

FICHAS DE INFORMACIÓN TÉCNICA

BUPIVACAÍNA CLORHIDRATO

- Formula Molecular:** $C_{18}H_{28}N_2O \cdot HCl \cdot H_2O$
- Peso Molecular:** 342,91
- Datos Físico-Químicos:** Polvo cristalino blanco o casi blanco o cristales incoloros. Soluble en agua y fácilmente soluble en etanol al 96%. Punto de fusión: 258,5°C.
- Propiedades y usos:** La bupivacaína clorhidrato es un anestésico local de tipo amida. Se trata de una mezcla racémica, pero se utiliza también el isómero S(-)levobupivacaína.
Se une alrededor de un 95% a las proteínas plasmáticas. Las semividas descritas son 1,5 a 5,5 h en adultos y de unas 8 horas en recién nacidos. Se metaboliza en el hígado y se excreta por la orina principalmente como metabolitos con solo el 5-6 % del fármaco sin modificar. La bupivacaína se encuentra en la leche materna en pequeñas cantidades y atraviesa la barrera placentaria, pero la concentración fetal respecto a la maternal es relativamente pequeña. La bupivacaína también se difunde al LCR.
La bupivacaína es más cardiotoxica que otros anestésicos locales. Un paro cardiaco debido a la bupivacaína puede ser resistente a la desfibrilación eléctrica y la recuperación satisfactoria requiere esfuerzos de reanimación prolongados.
Tiene un inicio de acción lento y una duración de acción prolongada.
La rapidez de inicio y la duración de la acción se incrementan con la adicción de un vasoconstrictor, a la vez que disminuye la absorción desde el lugar de inyección.
Se utiliza principalmente para anestesia por infiltración y para bloqueos nerviosos regionales, en particular para el bloqueo epidural.
A las dosis recomendadas la bupivacaína produce un bloqueo sensorial completo, pero la concentración de la solución de bupivacaína utilizada afecta a la extensión del bloqueo motor obtenido. Una solución al 0,25% produce generalmente un bloqueo motor incompleto, una solución al 0,5% produce habitualmente un bloqueo motor y cierta relajación muscular, y el bloqueo motor y la relajación muscular completos se consiguen con una solución al 0,75%.
- Dosificación:**
- Anestesia por infiltración: variable, hasta 150-225 mg.
 - Bloqueo nervioso periférico: 12,5-25 mg.
 - Bloqueo nervioso simpático: 50-125 mg.
 - Bloqueo retrobulbar en cirugía oftalmológica: 15-30 mg.
 - Bloqueo epidural lumbar en cirugía: 25-100 mg.
 - Bloqueo espinal: 10-20 mg.
 - Bloqueo caudal en cirugía: 37,5-150 mg.
 - Inducción del bloqueo epidural lumbar en cirugía no obstétrica: 75-

FICHAS DE INFORMACIÓN TÉCNICA

150 mg.

-Analgesia durante el parto: 15-100 mg.

Efectos secundarios:

La toxicidad sistemática de los anestésicos locales afecta sobre todo al SNC y el sistema cardiovascular. La estimulación de SCN se manifiesta por inquietud, excitabilidad, nerviosismo parestesias, vértigo, acúfenos, visión borrosa, náuseas, vómitos, espasmos musculares, temblores, y convulsiones. El entumecimiento de la lengua y la región perioral y la pérdida de conocimiento, seguidos de sedación, pueden ser signos incipientes de toxicidad sistemática. La excitabilidad, cuando se presenta, puede ser pasajera y seguida de depresión con adormecimiento, insuficiencia respiratoria y coma. Son también posibles los efectos sobre el sistema cardiovascular con insuficiencia miocárdica y vasodilatación periférica que produce hipotensión y bradicardia, a veces se producen arritmias y paro cardíaco. La anestesia espinal, y epidural a menudo se acompañan de hipotensión; la posición incorrecta de la paciente puede ser un factor desencadenante en las mujeres durante el parto.

Las reacciones de hipersensibilidad son poco comunes y generalmente limitadas a anestésicos locales tipo éster. No parece haber reacciones de sensibilidad cruzada entre los anestésicos locales de tipo éster y los de tipo amida. Se han investigado la idiosincrasia de los anestésicos locales. También se han observado reacciones de hipersensibilidad a los conservantes de los preparados farmacéuticos de los anestésicos locales.

Al igual que otros anestésicos locales, puede causar metahemoglobinemia.

La utilización durante el parto, puede producir intoxicación fetal ya sea por difusión transplacentaria, ya sea por inyección accidental al feto.

El uso prolongado en el ojo causa lesiones en la cornea.

Contraindicaciones:

Pacientes con hipersensibilidad conocida a anestésicos locales.

Pacientes con bloqueo auriculoventricular completo.

Técnicas de bloqueo paracervical obstétrico.

Técnicas de anestesia regional intravenosa (bloqueo de Bier).

La solución 0,75% está contraindicada para el bloqueo epidural en obstetría.

Precauciones:

Debe administrarse con cautela en ancianos, personas debilitadas, niños, pacientes epilépticos, con conductividad cardíaca o función respiratoria deficiente, shock o insuficiencia hepática; los pacientes con miastenia grave son particularmente sensibles a los efectos de los anestésicos locales.

Técnicas como el bloqueo epidural o espinal no debe emplearse en pacientes con enfermedades del SNC, shock cardiogénico o hipovolémico, o alteraciones de la coagulación. Dado el riesgo de transmitir infecciones al SCN, estas técnicas no deben aplicarse en zonas de la piel con una infección piógena o en zonas adyacentes. A causa del riesgo de aparición de efectos adversos sistémicos cuando se absorbe con excesiva rapidez, no debe inyectarse o

FICHAS DE INFORMACIÓN TÉCNICA

aplicarse en tejidos inflamados o infectados, ni en zonas de piel lesionada o en mucosas. Por razones similares, la velocidad de inyección no debe ser excesiva y hay que evitar la inyección intravascular involuntaria.

El riesgo de efectos adversos debido a la absorción del anestésico local puede aumentar cuando se añade un vasoconstrictor como la adrenalina, por eso debe utilizar la concentración más baja de éste. Los anestésicos locales utilizados en la boca o la garganta pueden alterar la deglución e incrementar el riesgo de aspiración.

La córnea puede resultar dañada por la aplicación tópica de anestésicos locales durante un tiempo prolongado.

Los anestésicos locales pueden ser ototoxicos y no deben administrarse en el oído medio.

Conviene evitar la aplicación prolongada o extensa de anestésicos locales sobre la piel.

- Interacciones:** Existe un riesgo elevado de depresión miocárdica cuando se administra junto con antiarrítmicos.
- Conservación:** En envases bien cerrados. PROTEGER DE LA LUZ.
- Bibliografía:**
- Martindale, *Guía completa de consulta farmacoterapéutica*, 1ª ed. (2003).
 - *The Merck Index*, 13ª ed. (2001).