

Revisión de los Bloqueantes Neuromusculares

Víctor Llodrà Ortola, Maria Antònia Maestre Fullana.
Servicio de Farmacia. Fundación Hospital Manacor.

BLOQUEANTES NEUROMUSCULARES

Los bloqueantes neuromusculares (BNM) son sustancias capaces de producir parálisis del músculo esquelético actuando en la unión neuromuscular, donde bloquean la transmisión del impulso nervioso y por tanto la contracción.

USOS

En clínica se utilizan como coadyuvantes de la anestesia general para permitir que se realice la intubación endotraqueal y para relajar los músculos esqueléticos durante la cirugía o durante la ventilación controlada. También son utilizados para evitar lesiones en terapia de electroshock y en cuadros convulsivos severos y en las unidades de cuidados intensivos para facilitar la ventilación mecánica.

CLASIFICACIÓN

Los BNM han sido tradicionalmente clasificados por su modo y su duración de acción.

BLOQUEANTES NEUROMUSCULARES DESPOLARIZANTES: Mimetizan la acción de la acetilcolina en la unión neuromuscular. Se unen al receptor de la acetilcolina a nivel postsináptico produciendo una contracción inicial (fasciculaciones en cara, manos y pies). Al contrario que la acetilcolina que es rápidamente hidrolizada por la acetilcolinesterasa, estos fármacos terminan su acción cuando difunden fuera de la placa motora, esto causa una despolarización más prolongada de la placa y del bloqueo neuromuscular. El prototipo de este grupo es la Succinilcolina.

BLOQUEANTES NEUROMUSCULARES NO DESPOLARIZANTES: Compiten con la acetilcolina en los receptores de la placa motora impidiendo su despolarización y la contracción muscular. Dan lugar a una parálisis flácida.

Tabla-1. Clasificación de los bloqueantes neuromusculares según su modo de acción y estructura química.

En la tabla se muestra el inicio, duración de acción y tipo (C: acción corta, I: acción intermedia; L: acción larga).

* no comercializado en España.

MEDICAMENTO	Inicio (minutos)	Duración Acción (minutos)	Tipo
DESPOLARIZANTES Suxametonio (Succinilcolina)	1-1,5	6-8	C
NO DESPOLARIZANTES Benzilisoquinolinas			
Atracurio	2-4	30-40	I
Cisatracurio	4-6	40-60	I
Mivacurio	2-4	12-18	C
Aminoesteroides			
Pancuronio	4-6	120-180	L
Vecuronio	2-4	30-40	I
Rocuronio	1-2	30-40	I
Rapacuronio *	0,9	14	C

“El BNM óptimo debería reunir las siguientes características: ser de inicio rápido, duración intermedia y predecible para su uso en perfusión continua, no presentar efectos cardiovasculares ni en el sistema nervioso autónomo, no ser histaminoliberador y tener un metabolismo órgano-independiente siendo sus metabolitos inactivos”.

A.- BLOQUEANTES NEUROMUSCULARES DE ACCIÓN CORTA:

SUXAMETONIO (SUCCINILCOLINA): BNM de acción ultracorta. Es el único BNM despolarizante usado en clínica. Produce fasciculaciones por despolarización inicial seguidas de parálisis flácida. Sufre una rápida metabolización por la colinesterasa plasmática. Se usa en intubación urgente dado su rápido inicio de acción y su corta duración. Dosis de 1-1,5mg/kg permiten unas condiciones para una intubación óptima en 20-60 seg. Las causas que limitan un uso más amplio en clínica son sus efectos adversos (arritmias cardiacas, mialgia difusa, mioglobinuria en niños, hipertermia maligna, aumento de la presión intraocular, intragástrica, intracraneal e hiperpotasemia que puede ser letal en pacientes con daño neurológico o quemaduras extensas).

B.- BLOQUEANTES NEUROMUSCULARES DE ACCIÓN LARGA:

PANCURONIO: BNM de acción potente. Su dosis de intubación es 0,06mg/kg y su inicio de acción comienza a los 2-3 min con bloqueo máximo a los 4 min. Es metabolizado en hígado (40%) dando lugar a un metabolito que conserva el 50 % de su actividad. Tanto el Pancuronio como su metabolito son eliminados fundamentalmente en orina y en menor proporción por bilis. La duración de la acción se puede incrementar en insuficiencia renal y hepática. Tiene efectos adversos cardiovasculares (taquicardia e hipertensión arterial). Se suele utilizar en bolos.

C.- BLOQUEANTES NEUROMUSCULARES DE ACCIÓN INTERMEDIA:

VECURONIO: Es un BNM no despolarizante de acción intermedia que puede ser usado en infusión continua. La dosis de intubación es de 0,04mg/kg lo que le proporciona un inicio de acción de 2-4 min. La duración del bloqueo es de 30-40 min. Se metaboliza vía hepática y uno de sus 3 metabolitos conserva un 50 % de su actividad bloqueante. Se elimina básicamente vía renal. No tiene efectos adversos cardiovasculares ni produce liberación de histamina. En pacientes con insuficiencia renal puede dar lugar a múltiples casos de debilidad muscular.

ATRACURIO: Es un BNM de acción intermedia. Su metabolismo es órgano-independiente, no se acumula en insuficiencia renal o hepática. Se metaboliza en plasma por éster hidrólisis y fundamentalmente por la vía Hoffman (reacción no enzimática que ocurre a temperatura y pH normal). Tiene muy pocos efectos cardiovasculares, excepto por la liberación de histamina que puede ser considerable cuando se administran dosis altas en bolo rápido (en infusión continua la liberación de histamina se minimiza). La dosis de intubación es de 0.23 mg/kg y el inicio de acción es de 2-4 min. La duración del bloqueo es de 30-40 min.

MIVACURIO: BNM no despolarizante de acción más corta (12-18 min) aunque se clasifica como de acción intermedia. Se metaboliza en plasma por la colinesterasa. Pacientes con colinesterasa plasmática anormal pueden llevar a que la duración de acción sea prolongada (ej pacientes con insuficiencia renal que normalmente tienen la colinesterasa plasmática disminuida). La dosis para intubación es de 0,08 mg/kg y el inicio de la acción bloqueante se alcanza a los 2-4 min.

ROCURONIO: Es un BNM no despolarizante poco potente. La dosis de intubación es de 0,6mg/kg y el inicio de acción se sitúa en 1-2 min. Al igual que el Vecuronio no posee efectos colaterales cardiovasculares ni libera histamina. La ventaja sobre este es que tiene un inicio de acción más rápido. Se elimina fundamentalmente por vía biliar y algo por vía renal. Es muy dependiente de la función hepática para su eliminación (su duración de acción puede verse prolongada). Se han realizado numerosos estudios para examinar la equivalencia entre rocuronio y suxametonio, todos arrojan resultados conflictivos.

CISATRACURIO: Es uno de los 10 esteroisómeros del Atracurio (3 veces más potente). Se metaboliza principalmente por vía Hoffman, por lo que no se produce acúmulo en situaciones de disfunción orgánica. No es histaminoliberador. La dosis de intubación es de 0,2 mg/kg y su efecto se inicia a los 4-6 min. La duración de acción es de 40-60 min. Por estas características se considera como un BNM óptimo para su uso en pacientes críticos (UCI).

UTILIZACIÓN DE RELAJANTES MUSCULARES EN UN HOSPITAL COMARCAL

MEDICAMENTO	SERVICIO DE ANESTESIA	UCI
Suxametonio	Intubación con previsión de complicaciones. Uso poco frecuente por sus alteraciones electrolíticas.	Secuencia rápida de intubación Uso poco frecuente
Atracurio	Pacientes con insuficiencia renal o hepática	Semejante uso al Vecuronio
Cisatracurio		Menos alergias
Mivacurio		Cirugía programada e intervenciones cortas
Vecuronio	Cirugías programadas e intervenciones de 1h aprox.	Ventilación mecánica en el resto de pacientes
Rocuronio	Cirugías no programadas e intervenciones de 1 h aprox. como alternativa a suxametonio.	

Tabla-2. En la tabla se resumen las principales utilidades de los bloqueantes neuromusculares.