

Articaína: Anestésico local. Revisión bibliográfica

Articaine: Local Anesthetic. Bibliographic review

Jorge Gabriel Zamora Espinoza. Universidad Latina de Costa Rica, Costa Rica
gab_zam1305@hotmail.com

RESUMEN

Los anestésicos locales son ampliamente utilizados en la práctica clínica diaria en diferentes procedimientos odontológicos, por lo cual es fundamental el conocimiento de sus aspectos farmacológicos más relevantes, con el objetivo de optimizar su empleo, mejorar la experiencia del odontólogo y minimizar las complicaciones relacionadas con su uso.

La articaína es un anestésico tipo amida de duración intermedia, acción corta y con un metabolismo rápido debido a un grupo éster en su estructura. Además, es eficaz con infiltración local o bloqueo de nervios en odontología. Por esto último y debido a la gran popularidad que ha presentado en el campo odontológico, se presenta la siguiente revisión bibliográfica.

PALABRAS CLAVE

Articaína, propiedades químicas, metabolismo, excreción

ABSTRACT

Local anesthetics are widely used in daily clinical practice in different dental procedures, so it is essential to know the most relevant pharmacological aspects of local anesthetics in order to optimize them, improve patient experience, and minimize complications related to their use. Articaine is an amide anesthetic of intermediate duration, short acting, and fast metabolism due to an ester group in its structure. In addition, it is effective with local infiltration or nerve block procedures in dentistry. For the latter and due to Articaine's great popularity in the dental field, the following literature review is presented.

KEYWORDS

Articaine, chemical properties, metabolism, excretion

Recibido: 9 Diciembre, 2013

Aceptado para publicar: 21 Mayo, 2014

Desde su introducción, los anestésicos locales han sido empleados fundamentalmente para bloquear la transmisión de los impulsos nerviosos en áreas específicas de la cavidad oral, lo que ha permitido la realización de procedimientos dentales y quirúrgicos.

La articaína es un agente anestésico tipo aminoamida, sintetizado en 1969 por Rusching y colaboradores. Posteriormente, en 1976, sale al mercado en Alemania y Suiza bajo la marca Ultracain (Oertel y col, 1997). En un inicio se le conocía como carticaína. Luego, en 1983, cambia su nombre a articaína y en 1984 es introducida al mercado canadiense. En abril del año 2000 es aprobada por la FDA para su comercialización en los Estados Unidos de América (Malamed, 2006; pp 71).

A pesar de la condición estándar de la lidocaína, diferentes autores afirman que la articaína goza de una reputación superior, basado principalmente en la idea de que posee una mayor eficacia anestésica. Malamed describe que el clorhidrato de articaína presenta una potencia 1,5 veces mayor que la lidocaína, inicio más rápido y una mayor tasa de éxito (Malamed, 2006 pp 71). Vree y Gielen en 2005, afirman que “en odontología, la articaína es el fármaco de elección en la gran mayoría de la literatura” (Vree y Gielen, 2005). Isen en 2000, describió “una mayor acción del clorhidrato de articaína sobre otros anestésicos locales”, basada en su solubilidad en lípidos, lo cual facilita su entrada al interior del nervio (Isen, 2000). Schertzer en 2000, afirma “ha ganado una mayoría del mercado dental en muchos de los países en los que está disponible” (Schertzer, 2000). Weaver “la articaína se ha convertido en el anestésico local más popular para los dentistas dondequiera que se ha introducido”, (Weaver, 1999).

Daubländer, Müller y Lipp (1997) realizaron un estudio en Alemania en el cual uno de los cuestionamientos era la preferencia de los anestésicos locales en novecientos once odontólogos, quienes informaron que el uso de articaína (al 4%) con epinefrina 1:100 000 fue del 51,5%; con epinefrina 1:200 000 un 38,7%; la mepivacaina (al 3%) se usó un 3,0% y la lidocaína (al 2%) con epinefrina 1:100 000 un 2,1% (Daubländer, Müller y Lipp, 1997). Haas, en 1995, realizó un estudio en Ontario, Canadá, donde los odontólogos informaron que el uso de articaína es de un 38% y el de lidocaína 26 % (Haas, 1995). En Alemania, Jakobs (1989) realizó un estudio para conocer la preferencia de los anestésicos locales. Participaron 541 odontólogos y concluyó que la administración rutinaria de articaína es de 71,7 % y de lidocaína 12,5 % (Jakobs, 1989).

PROPIEDADES QUÍMICAS.

Es la única amida que posee un anillo de tiofeno en vez de uno de benceno, lo que le confiere alta liposolubilidad, lo cual incrementa la potencia y difusión del anestésico a través de la membrana celular rica en lípidos para llegar a los re-

ceptores, lo que da mayor seguridad, ya que se requiere menos volumen (Yapp, 2011) (Snoeck, 2012). Además, solo la articaína tiene un grupo éster, lo que le permite ser metabolizada en el plasma (hidrólisis por esterases plasmáticas) y por el hígado (enzimas microsomales hepáticas); esto último disminuye considerablemente su riesgo de toxicidad, lo cual genera mayor tolerancia traducida a mayor seguridad en su uso (Oertel y col, 1997) (Snoeck, 2012) (Malamed, 2006 pp 71) (Andersson y col, 2010 pp 57).

MECANISMO DE ACCIÓN

Como todos los anestésicos locales, la articaína ocasiona un bloqueo reversible de la conducción nerviosa, al disminuir la permeabilidad del sodio de la membrana de las células nerviosas. Esta reducción disminuye la despolarización de la membrana (Andersson y col, 2010 pp 51). El bloqueo se produce en todas las fibras nerviosas pero los efectos son mayores en los nervios autonómicos que en los sensoriales y en estos, mayores que en los motores. Se pierde la sensibilidad al dolor, temperatura, tacto, propiocepción y tono muscular. Es necesario que el fármaco se en-

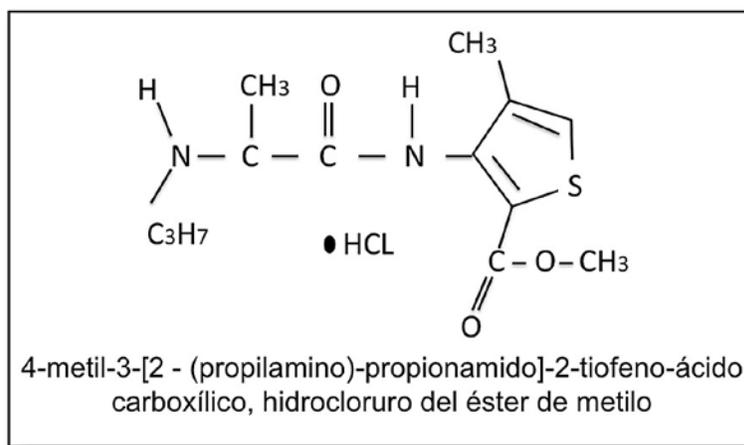


Figura 1. Estructura química de la articaína.

cuentre en contacto directo con la membrana de las células nerviosas, por lo cual una alta difusión en tejidos es necesaria (Trejos, 1992 pp 133) (Reyes y Aldana, 2010) (Malamed, 2006 pp 15) (Snoeck, 2012).

METABOLISMO Y EXCRECIÓN

Su degradación es iniciada por hidrólisis del ácido carboxílico del grupo éster, lo cual da lugar al ácido carboxílico libre (Malamed, 2006 pp 71). El metabolito primario de la articaína, el ácido articaínico, es inactivo farmacológicamente y sufre una biotransformación para formar glucurónido de ácido articaínico (Vree y col, 1997). Su excreción se da por vía renal, aproximadamente en un 90% en forma de metabolitos y de un 5 a 10% sin metabolizar. Entre el 53% y 57% de la dosis administrada se elimina durante las primeras 24 horas después de su administración submucosa (Malamed y col, 2001) (Yapp, 2011) La vida media de eliminación plasmática es de 20 a 30 minutos (Oertel y col, 1997).

La concentración de la articaína es de 4% (72 mg) mientras que los demás anestésicos la presentan de 2% o 3%. Esto le da la ventaja de que tiene un tiempo de latencia menor y está acompañada de epinefrina 1:100 000 (0,018 mg) o 1:200 000 (0,009 mg) en carpules de 1.8 ml (Ensaldo y col, 2003) (Andersson y col, 2010 pp 57). Su dosis recomendada es de 7 mg por kilogramo de peso siendo lo máximo 500 mg por cita (Cumming y col, 2011) (Andersson y col, 2010 pp 59) (Malamed, 2006 pp 72-73).

El embarazo representa una contraindicación relativa al tratamiento odontológico y en especial durante el primer trimestre de gestación. La articaína y vasoconstrictores no son teratogénicos y se pueden administrar en cualquier trimestre; no obstante, lo más pru-

dente es ser conservador con su uso en el embarazo, ya que su categoría es C por lo que se debe tener en cuenta el riesgo beneficio a la hora de su aplicación, de igual manera que en la lactancia materna (Malamed, 2006 pp 145-147) (Vree y Gielen, 2005) (García y col, 2003). Presenta un pKa de 7,8 un pH de 4,4 a 5,4 y una potencia de 1,5 con respecto a la lidocaína. Un inicio de acción de 1-2 minutos para las infiltraciones y de 2-3 minutos en el bloqueo mandibular. Su semivida anestésica es de 0,5 horas y es clasificada de duración media (Malamed, 2006 pp 71) (Johansen, 2004). La duración del efecto anestésico varía de acuerdo con la cantidad de vasoconstrictor que tenga la formulación. La articaína con epinefrina 1:100 000 tiene un efecto anestésico aproximado de

75 minutos en tejido pulpar y 240 minutos en tejidos blandos. La articaína con epinefrina 1:200 000, 45 minutos en tejido pulpar y 180 minutos en tejidos blandos (Sierra y col, 2007) (García y col, 2003) (Malamed y col. 2000).

Además, la articaína ha probado su eficacia en las infiltraciones vestibulares de molares inferiores para procedimientos operatorios, lo que implica comodidad para el paciente, ya que no experimenta adormecimiento de toda la hemiarcada, labio y lengua (Valero y Pérez, 2007) (Ensaldo y col, 2003) (Andersson y col, 2010 pp 58).

Los efectos tóxicos de la articaína son similares a los de la lidocaína, y adicionalmente al carpul de articaína se le agrega bisulfito de

Clasificación farmacológica de la FDA durante el embarazo y lactancia		
Fármaco	Categoría En Embarazo	Categoría En Lactancia
Articaína	C	Precaución
Bupivacaína	C	Desconocida
Lidocaína	B	Segura
Mepivacaína	C	Desconocida
Prilocaina	B	Precaución
Epinefrina	C	No Segura

B: Se aconseja Precaución / C: Sopesar Riesgo Beneficios

Figura 2. Clasificación de la FDA



Figura 3. Articaína comercializada en Costa Rica.

sodio, que sirve como conservador para la epinefrina. Este bisulfito de sodio no debe ser administrado a pacientes con historia de alergia a las sulfas, pues se pueden presentar ataques de asma o un shock anafiláctico (Ensaldo y col, 2003) (Malamed, 2006 pp 73).

COMPARACIÓN CON OTROS ANESTÉSICOS

Vähätalo y colaboradores, en 1993, realizaron un estudio comparando las propiedades entre el clorhidrato de articaína con epinefrina 1:200.000 (Ultracain® DS) y lidocaína con epinefrina 1:80.000 (Xylocaing-adrenalina). El comienzo y la duración de la anestesia se evaluaron usando pruebas eléctricas en la pulpa. Concluyeron que no se observaron diferencias estadísticamente significativas en el inicio y la duración de la anestesia entre las soluciones (Vähätalo y colaboradores, 1993).

Malamed, Gagnon y Leblanc (2000) compararon la seguridad y eficacia de articaína (4 % con epinefrina 1:100.000) con la de lidocaína (2 % con epinefrina 1:100.000) en pacientes de 4 años a 79 años. Un total de 882 sujetos fueron evaluados con articaína y 443 con lidocaína. La eficacia se determinó inmediatamente después del procedimiento utilizando una escala visual analógica. La seguridad se evaluó mediante la medición de los signos vitales antes y después de la administración del anestésico (1 y 5 minutos después de la medicación y al final del procedimiento) y mediante la evaluación de los eventos adversos durante todo el estudio. Los eventos adversos se suscitaron durante el seguimiento telefónico a las 24 horas y 7 días después del procedimiento. Estos autores concluyeron que la articaína es un anestésico local eficaz en adultos y en niños mayores de 4 años tanto como la lidocaína. "Ar-

ticaína al 4% con epinefrina 1:100 000 es un anestésico local seguro y eficaz para su uso en odontología pediátrica (Mayor a 4 años). El tiempo de inicio y la duración de la anestesia son apropiados para el uso clínico y son comparables a los observados para otros anestésicos locales disponibles comercialmente" (Malamed y col, 2000).

En 2003 estos investigadores realizaron un estudio donde el propósito era comparar la articaína al 4% con epinefrina 1:100 000 y la lidocaína al 2% con epinefrina 1:100 000. Se seleccionaron 86 pacientes con buena salud, libres de patologías sistémicas y sin alergias. El rango de edad fue entre 18 y 30 años y donde la media fue de 26 años; 43 fueron anestesiados con articaína al 4% con epinefrina 1:100 000, mientras que los otros 43 lo fueron con lidocaína al 2% con epinefrina 1:100 000.

Los resultados demostraron mayor eficacia de la articaína sobre la lidocaína con mayor tiempo de duración, bien tolerada por los pacientes y con informes al dentista de ausencia de dolor. En conclusión, el clorhidrato de articaína tiene algunas ventajas sobre la lidocaína en relación con el control de dolor y menor tiempo operatorio (Ensaldo y col, 2003).

En 2007 se realizó un estudio comparativo por Sierra y col, acerca de la eficacia anestésica de articaína al 4% frente a la lidocaína al 2%, ambas con epinefrina 1:100.000, en el bloqueo del nervio alveolar inferior durante la extracción quirúrgica de los terceros molares inferiores.

Se realizó con 30 pacientes programados para las extracciones quirúrgicas bilaterales de terceros molares inferiores. Se utilizó una escala analógica visual para evaluar el dolor durante la cirugía, para así evaluar subjetivamente la

eficacia anestésica de las dos soluciones. Se observaron diferencias estadísticamente significativas en la duración del efecto anestésico (220,86 minutos de articaína al 4% contra 168,20 minutos de lidocaína al 2%). La latencia, la cantidad de solución anestésica y la necesidad de volver a anestesiarse el campo quirúrgico mostraron poca diferencia a favor de la articaína. Las puntuaciones de dolor expresaron eficacia anestésica similar con ambas soluciones. Se concluyó que la articaína al 4% presenta mejor rendimiento clínico ante la lidocaína al 2%, sobre todo en términos de latencia y duración del efecto anestésico. Sin embargo, no se registraron diferencias estadísticamente significativas en la eficacia anestésica entre las dos soluciones (Sierra y col, 2007).

SEGURIDAD EN SU USO

Todos los anestésicos locales tienen el potencial de ser peligrosos, con efectos adversos, incluyendo síntomas de mareos, desorientación, temblores, convulsiones, hipotensión, depresión cardíaca y respiratoria (Subramaniam y Tennant, 2005). La articaína es uno de los anestésicos locales más seguros, debido a su rápido metabolismo; el riesgo de toxicidad sistémica y la sobredosis disminuyen, incluso después de la inyección repetida (Oertel y col, 1997). En diferentes estudios se ha evaluado su capacidad de producir parestesias en su aplicación y han dado diferentes conclusiones. Gaffen y Haas, luego de realizar un estudio donde por 10 años evaluaron la incidencia de parestesias, concluyeron que las soluciones anestésicas de articaína y prilocaína al 4% se asocian con un mayor riesgo de parestesia. Estos autores mencionan que "parece difícil justificar el uso rutinario de estas soluciones de anestesia para el bloqueo mandibular. Como siempre, los dentistas deben eva-

luar cuidadosamente los riesgos y beneficios de todos los medicamentos que prescriben o administran”, (Gaffen y Haas, 2009)

Garisto y col, obtuvieron los informes de parestesias que implican anestesia local durante el período entre noviembre de 1997 y agosto de 2008. Durante el lapso de estudio, se informaron 248 casos de parestesia después de procedimientos dentales. En la mayoría de los casos (94,5 por ciento), durante los procedimientos, se anestesió el nervio mandibular. El nervio lingual se vio afectado en el 89,0 por ciento de los casos. Los resultados del estudio confirman que la parestesia que surge de una inyección de anestesia local por sí sola, es un acontecimiento raro; sin embargo, las soluciones al 4% están más relacionadas con el desarrollo de la parestesia. Por lo tanto, los odontólogos deben considerar estos resultados al evaluar los riesgos y beneficios del uso de 4% de los anestésicos locales para anestesia de bloqueo mandibular (Garisto y col, 2010).

Yapp y col, concluyen en su artículo que aunque puede haber controversia con respecto a su seguridad y ventajas en comparación con otros anestésicos locales, no hay pruebas concluyentes que muestren neurotoxicidad o propiedades anestésicas significativamente superiores de articaína para los procedimientos dentales (Yapp y col, 2011).

CONCLUSIÓN

Debido a la amplia gama de investigaciones con respecto a la articaína, se puede concluir que es un fármaco seguro y eficaz para su uso en todos los aspectos de la odontología, para pacientes de casi todas las edades, con propiedades comparables a otros agentes anestésicos locales comunes. ■■■

BIBLIOGRAFÍA

- Andersson, L, Kahnberg, KE, Pogrel, MA. (2010). *Oral and maxillofacial surgery*. Editorial Wiley-Blackwell. Primera edición. Blackwell Publishing Ltd. pp 51, 57, 58,59
- Cummings, D., Yamashita, D., McAndrews, J. (2011). *Complications of local anesthesia used in oral and maxillofacial surgery*. *Oral Maxillofacial Surg Clin N Am* 23 (2011) 369-377 doi:10.1016/j.coms.2011.04.009. Elsevier In All rights reserved.
- Daublander M, Muller R, Lipp MD. (1997). *The incidence of complications associated with local anesthesia in dentistry*. *Anesth Prog* 1997;44:132-141.
- Ensaldo E, Ensaldo ED, Rivas R, Adler S. (2003). *Estudio clínico comparativo entre articaína y lidocaína*. *Rev ADM* 2003;60(3): 212-218
- Gaffen A S, Haas D A. (2009). *Retrospective review of voluntary reports of nonsurgical paresthesia in dentistry*. *J Can Dent Assoc* 2009; 75: 579.
- García, A. Guisado, B. Montalvo, J. (2003). *Riesgos y complicaciones de la anestesia local en la consulta dental*. *Estado actual*. *RCOE* 2003;8(1):41-63
- Garisto G A, Gaffen A S, Lawrence H P, Tenenbaum H C, Haas D A. (2010). *Occurrence of paresthesia after dental local anesthetic administration in the United States*. *J Am Dent Assoc* 2010; 141: 836-844
- Haas DA, Lennon D. (1995). *Local anesthetic use by dentists in Ontario*. *J Can Dent Assoc* 1995;61:297-304.
- Isen DA. (2000). *Articaine: pharmacology and clinical use of a recently approved local anesthetic*. *Dent Today* 2000;19:72-77
- Jakobs W.(1989). *Status of dental anesthesia in Germany*. *Anesth Prog* 1989;36:210-212.
- Johansen, O. (2004). *Comparison of articaine and lidocaine used as dental local anesthetics*. Tesis, Universidad de Oslo. Mayo 2004
- Malamed S. F (2006). *Manual de anestesia local*. 5th ed. Madrid, España 2006. pp 15, 71, 72, 73, 145, 146, 147
- Malamed SF, Gagnon S, Leblanc D. (2000). *A comparison between articaine HCl and lidocaine HCl in pediatric dental patients*. *Pediatr Dent*;22:307-11
- Malamed SF, Gagnon S, Leblanc D. (2000). *Efficacy of articaine: a new amide local anesthetic*. *J Am Dent Assoc* 2000;131:635-42.
- Oertel R, Ebert U, Rahn R, Kirch W. (1997). *Clinical pharmacokinetics of articaine*. *Clin Pharmacokinet*. 1997 Dec;33(6):418.
- Reyes, R.D., Aldana, J.L. (2010). *Anestésicos locales: de los conceptos básicos a la práctica clínica*. *Rev Col Or Tra* 2010;24(1):32-9
- Schertzer ER,Jr. (2000). *Articaine vs. lidocaine*. *J Am Dent Assoc* 2000;131:1242-1243.

Sierra, A. Delgado, E. Berini, L. Gay, C. (2007). *Comparative study of the anesthetic efficacy of 4% articaine versus 2% lidocaine in inferior alveolar nerve block during surgical extraction of impacted lower third molars. Med Oral Patol Oral Cir Bucal* 2007;12: E139-44.

Snoeck, M. (2012). *Articaine: a review of its use for local and regional anesthesia. Local and Regional Anesthesia* 2012;5 23-33

Subramaniam S, Tennant M. (2005). *A concise review of the basic biology and pharmacology of local analgesia. Aust Dent J* 2005; 50(4 Suppl 2): S23-30.

Trejo, S. (1992). *Farmacología y terapéutica sstomatológica en clínica privada. Editorial Méndez Editores. México DF* 1992:130-144

Valerio, Y. Perez, S (2007). *Comparativo entre articaína y lidocaína. Revista Mexicana de Odontología. Año 2, No 1* 2007;26-32

Vahatalo, K. Antila, H. Lehtinen, R. (1993). *Articaine and lidocaine for maxillary infiltration anesthesia. Anesth Prog* 40:114-116 1993.

Vree T, Gielen M. (2005). *Clinical pharmacology and the use of articaine for local and regional anaesthesia. Best Pract Res Clin Anaesthesiol.* 2005 Jun;19(2):293-308.

Vree T, Simon M, Gielen M. Booij L. (1997). *Regional metabolism of articaine in 10 patients undergoing intravenous regional anaesthesia during day case surgery. Br J Clin Pharmacol.* 1997;44:29-34.

Weaver JM. (1999). *Articaine, a new local anesthetic for American dentists: will it supersede lidocaine? Anesth Prog* 1999;46:111-112.

Yapp, KE. Hopcraft, MS. Parashos, P. (2011). *Articaine: a review of the literature. British Dental Journal Volume 210 No 7, Abril 9 2011; 323-329*