

M03A1A. BLOQUEANTES NEUROMUSCULARES

L

os bloqueantes neuromusculares impiden la transmisión del impulso nervioso a los músculos voluntarios a nivel de la conjunción neuromuscular. El mediador químico de la transmisión es la *acetilcolina*, que se libera en gran cantidad de las terminaciones nerviosas como resultado de la despolarización.

BLOQUEANTES NEUROMUSCULARES

MEDICAMENTO	ACCION (Minutos)		
	Inicio	Duración	Tipo
DESPOLARIZANTES Suxametonio	1-1,5	6-8	C
NO DESPOLARIZANTES			
<i>Aminas cuaternarias</i> Galamina	1-2	20-30	I
<i>benzilisoquinolinas</i> Tubocuranina	4-6	80-120	L
Atracurio	2-4	30-40	I
Cisatracurio	4-6	40-60	I
Mivacurio	2-4	12-18	C
<i>Aminoesteroides</i> Pancuronio	4-6	120-180	L
Vecuronio	2-4	30-40	I
Rocuronio	1-2	30-40	I

L = Larga I = Intermedia C = Corta

La acetilcolina actúa sobre receptores en la membrana de la fibra muscular. Estos receptores funcionan como *compuertas de iones*, que al ser activadas se abren dejando penetrar Na^+ y Ca^{++} y dejando salir K^+ . Cuando la despolarización de la membrana muscular ha alcanzado un grado suficiente, se produce la contracción. La acetilcolina es degradada rápidamente por la *acetilcolinesterasa* y el músculo vuelve a su estado inicial listo para responder a otro impulso.

La división clásica de los curarizantes en *despolarizantes* y *no despolarizantes* se basa en la forma de interferir con el mecanismo fisiológico que acabamos de describir. Los agentes despolarizantes tienen la misma acción fisiológica que la acetilcolina, pero no son degradados rápidamente por la colinesterasa como ella. Su acción por lo tanto es parecida a la que resultaría de administrar dosis muy altas de acetilcolina. Los no despolarizantes no tienen acción directa sobre el receptor muscular y funcionan simplemente como antagonistas competitivos de la acetilcolina.

A efectos prácticos los curarizantes *despolarizantes* tienen varios inconvenientes que los hacen menos deseables que los *no despolarizantes*. Uno de ellos es que producen fasciculación muscular previa al bloqueo, que suele resultar en dolor muscular postoperatorio. Otro es que sus efectos no revierten al elevar la

concentración de acetilcolina en la unión neuromuscular mediante la administración de inhibidores de la colinesterasa, cosa que sí ocurre con los antagonistas competitivos.

Por estas razones casi todos los curarizantes son del tipo no despolarizante. El único agente despolarizante usado en terapéutica es el **suxametonio** (también llamado succinilcolina) y ello únicamente por la rapidez de acción.

El criterio básico para seleccionar un curarizante es la *duración de la acción*. En función de ésta se suelen clasificar en: acción corta (menos de 15 minutos), intermedia (30 a 40 minutos) y larga (entre 1 y 3 horas).

En la Tabla se recogen los medicamentos del grupo con una indicación aproximada del inicio y duración de la acción. Estos parámetros son variables, dependen de la dosis, de la medicación concomitante –sobre todo del anestésico– y del paciente. La subdivisión según estructura química apenas tiene importancia a efectos de acción, pero puede tenerla para los efectos secundarios.

Estos son por lo general prolongación de la acción farmacológica, el más común es la apnea prolongada por defecto en la eliminación, pero son posibles también *bloqueo ganglionar*, *acción vagolítica* (que tiene cierta utilidad para contrarrestar los efectos de la medicación concomitante y la manipulación quirúrgica) y *liberación de histamina* (por desplazamiento de los mastocitos, no por reacción alérgica). Son efectos más comunes con los fármacos más antiguos (suxametonio, galamina, tubocurarina) ya que en los nuevos se ha procurado minimizarlos.

aplicaciones

Los curarizantes se emplean casi exclusivamente en cirugía. Tienen aplicaciones marginales para evitar lesiones en terapia de electroshock o en cuadros convulsivos severos (tétanos, status epiléptico o intoxicación por esticnina).

En aplicaciones quirúrgicas el medicamento se elige en función de la duración de la intervención.

Para la *intubación traqueal* las propiedades del **suxametonio** (acción muy rápida y duración muy corta) lo convierten en el fármaco más utilizado a pesar de sus inconvenientes. El **mivacurio** pertenece al grupo de los no despolarizantes; sus propiedades farmacocinéticas son un poco peores, pero es una buena alternativa si no queda contenido gástrico residual.

Los curarizantes de acción intermedia son de elección en intervenciones de media hora de duración. Los de acción larga se usan en operaciones de 90 minutos o más, pero muchos anestesistas prefieren usar productos de acción intermedia para intervenciones largas, manteniendo el bloqueo neuromuscular mediante infusión IV continuada. En estos casos tiene importancia la capacidad de eliminación, y por consiguiente en la selección del fármaco debe tomarse en consideración la función renal o hepática, y otras características del paciente que pudieran favorecer la acumulación.

Los dos curarizantes de acción corta de la Tabla (suxametonio y mivacurio) son metabolizados por la colinesterasa plasmática. Un porcentaje bajo, pero significativo, de la población tiene una deficiencia genética de este enzima, con lo cual puede producirse un alargamiento indeseable de la acción.