

REVISIÓN CIENTÍFICA ANESTÉSICOS LOCALES

Dosificación, Eficacia y Seguridad

Documento basado en evidencia científica actualizada
Febrero 2026

ÍNDICE

1. Clasificación y Propiedades Farmacológicas
2. Dosificación Máxima Recomendada
3. Factores que Modifican la Eficacia
4. Poblaciones Especiales
5. Toxicidad Sistémica (LAST)
6. Medidas Preventivas de Toxicidad
7. Tratamiento de la Toxicidad
8. Eficacia Clínica: Mezclas vs Monoterapia

1. CLASIFICACIÓN Y PROPIEDADES FARMACOLÓGICAS

TIPOS DE ANESTÉSICOS LOCALES

Los anestésicos locales se clasifican en dos grupos según su estructura química:

AMINOÉSTERES: Procaína, tetracaína, cloroprocaína

- Metabolismo: Hidrólisis por esterasas plasmáticas
- Mayor riesgo de reacciones alérgicas

AMINOAMIDAS: Lidocaína, bupivacaína, ropivacaína, levobupivacaína

- Metabolismo: Hepático (citocromo P450)
- Menor riesgo alérgico
- Más utilizadas en la práctica clínica actual

PROPIEDADES COMPARATIVAS

Propiedad	Lidocaína	Bupivacaína
pKa	7.9	8.1
Fijación proteínas	65-70%	95%
Latencia	Corta	Intermedia
Duración	90-120 min	180-210 min
Dosis (mg/kg)	2-7	1-2.5
Dosis máxima	400 mg	200 mg
Potencia relativa	1	4

Diferencias clave:

La bupivacaína es cuatro veces más potente que la lidocaína; su acción se inicia con más demora, pero dura aproximadamente 6 horas.

Lidocaína tiene un inicio rápido, pero duración corta de 1-2 horas, mientras que bupivacaína ofrece una duración más prolongada de 3-8 horas, pero con mayor riesgo de toxicidad sistémica.

2. DOSIFICACIÓN MÁXIMA RECOMENDADA

DOSIS MÁXIMAS ESTÁNDAR

Las dosis máximas permitidas que aparecen en varias publicaciones son pautas aproximadas que no están basadas en evidencia y no tienen en cuenta el sitio o la técnica de administración de anestésicos locales o los factores del paciente que aumentan el riesgo de toxicidad.

Anestésico	Sin epinefrina	Con epinefrina	Dosis máxima total
Lidocaína	4.5 mg/kg	7 mg/kg	300-500 mg
Bupivacaína	2 mg/kg	2.5 mg/kg	175-200 mg
Ropivacaína	3 mg/kg	3 mg/kg	200 mg
Levobupivacaína	2 mg/kg	3 mg/kg	250 mg

CÁLCULO PRÁCTICO DE CONCENTRACIONES

Una concentración al 1% significa que en 100 ml hay 1 g y en 10 ml de la solución hay 100 mg del anestésico. Para calcular la concentración en mg/ml bastará con multiplicar el tanto por ciento por 10: así, al 2% tendremos 20 mg/ml de la solución.

Ejemplos prácticos:

- Lidocaína 2% = 20 mg/ml
- Bupivacaína 0.5% = 5 mg/ml
- Bupivacaína 0.25% = 2.5 mg/ml

3. FACTORES QUE MODIFICAN LA EFICACIA

A. FACTORES DEPENDIENTES DEL FÁRMACO

pKa y pH tisular:

El pH del tejido influye mucho sobre la eficacia de los anestésicos locales. Así, en los tejidos a infiltrar con pH ácido como infectados o la mucosa oral los anestésicos locales tienen menor efecto y es preciso utilizar mayores concentraciones.

Liposolubilidad:

La duración del efecto anestésico está en relación a su liposolubilidad, es decir, a mayor liposolubilidad mayor concentración en la vaina de mielina, la membrana celular, y por ende mayor toxicidad. Actualmente, la bupivacaína es considerada el anestésico local más liposoluble, más potente y más cardiotoxico.

B. SITIO DE ADMINISTRACIÓN

Concentraciones plasmáticas similares de lidocaína se alcanzan después de la inyección de 300 mg en un bloqueo de nervio intercostal, 500 mg en una epidural, 600 mg en un bloqueo de plexo braquial, o 1000 mg en una infiltración subcutánea en miembros inferiores.

Orden de absorción (mayor a menor):

1. Interpleural/intercostal
2. Caudal
3. Epidural
4. Plexo braquial
5. Infiltración subcutánea

C. ADICIÓN DE VASOCONSTRICTORES

La epinefrina es el vasoconstrictor más frecuentemente empleado en concentraciones de 2.5 a 5 µg/mL. Adicionalmente, actúa como marcador de inyección intravascular inadvertida al incrementar la frecuencia cardíaca y la presión arterial.

Beneficios de la adrenalina:

- Prolonga la duración del efecto 50-100%
- Reduce absorción sistémica
- Permite usar mayores dosis totales
- Disminuye sangrado local

4. POBLACIONES ESPECIALES

POBLACIÓN PEDIÁTRICA

El CYP3A4 no es maduro al nacimiento. Por lo que, al mes de edad, la depuración intrínseca de la bupivacaína es solo de 1/3 del adulto y 2/3 a los 6 meses. Por otro lado, el CYP1A2 no es completamente maduro hasta la edad de 3 años.

Consideraciones:

En prematuros y recién nacidos se recomienda disminuir las dosis en un 15%. Se recomienda disminuir las dosis entre 10-20% sobre los 70 años. En insuficiencia renal y hepática se recomienda disminuir las dosis en 10-50%.

PACIENTES CON COMORBILIDADES

Los pacientes que evolucionan con estados hiperdinámicos como el que ocurre en el último trimestre del embarazo, uremia, tirotoxicosis, etc., tienen mayor riesgo de presentar aumento abrupto de la concentración plasmática de un anestésico local ya que hay un aumento de la absorción desde el sitio de inyección, por lo que habría que disminuir las dosis en 10-20%.

5. TOXICIDAD SISTÉMICA (LAST)

MECANISMO Y PRESENTACIÓN

La intoxicación sistémica se produce debido a las concentraciones plasmáticas elevadas después de altas dosis o la administración intravenosa inadvertida.

Manifestaciones clínicas:

La presentación clínica de intoxicación sistémica por anestésicos locales es muy variable, pero a menudo incluye síntomas y signos iniciales de excitación del SNC: adormecimiento perioral, gusto metálico, cambios en el estado mental o ansiedad, cambios visuales, espasmos musculares y convulsiones, seguidos de síntomas inhibitorios del SNC como somnolencia.

CARDIOTOXICIDAD

La lidocaína puede ser considerada un 'fast-in and fast-out', mientras que la bupivacaína parece 'fast-in and slow-out'. Los anestésicos locales más lipofílicos, como la bupivacaína, tienen un mayor riesgo de toxicidad en relación con los anestésicos locales menos lipofílicos, como la mepivacaína y la lidocaína.

Orden de cardiotoxicidad (mayor a menor):

1. Bupivacaína racémica
2. Levobupivacaína
3. Ropivacaína
4. Lidocaína

ANESTÉSICOS DE SEGURIDAD MEJORADA

La levobupivacaína y la ropivacaína, anestésicos locales que clínicamente han demostrado tener un mayor margen de seguridad, es decir, se necesita mayor masa de estereoisómeros L comparado con bupivacaína a dosis equipotentes para producir efectos tóxicos.

6. MEDIDAS PREVENTIVAS DE TOXICIDAD

El uso de ultrasonido reduce significativamente el riesgo de intoxicación sistémica por anestésicos locales en humanos sometidos a bloqueos de nervios periféricos. Use la dosis efectiva más baja de anestésico local. Use una dosis de inyección incremental: administre de a 3 a 5 ml, haciendo una pausa de 15 a 30 segundos entre cada inyección.

Protocolo de seguridad:

1. Aspiración antes de cada inyección
2. Inyección fraccionada (3-5 ml por dosis)
3. Pausas de 15-30 segundos entre inyecciones
4. Monitorización continua
5. Dosis test con epinefrina

7. TRATAMIENTO DE LA TOXICIDAD

EMULSIÓN LIPÍDICA AL 20%

Después de la inyección intravenosa rápida inicial de emulsión lipídica, administrada durante 2 a 3 minutos, se puede manejar la persistencia de la toxicidad con inyecciones intravenosas rápidas repetidas o con infusiones de lípidos de 0.25 ml/kg/min hasta que se estabilice o de 200 ml a 250 ml cada 15 a 20 minutos. DOSIS MÁXIMA: 12 ml/kg del peso corporal ideal.

La dosis de emulsión lipídica recomendada es de 10 mL/kg en los primeros 30 minutos.

8. EFICACIA CLÍNICA: MEZCLAS VS MONOTERAPIA

BUPIVACAÍNA-LIDOCAÍNA

La mezcla de bupivacaína-lidocaína logró un inicio de acción más rápido de 20 minutos que la bupivacaína al 0.5% sola que fue de 35 minutos.

Sin embargo, el uso de bupivacaína al 0.5% sola prolonga significativamente la duración del bloqueo motor y sensorial y la analgesia posoperatoria en comparación con una mezcla de bupivacaína y lidocaína, aunque da como resultado un tiempo de inicio más lento.

Conclusión clínica:

- **Mezcla:** Inicio más rápido, menor duración
- **Bupivacaína sola:** Inicio más lento, mayor duración analgésica

CONCLUSIONES BASADAS EN EVIDENCIA

1. Las dosis máximas son orientativas, no absolutas, y deben individualizarse según: sitio de inyección, técnica, comorbilidades del paciente, uso de vasoconstrictores y edad.
2. La eficacia depende de múltiples factores: concentración, volumen, pH tisular, vascularización del sitio, técnica de administración y características individuales del paciente.
3. La prevención es fundamental: técnica adecuada, dosis fraccionadas, aspiración frecuente, uso de ultrasonido y monitorización continua.
4. La toxicidad es predecible: conocer las dosis, reconocer síntomas tempranos y tener disponible emulsión lipídica al 20% para tratamiento inmediato.
5. Los nuevos anestésicos (ropivacaína, levobupivacaína) ofrecen mejor perfil de seguridad cardiovascular que la bupivacaína racémica, especialmente en dosis altas o poblaciones de riesgo.

DOCUMENTO BASADO EN EVIDENCIA CIENTÍFICA

Revisión actualizada a Febrero 2026