

FICHAS DE INFORMACIÓN TÉCNICA

LIDOCAÍNA BASE y LIDOCAÍNA CLORHIDRATO

Sinónimos: Xilocaína. Lignocaína.

Datos Físico-Químicos: Lidocaína base

Polvo cristalino, blanco o casi blanco. Práct. insoluble en agua, muy soluble en etanol 96% y en cloruro de metileno. Punto de fusión: 68 – 69 °C.

Fórmula Molecular: $C_{14}H_{22}N_2O$
Peso Molecular: 234,34

Lidocaína clorhidrato

Polvo cristalino, blanco o casi blanco. Muy soluble en agua, fácilmente soluble en etanol al 96%. Punto de fusión: 77 -78°C.

Fórmula Molecular: $C_{14}H_{23}ClN_2O \cdot H_2O$
Peso Molecular: 288,82

Aprox. 1,23 g de Lidocaína clorhidrato (monohidrato) equivalen a 1 g de Lidocaína base.

Propiedades y usos:

La lidocaína es un anestésico local tipo amida con duración de acción intermedia y un antiarrítmico de clase Ib. Actúa estabilizando la membrana neuronal previniendo el inicio y la propagación del impulso nervioso.

La lidocaína se absorbe rápidamente a través de la piel lesionada (no a través de la piel intacta) y a través del punto de inyección en el músculo. Se distribuye ampliamente a los tejidos, incluidos el músculo esquelético y el tejido adiposo. Se une en un 66 % a proteínas plasmáticas. La semivida inicial después de una dosis intravenosa es < 30 min. Se metaboliza en el hígado y sufre efecto de primer paso hepático. La semivida de eliminación es de 1 – 2 h. Atraviesa las barreras placentaria y hematoencefálica, y pasa a leche materna.

Normalmente se usa la Lidocaína base para cremas y ungüentos, y la Lidocaína clorhidrato para geles y soluciones.

La lidocaína como anestésico se utiliza para anestesia local tópica o por infiltración en la piel en casos de prurito y dolor asociado a heridas, quemaduras, abrasiones, manifestaciones cutáneas de enfermedades sistémicas como el sarampión, picaduras, eczemas, episiotomía, y dolores dentales y gingivales. En forma de gel se utiliza p. ej. para anestesia del tracto urinario. En forma de solución tópica se usa para la anestesia superficial de membranas mucosas de la boca, garganta, y otras del tracto gastrointestinal superior. Acompañando a la fluoresceína se usa en forma de gotas oculares para las tonometrías. También se usa en anestesia regional, anestesia epidural y anestesia espinal.

La lidocaína viscosa es un gel líquido de lidocaína usado en los

FICHAS DE INFORMACIÓN TÉCNICA

tratamientos que siguen a las intervenciones oncológicas y sobretodo en casos de mucositis.

La lidocaína como antiarrítmico es usada en taquicardias ventriculares y fibrilación ventricular, en especial las asociadas a infarto agudo de miocardio y en los protocolos de RCP.

Finalmente también se usa en el status epilepticus refractario a otros tratamientos.

- Dosificación:** Vía tópica, al 2 – 5 % de Lidocaína base o al 0,5 – 5 % de Lidocaína clorhidrato.
- Efectos secundarios:** Los efectos adversos de la lidocaína son en general infrecuentes, aunque moderadamente importantes. En la mayor parte de los casos, los efectos adversos están relacionados con la dosis. Ocasionalmente puede aparecer excitación, agitación, mareos, tinnitus, visión borrosa, náuseas, vómitos, temblores, y convulsiones. El entumecimiento de la lengua y de la región perioral puede ser un primer síntoma de la toxicidad sistémica. Después de la excitación puede aparecer depresión con somnolencia, depresión respiratoria y coma, incluso con depresión miocárdica, hipotensión, bradicardia, arritmias, y parada cardíaca. Excepcionalmente pueden aparecer reacciones alérgicas (urticaria, dermatitis de contacto, reacción anafilactoide) y metahemoglobinemia. Tras la aplicación tópica, además de las reacciones de tipo alérgico, puede aparecer irritación cutánea, hinchazón, abrasión y necrosis.
- Contraindicaciones:** Alergia a la lidocaína o a anestésicos locales tipo amida.
- Precauciones:** Deberá realizarse un especial control médico en pacientes con epilepsia, bloqueo cardíaco, bradicardia, insuficiencia cardíaca, porfiria, insuficiencia hepática y/o renal o shock grave, cuando se suponga que debido al lugar de aplicación o a la utilización de dosis elevadas pudieran producirse concentraciones plasmáticas elevadas. No es aconsejable la aplicación sobre áreas inflamadas o infectadas. Los ancianos, niños y pacientes muy debilitados son más susceptibles a los efectos tóxicos del preparado, especialmente en situaciones donde hay riesgo de absorción sistémica. Cuando se usa en anestesia bucofaríngea, se aconseja no comer mientras persista la anestesia, ante el riesgo de broncoaspiración o de morderse la lengua.
- Interacciones:** El propranolol (y posiblemente otros betabloqueantes) y la cimetidina pueden reducir el metabolismo hepático y/o el aclaramiento de la lidocaína. Los efectos depresores de la lidocaína son aditivos con los de los betabloqueantes y otros antiarrítmicos. La administración a largo plazo de inductores enzimáticos como fenitoína o barbitúricos puede aumentar las dosis requeridas de lidocaína. La hipopotasemia producida por los diuréticos antagoniza el efecto de

FICHAS DE INFORMACIÓN TÉCNICA

la lidocaína.

Incompatibilidades:

Anfotericina, sulfadiazina sódica, metohexitona sódica, cefazolina sódica, ampicilina sódica, y fenitoína sódica.

Las soluciones deben envasarse y conservarse en frascos de cristal para evitar la adsorción de lidocaína en el plástico.

La lidocaína forma una mezcla eutéctica con la prilocaína (licúan juntas), lo cual más que una incompatibilidad es una característica que se aprovecha a la hora de preparar fórmulas tópicas.

Observaciones:

La Lidocaína base es termolábil y fotosensible.

Conservación:

En envases bien cerrados. PROTEGER DE LA LUZ.

Ejemplos de formulación:

Crema de lidocaína y prilocaína

Lidocaína base	2,5 %
Prilocaína base	2,5 %
Cera Lanette O	14 %
Vaselina líquida	8 %
Tween 80	3 %
Nipagín	0,05 %
Nipasol	0,02 %
Agua purificada c.s.p.	100 g

Modus operandi:

Fundir la vaselina con la cera, el Tween, y el Nipasol por un lado, y por otro calentar el agua con el Nipagín. Añadir la fase acuosa sobre la fase grasa agitando con varilla hasta enfriamiento. En mortero triturar la lidocaína y la prilocaína hasta que licúen, e incorporar la crema poco a poco homogeneizando con el pistilo.

Excipiente adhesivo oral con lidocaína e hidrocortisona

Lidocaína clorhidrato	2 %
Hidrocortisona	1 %
Excipiente Acofar adhesivo oral	50 g

Modus operandi:

Pulverizar bien los sólidos en el mortero, humectar con un poco de vaselina líquida, e incorporar el excipiente poco a poco homogeneizando con el pistilo.

Gel de lidocaína

Lidocaína clorhidrato	2 %
Carboximetilcelulosa sódica	2 %
Nipagín sódico	0,1 %
Agua purificada c.s.p.	100 g

FICHAS DE INFORMACIÓN TÉCNICA

Modus operandi:

Disolver la lidocaína clorhidrato y el Nipagín sódico en el agua purificada, y proceder a gelificarlo (ver ficha técnica Carboximetilcelulosa sódica).

Lidocaína viscosa

Lidocaína clorhidrato 2 %
Metilcelulosa 4 %
Agua purificada c.s.p. 10 g

Modus operandi:

Disolver la lidocaína clorhidrato en el agua purificada. Gelificar la solución (ver ficha técnica Metilcelulosa).

Solución de lidocaína

Lidocaína clorhidrato 4 %
Solución hidroalcohólica 70 % c.s.p. 100 ml

Modus operandi:

Disolver la lidocaína clorhidrato en el agua, y una vez disuelto añadir la parte de alcohol.

Bibliografía:

- Martindale, *Guía completa de consulta farmacoterapéutica*, 1ª ed. (2003).
- *The Merck Index*, 13ª ed. (2001).
- *Monografías Farmacéuticas*, C.O.F. de Alicante (1998).
- *Formulario básico de medicamentos magistrales*, M.ª José Llopis Clavijo y Vicent Baixauli Comes (2007).