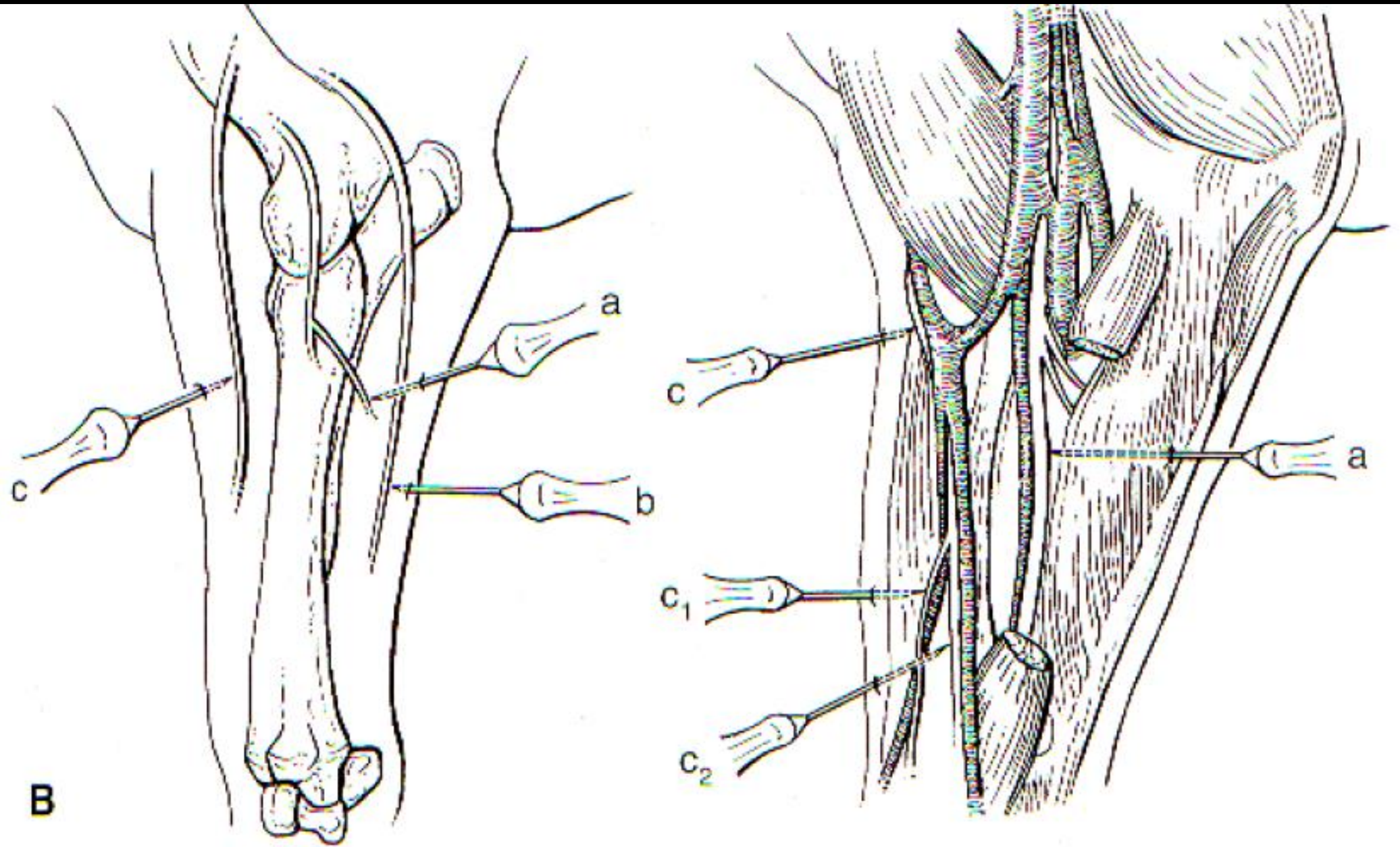
Anestesia

- Anestesia tópica. Se usan para desensibilizar membranas mucosas del ojo, nariz, y laringe.
- Anestesia infiltrativa. Se usan para desensibilizar un área limitada de tejido entumecido.
- Bloqueo de nervios periféricos.
- Anestesia espinal.

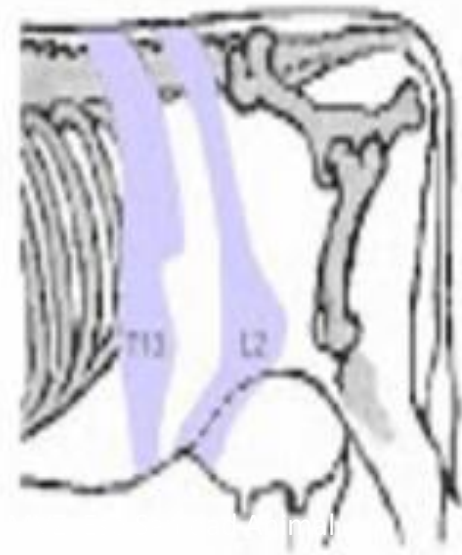
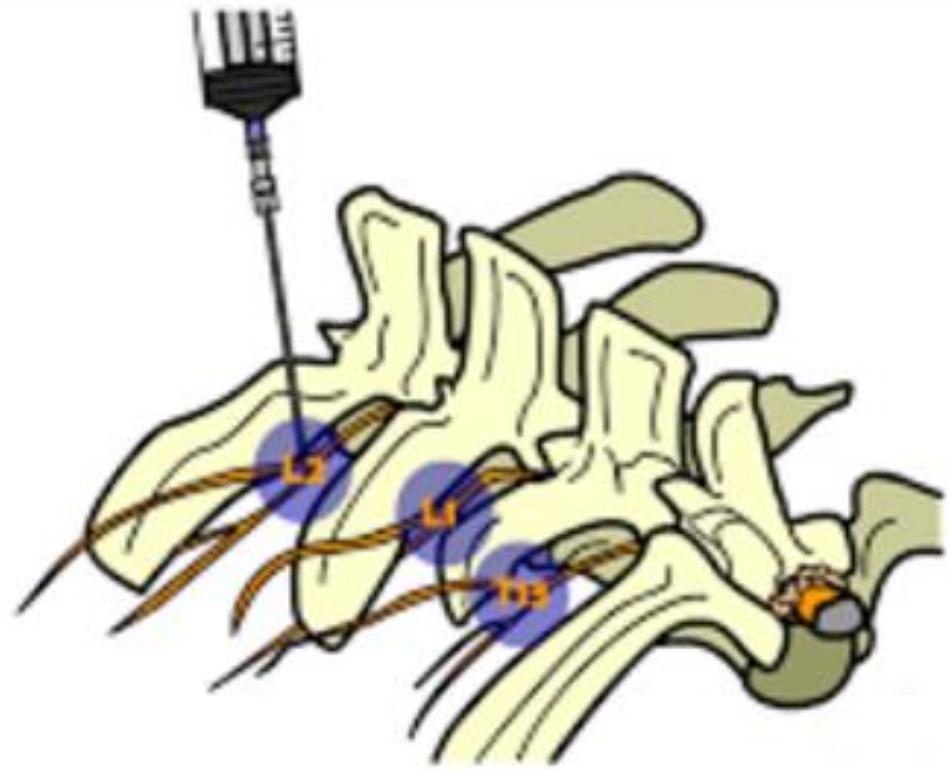
Nervio bloqueado	Anestésico local	Usos
Infraorbitario	Procaína al 2%, 2 ml y Lidocaína al 2%, 2 ml.	Limpieza de sarro, debridación de abscesos, extracción de dientes.
Mandibular	Procaína ó lidocaína al 2%, 3 ml	Limpieza de sarro, debridación de abscesos, extirpación de dientes en la mandíbula inferior.
Palpebral	1 ml de procaína ó Lidocaína al 2%.	Corrección de laceraciones, verrugas, extirpación de dientes en la mandíbula inferior.
Plexobraquial	Lidocaína al 2%, 10ml	Luxaciones, fracturas, lesiones similares localizadas por debajo de la articulación del codo.
Safeno, peroneal, tibial y ciático	Lidocaína al 2%, 7 a 8 ml.	Tendinitis, diagnostico de cojeras, encañamiento de heridas, etc.
Cornual	Lidocaína al 2%, 5ml.	Descornes.

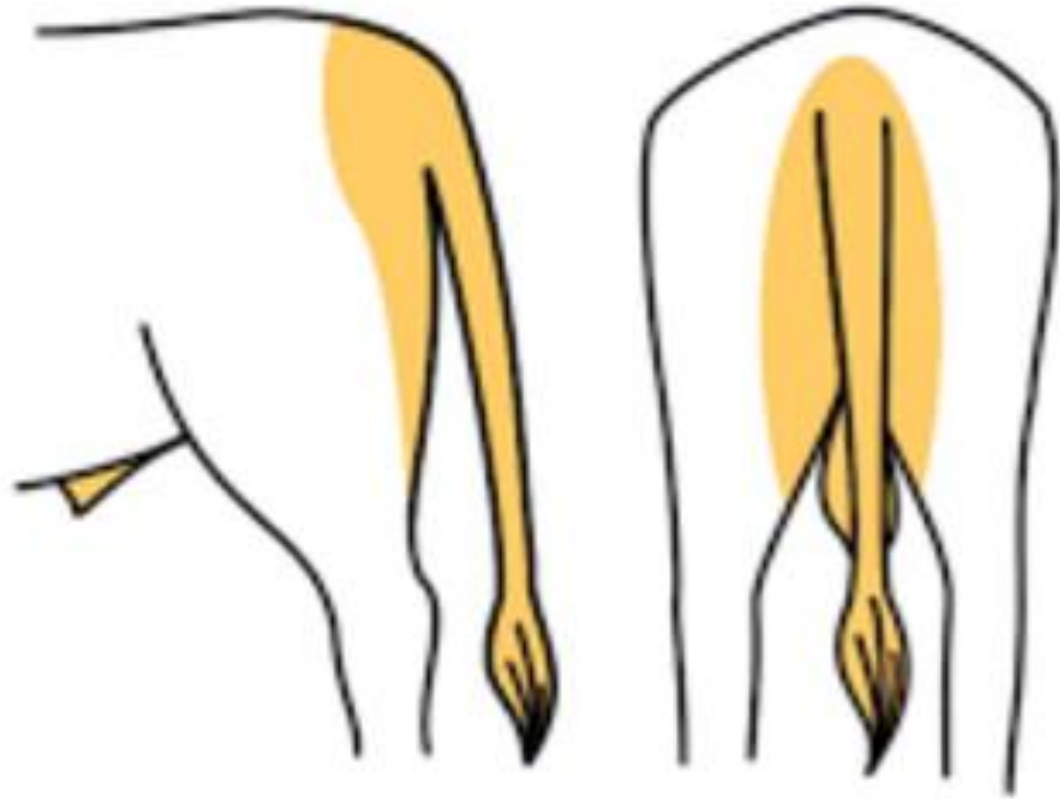
Anestesia perineural





Anestesia de los nervios mediano, cubital y antebraquial cutáneo medial





Arritmias cardiacas

La lidocaína inyectada IV es usada para controlar las contracciones ventriculares prematuras.

Facilitar la anestesia general

La inyección IV de lidocaína es usada para disminuir la dosis necesaria de tiobarbituratos para inducir la anestesia y prevenir arritmias ventriculares asociadas con el uso de tiobarbituratos en perros.

La inyección alternada de lidocaína y tiopental es útil para la inserción del tubo endotraqueal, y para que la anestesia inhalada continúe.

Efectos adversos

Victor Mauricio León Serpa, MVZ, Esp Sanidad Animal

SNC

Contracciones de los músculos esqueléticos son el primer signo de toxicidad, pero las convulsiones tónico-clónicas son inminentes y ofrecen el primer signo clínico.

Sistema cardiovascular

- Las concentraciones plasmáticas altas de lidocaína producen toxicidad cardiovascular presentándose menos en gatos que en otras especies.
 - Prolongación de los intervalos PR y QRS.
 - Hipotensión y caída de la fuerza del miocardio (efecto inotrópico negativo).

Metahemoglobinemia

- Puede ocurrir luego del uso de prilocaína o benzocaína en gatos y conejos.