

Lidocaína: Anestésico local. Revisión bibliográfica

Lidocaine: Local anesthetic Bibliographic review

Aldo Velázquez Zepeda,¹ Lizeth Alcántara Monroy,²
Valeria Monserrat Cordero López,³ Ana Karen Benítez Martínez,⁴ Nancy
Brigitte Fuentes Corona⁵

Recibido: 16 de mayo de 2023
Aceptado: 22 de junio de 2023

Resumen

Los anestésicos son un grupo de fármacos empleados para disminuir la sensibilidad y la conciencia dado que bloquean la percepción del dolor. Los anestésicos se dividen en generales y locales, a su vez los locales se subdividen en amidas y ésteres. La lidocaína es un anestésico local perteneciente al grupo de las amidas que se utiliza principalmente en la anestesia local y analgesia posoperatoria. Por lo anterior y su importancia clínica, el presente artículo de revisión es una recopilación bibliográfica acerca de la lidocaína, sus propiedades químicas, mecanismo de acción, metabolismo, excreción, comparación con otros anestésicos, efectos adversos y toxicología.

PALABRAS CLAVE

Lidocaína, anestésico local, metabolismo, excreción, efectos adversos.

Abstract

Anesthetics are a group of drugs used to decrease sensitivity and consciousness by blocking the perception of pain. Anesthetics are divided into general and local, while the local ones are subdivided into amides and esters. Lidocaine is a local anesthetic belonging to the amide group that is mainly used in local anesthesia and postoperative analgesia. Due to the above and its clinical importance, this review article is a bibliographic compilation about lidocaine, its chemical properties, mechanism of action, metabolism, excretion, comparison with other anesthetics, adverse effects, and toxicology.

KEY WORDS

Lidocaine, local anesthetic, metabolism, excretion, adverse effects.

¹Universidad Autónoma del Estado de México, México. Correo electrónico: avelazquez@uaemex.mx. ORCID: 0000-0002-0513-2622. ²Universidad Autónoma del Estado de México, México. ORCID: 0009-0004-6668-5652. ³Universidad Autónoma del Estado de México, México. ORCID: 0009-0005-6046-0142. ⁴Universidad Autónoma del Estado de México, México. ORCID: 0009-0007-4464-3146. ⁵Universidad Autónoma del Estado de México, México. ORCID:0009-0002-4232-0566.

Introducción

En el presente artículo de revisión se exploró la importancia de investigar a fondo los anestésicos locales, centrándonos en la lidocaína. Así mismo, se examinaron los aspectos clave que impulsan la necesidad de investigar esta sustancia, como sus propiedades químicas, mecanismo de acción, metabolismo y excreción, efectos adversos, entre otros puntos. Lo anterior gracias a que la investigación sobre la lidocaína ofrece un camino prometedor hacia una atención médica más efectiva y personalizada.

Los anestésicos locales son sustancias que bloquean la percepción del dolor de una región específica del cuerpo de manera temporal e inhiben la propagación de los impulsos nerviosos. Tales medicamentos se han usado ampliamente en la práctica clínica para lograr una analgesia local en distintos procedimientos quirúrgicos, diagnósticos o terapéuticos.¹⁶ Los anestésicos locales se dividen en dos grupos principales: aminoamidas y amino ésteres según su estructura química.

La elección de un anestésico local para un procedimiento determinado depende de muchos factores, como el tipo de intervención, la profundidad de la anestesia y la duración prevista del procedimiento.¹⁴ Sin embargo, el uso de los anestésicos locales no está exento de riesgos, como la toxicidad sistémica o la reacción alérgica. Es importante tener en cuenta contraindicaciones y prestar atención cuidadosa a la administración con el fin de evitar tales efectos adversos y maximizar la seguridad del paciente.²⁰

Como se mencionó, los anestésicos locales son medicamentos ampliamente utilizados en la práctica clínica para lograr la insensibilización reversible de una región del cuerpo, permitiendo realizar procedimientos médicos o quirúrgicos sin dolor. Entre ellos, destaca la lidocaína por su eficacia y amplio espectro de acción. Esta actúa inhibiendo la entrada de los iones de sodio en las células nerviosas, lo que impide la generación y conducción del impulso nervioso y, por tanto, la percepción del dolor. Además, la lidocaína presenta otros beneficios, como una baja toxicidad, rápido inicio de acción y duración adecuada para muchos procedimientos.

La lidocaína se ha utilizado en diversos contextos clínicos, como la anestesia local, regional o espinal, el manejo de arritmias cardíacas y la analgesia postoperatoria, entre otros. Además, su uso se ha expandido en la práctica odontológica, dermatológica, oftalmológica y veterinaria. Algunos estudios han evaluado su eficacia en el alivio del dolor crónico, aunque aún se requieren más investigaciones para establecer su eficacia y seguridad en este ámbito.

Por lo tanto, se considera que la lidocaína es un anestésico local altamente efectivo y versátil, que puede ser utilizado en diversos contextos clínicos con buenos resultados y baja incidencia de efectos indeseables.

Propiedades Químicas

De acuerdo con la forma farmacéutica a utilizar, la lidocaína puede ser lidocaína base, de fórmula $C_{14}H_{22}N_2O$ (utilizada para cremas y ungüentos) o lidocaína clorhidrato (utilizada para geles y soluciones) de fórmula $C_{14}H_{23}ClN_2O \cdot H_2O$.

La lidocaína base es un polvo cristalino, blanco o casi blanco, es prácticamente insoluble en agua, pero muy soluble en etanol al 96 % y en cloruro de metileno. Su punto de fusión está entre los 68-69 °C. La lidocaína clorhidrato es un polvo cristalino, blanco o casi blanco, muy soluble en agua y muy fácilmente soluble en etanol 96 %; con un punto de fusión entre 77-78 °C.¹

Mecanismo de Acción

La acción de la lidocaína se basa principalmente en el bloqueo de la iniciación como de la conducción de los impulsos nerviosos. (AEMPS, 2017) Esto ocurre debido a que hay despolarización en la membrana de todos los tejidos excitables que al interactuar con canales de sodio dependientes del voltaje (lo cual también produce arritmias debido al bloqueo de canales rápidos de sodio en el miocardio), el bloqueo para poder reducir el flujo de Na^+ hacía el interior y de esa forma evitar la despolarización. De esa forma, ocurre una interrupción

de la transmisión de los impulsos tanto aferentes como eferentes, produciendo analgesia y anestesia.²

Metabolismo y excreción

La lidocaína se metaboliza principalmente por la CYP3A4 en humanos. Se une un 40-80 % a las proteínas, entre tanto, la vida media de eliminación es de 120 minutos; su rápido aclaramiento se debe a la distribución en órganos altamente vascularizados. Menos de 10 % del fármaco se excreta inalterado por vía renal.

Tanto en humanos como en animales, algunos de los metabolitos que se producen en la degradación de las aminoamidas son activos y pueden contribuir a los efectos secundarios. La lidocaína produce monoetil-glicenexilidido (MEGX) y glicilxilidido (GX) que tienen menor efecto que la lidocaína, pero su vida media es más prolongada.⁷

La lidocaína es eliminada del cuerpo mediante dietilación en el hígado por los grupos de isoenzimas 1A2 y 3A4 del citocromo p450. De manera que todos los fármacos que inhiban a la isoenzima 3A4 y al citocromo p450 pueden afectar el metabolismo de la lidocaína.⁵

Comparación con otros anestésicos

La benzocaína es un anestésico local de tipo éster, poco hidrosoluble que permanece en su lugar más tiempo, lo que le proporciona una duración de acción larga. Está disponible en aerosol, en gel (que contiene dosis variables desde 63, 75, 100, 150, 180 a 200 mg/ml), en parche de gel, en pomada 161, 200 mg/ml o en solución de 2, 50, 200 mg/ml; 65 y 75 mg/ml.

Se comparó la efectividad de la benzocaína en gel al 20 % contra lidocaína en solución al 10 % en pacientes que requerían punción en la mucosa oral. Se concluye que la administración de Benzocaína en gel al 20 % o de la Lidocaína en solución al 10 % reduce el dolor a la punción en igual magnitud y pueden ser usados indistintamente en la práctica odontológica diaria.³

Otro fármaco similar es la Bupivacaína que es un anestésico empleado en procedimientos post-operatorios tanto para aliviar dolores de cáncer o cirugías graves, puesto que este fármaco es cuatro veces más potente que la lidocaína, y su acción puede durar hasta aproximadamente 6 horas. Al igual que la lidocaína, se une de forma reversible a los canales de sodio de la neuro bloqueando los impulsos que envía el sistema nervioso al cuerpo.²⁴

Por otro lado tenemos a la articaína un anestésico local del grupo amida, su tiempo de latencia mandibular varía de 2 a 3 minutos, tiene una acción vasodilatadora similar a la lidocaína en una concentración de 1:100 000 y tiene una alta capacidad de difusión entre los tejidos. Sobre la comparación del efecto anestésicos de ambas sustancias, existen varias investigaciones donde concluyen que la articaína es mejor anestésico local que la lidocaína en cuanto tiempo de latencia, reforzamiento de anestesia, y tiempo de duración.¹¹

Efectos Adversos

Los efectos adversos que suelen presentarse son infrecuentes, en la mayoría de los casos ocurre debido a que su concentración plasmática aumenta a niveles tóxicos, esto originado por una dosis alta o por una absorción rápida. De acuerdo a la FDA, la dosis máxima segura debe ser de 4.5 a 5 mg/kg de peso corporal, mientras que la dosis de lidocaína con epinefrina no debe exceder 7 mg/kg cada 90 minutos, que es el tiempo de vida media.²⁰

Al igual que otros anestésicos locales, debido a una dosificación alta, una rápida absorción o a la inadvertida inyección intravascular, pueden presentarse síntomas de intoxicación en forma de complicaciones respiratorias, circulatorias y trastornos del sistema nervioso. Los principales efectos adversos que se pueden presentar son: mareos, náuseas, vómitos, temblores, visión borrosa, somnolencia, excitación, depresión respiratoria, depresión miocárdica, arritmias, convulsiones, hipotensión, entre otras; y en casos muy raros pueden presentarse reacciones alérgicas.²²

Toxicología

Los primeros signos y síntomas de toxicidad leve se hacen evidentes a niveles plasmáticos, comenzando con dificultad para hablar, tinnitus, parestesia peribucal y sensación de desmayo. Conforme la concentración va aumentando, el paciente puede experimentar convulsiones o pérdida del conocimiento. Mientras que en concentraciones muy altas el miocardio y el sistema nervioso central se deprimen aún más provocando arritmias cardíacas, paro respiratorio y paro cardíaco.

En el caso de un paciente consciente, es menos probable que la lidocaína progrese rápidamente desde los efectos neurológicos hasta el colapso cardiovascular total. Pero por el contrario; si el paciente está bajo los efectos simultáneos de sedación o anestesia general, los signos y síntomas neurológicos a menudo pueden pasar desapercibidos, por lo que la inestabilidad cardiovascular o las arritmias suelen ser las primeras manifestaciones. La administración del fármaco debe suspenderse inmediatamente si se sospecha de toxicidad.⁴

Innovaciones

En los últimos años se han encontrado diferentes propiedades de la lidocaína, algunas de las cuales van más allá de las clásicas encontradas dentro de sus características como anestésico local. Estas propiedades dependen de las diferentes concentraciones plasmáticas a las que se encuentren.²²

Las infecciones de las heridas quirúrgicas continúan representando un grave problema en el área de salud, ya que consumen gran parte de los recursos humanos y materiales destinados a su asistencia. Estas infecciones son complicaciones comunes que contribuyen a aumentar la morbilidad hospitalaria, manifestándose con una evolución tórpida en el postoperatorio, reflejándose en un aumento de los días de estancia hospitalaria y convalecencia que disminuye la calidad de vida en ocasiones temporalmente y en algunos casos permanentemente, incluso provocando la muerte.²¹

En 1992, Eriksson et al. investigaron la influencia de la lidocaína sobre la función leucocitaria en heridas quirúrgicas en modelos experimentales en ratas, observando una disminución de la concentración de leucotrienos b4 e interleucina 1.¹⁰

Teniendo como hipótesis metodológica que si se aplica lidocaína simple al 2% simple en tejido subcutáneo de las heridas quirúrgicas limpias-contaminadas y contaminadas disminuirá la presencia de infección. Aún no es posible eliminar por completo el riesgo de infección, pero sí es posible su reducción hasta un nivel mínimo y poder ofrecer un beneficio al paciente, disminuir los recursos utilizados, siendo el objetivo principal de este estudio la disminución del desarrollo de infección en heridas limpias-contaminadas y contaminadas, al aplicar lidocaína simple al 2% en el tejido celular subcutáneo al término de la cirugía. Al disminuir la incidencia de infección hay una disminución en los días de hospitalización y, por lo tanto, una disminución en el uso de recursos humanos y materiales destinados para la atención de pacientes infectados.²¹

La laringoscopia es una técnica dolorosa durante su realización; la molestia podría prolongarse incluso hasta el periodo postanestésico.^{9,15}

El uso de la lidocaína administrada por vía nebulizada permite reducir, e incluso evitar, con mayor frecuencia el dolor laringotraqueal postintubación en comparación con su uso intravenoso. Así mismo, proporcionar por esta vía evita cambios hemodinámicos, al no observarse incrementos en la frecuencia cardíaca y presiones arteriales como los encontrados cuando se colocó por vía intravenosa.²³

Discusión

La lidocaína es un anestésico local ampliamente utilizado en la práctica clínica debido a su eficacia y versatilidad. Actúa bloqueando la entrada de iones de sodio en las células nerviosas, impidiendo la generación y conducción del impulso nervioso, lo que resulta en analgesia y anestesia. Además de su acción anestésica, la lidocaína presenta beneficios como una baja toxicidad, rápido inicio

de acción y duración adecuada para muchos procedimientos. Se ha utilizado en diversos contextos clínicos, incluyendo anestesia local, manejo de arritmias cardíacas y analgesia postoperatoria. Sin embargo, su uso no está exento de riesgos, como la toxicidad sistémica y las reacciones alérgicas. Es importante tener en cuenta las contraindicaciones y administrar con precaución para evitar efectos adversos y garantizar la seguridad del paciente.⁶

La lidocaína se metaboliza principalmente en el hígado y se excreta principalmente por vía renal. Algunos de sus metabolitos activos pueden contribuir a los efectos secundarios. Comparada con otros anestésicos locales, como la benzocaína, la bupivacaína y la articaína, la lidocaína ha demostrado ser efectiva y segura en diversos estudios. Sin embargo, es importante tener en cuenta las diferentes características y propiedades de cada anestésico local al seleccionar el más adecuado para cada situación clínica. En cuanto a los efectos adversos, la lidocaína puede causar síntomas de intoxicación en casos de dosificación alta o absorción rápida, como mareos, náuseas, vómitos, trastornos del sistema nervioso y en casos raros, reacciones alérgicas. La lidocaína también puede ser tóxica a concentraciones muy altas, lo que puede llevar a complicaciones respiratorias, circulatorias y trastornos del sistema nervioso. Se deben tener en cuenta las dosis máximas seguras y suspender la administración si se sospecha de toxicidad.⁸

Conclusiones

La lidocaína es un excelente fármaco empleado comúnmente en hospitales tanto públicos como privados debido a que, como cualquiera de los anestésicos locales, actúa a través del bloqueo de canales de sodio de neuronas periféricas sensitivas, impidiendo la conducción nerviosa y así aliviar el dolor; siendo esta su función principal. En los últimos años se ha comprobado que este fármaco tiene más propiedades benéficas, además de ser considerado un fármaco seguro puesto que su uso no genera reacciones adversas graves.

La lidocaína se metaboliza en el hígado y se excreta principalmente por vía renal. Algunos de sus metabolitos activos pueden contribuir a los efectos secundarios. Comparada con otros anestésicos locales, ha demostrado ser segura y efectiva en estudios clínicos. Sin embargo, es importante considerar las características y propiedades individuales de cada anestésico local al seleccionar el más adecuado para cada situación clínica.

Además, la lidocaína ha demostrado poseer propiedades más allá de su función como anestésico local. Su influencia en la función leucocitaria y su capacidad para reducir la concentración de leucotrienos b4 e interleucina 1 en heridas quirúrgicas son hallazgos importantes, estos descubrimientos respaldan la importancia de seguir investigando las propiedades y usos potenciales de la lidocaína en el ámbito de la salud, con el objetivo de mejorar la calidad de vida de los pacientes y optimizar los recursos médicos disponibles.

Referencias

1. Acofarma. (2010). Ficha de Datos de seguridad: Lidocaína Ph. Eur. Madrid, España. 2da edición.
2. Andrade Ávila, L. A., Crivelli Matamoros, L. E., Enamorado López, M. L., Fuentes Núñez, G. A., Fuentes Sánchez, A. L., Gavarrete Paz, J. V., & Gómez Bautista, C. A. (2019). Lidocaína versus lidocaína/epinefrina: generalidades y toxicidad. *Revista Científica de la Escuela Universitaria de las Ciencias de la Salud*, Volumen 6 (No. 1), 36-46.
3. Arbildo Vega, Heber Isac. (2015). Efectividad de la Benzocaína en Gel al 20% y la Lidocaína en Solución al 10% en Pacientes que Requieren Punción en la Mucosa Oral: Un Ensayo Clínico Controlado Aleatorizado Cruzado a Triple Ciego. *International journal of odontostomatology*, 9(2), 227-232
4. Beecham, G., Nessel, T., & Goyal, A. (2022). Lidocaine. *Treasure Island (FL): StatPearls*
5. Buenrostro-Vásquez, C. Buck-Soltero J.A. Morales-Valle L, A. Granados-Tinajero S, O. (2017). Anestesia en liposucción de grandes volúmenes. *Anestesia en México*. 29 (1)
6. Casasola, O. (2012). Lidocaína: Actualización de sus propiedades farmacológicas y su uso clínico. *Revista Mexicana de Anestesiología*, 35(Supl. 1), S22-S30.
7. Caicedo-Gutiérrez de Piñeres, L. Pérez-Agudelo, J.M. (2018). La lidocaína

- en terapéutica veterinaria: posibles nuevos usos desde la perspectiva farmacocinética y farmacodinámica. *Revista Veterinaria y Zootecnia*, 12 (2). 82-90.
8. Edmondson, R. S. (2021). Lidocaine Toxicity. In StatPearls [Internet]. StatPearls Publishing.
9. Edomwonyi N, Ekwere I, Omo E, Rupasinghe A. (2006). Postoperative throat complications after tracheal intubation. *Ann Afr Med*. 2006; 5 (1): 28-32.
10. Eriksson AS, Sinclair R, Cassuto J, Thompsen P (1992). Influence of lidocaine on leucocyte function in the surgical wound. *Anesthesiology* 1992; 77: 74-78.
11. Espinoza Plaza, J., Ascanoa Olazo, J. A. ., Valenzuela Ramos, M. R. (2022). Ciencia de la eficacia anestésica de la articaína y de la lidocaína en exodoncias de terceros molares inferiores. Una revisión de literatura. *Llamkasun*, 3(1), 157c–160. <https://doi.org/10.47797/llamkasun.v3i1.95>
12. Falcone, R. A., & Desai, K. K. (2017). Local Anesthetics. In *Pharmacology and Physiology for Anesthesia* (Second Edition) (pp. 319-329). Elsevier.
13. Fichas técnicas del Centro de Información online de Medicamentos de la AEMPS-CIMA [base de datos en Internet]. Madrid, España: Agencia Española de Medicamentos y Productos Sanitarios (AEMPS). Disponible en: <https://cima.aemps.es/cima/publico/lista.html>
14. Gallardo, J. I., & García, F. R. (2017). Anestésicos locales. *Revista de Medicina y Cirugía del Hospital Provincial de Huasco*, 11(1), 31-36.
15. Gulabani M, Gurha P, Dass P, Kulshreshtha. (2015). Comparative analysis of efficacy of lignocaine 1.5 mg/kg and two different doses of dexmedetomidine (0.5 µg/kg and 1 µg/kg) in attenuating the hemodynamic pressure response to laryngoscopy and intubation. *Anesth Essays Res*. 2015; 9 (1): 5-14.
16. Júnior, J. R., Santana, E. F. D., Jesus, F. L. D., Silva, R. C. D., & Santos, W. R. D. (2019). Anestésicos locais. *Compléments de formation continue*, 9(1), 38-44.
17. Kiguli-Malwadde, E., & Businge, F. (2020). Lidocaine for postoperative analgesia after anesthesia: a systematic review and meta-analysis. *BMC anesthesiology*, 20(1), 193.
18. Malamed, S. F. (2018). Local Anesthetics. In *Sedation* (Sixth Edition) (pp. 163-188). Elsevier.
19. Martin, E., Ramsay, M. A. E., & Mantz, J. (Eds.). (2019). *Pharmacology and Physiology for Anesthesia: Foundations and Clinical Application*. Cambridge University Press.
20. Nithyanandam, R., & Fleisher, L. A. (2018). Local Anesthetics. En: *Miller's Anesthesia* (9th ed.) (pp. 654-676). Elsevier.
21. Noriega-Salas, Ana Lorena, Sánchez-López-López, Miguel Ángel, Esperón Lorenzana, Guadalupe Iris, & Trejo Suárez, José. (2011). Aplicación de lidocaína simple al 2% en tejido celular subcutáneo de heridas quirúrgicas limpias-contaminadas y contaminadas para disminuir la incidencia de infección. *Cirujano general*, 33(3), 180-184. Recuperado en 21 de junio de 2023, de http://www.scielo.org.mx/scielo.php?script=sci_arttext&pid=S1405-009920110003000008&lng=es&tlng=es.
22. Ochoa, G., Aguirre, C., & Franco, M. (2017). Lidocaína: aspectos generales y nuevas implicaciones en la inflamación. *40 (3)*, 220-225
23. Valera-Rodríguez, Yolanda, Elizalde-Flores, Fernando, Torres-González, Cristhofer Abel, & Rendón-Macías, Mario Enrique. (2017). Lidocaína nebulizada contra intravenosa en la intubación endotraqueal: comparación de sus efectos cardiovasculares y grado de analgesia. *Acta médica Grupo Ángeles*, 15(1), 13-19. Recuperado en 21 de junio de 2023, de http://www.scielo.org.mx/scielo.php?script=sci_arttext&pid=S1870-72032017000100013&lng=es&tlng=es.
24. Velioglu, O., Calis, A. S., Koca, H., & Velioglu, E. (2020). Bupivacaine vs. lidocaine: a comparison of local anesthetic efficacy in impacted third molar surgery. *Clinical oral investigations*, 24(10), 3539–3546.