

Anestésicos Locais

1

2 Conceitos:

Prof. Dr. Ricardo M. Oliveira-Filho
 Dept. Farmacologia — ICB/USP
 rmo@lho.icb.usp.br

Anestesia local: é a supressão temporária de **todos os tipos de sensibilidade** de uma determinada área do organismo, **sem perda de consciência**.

Anestésicos locais são substâncias capazes de impedir, de modo **reversível**, a gênese e a condução de impulsos nas fibras nervosas **sensitivas**.

HISTÓRICO

2

- A **cocaína**. Isolamento: **Niemann** (1859)
 - "Cura" de um morfímano: **S. Freud** (1884)
 - Em oftalmologia: **Karl Köller** (1884)
 - Em odontologia: **Hall** (1884)
 - Em cirurgia: **Halsted** (1885)
- 1909: **procaína** (**Einhorn**)
- 1943: **lidocaína** (**Löfgren**, lab. Astra)
- 1957: **bupivacaína**
- 1961: **prilocaína** (**Wiedling**, lab. Astra)
- 1974: **articaína**
- **Q futuro**: análogos da tetrodotoxina e da saxitoxina?

A TTX é um dos mais potentes venenos conhecidos: **10 mil vezes mais que o cianeto!** Seus efeitos tóxicos começam com uma dormância dos lábios e língua. Dependendo da dose ingerida (a DL50 em camundongos é 8 µg/kg), um efeito paralisante progressivo afeta todos os **movimentos musculares**, incluindo o diafragma. Muitas vítimas morrem em menos de 2 horas após a ingestão. **Não existe antídoto**: cerca de 50% dos intoxicados morrem. A cada ano, cerca de 100 japoneses sucumbem devido à presença de tetrodotoxina residual no sashimi de fugu.

A propósito, ler *O Clube dos Anjos* de Luis Fernando Verissimo (série "Pleios Pecados", Editora Objetiva)

CLASSIFICAÇÃO

3

- **Grupo éster**
Derivados do ácido p-amino-benzóico:
 procaína (*Alfine, Fonergin*) (assoc.)
 tetracaína (*Oto-Betnovate...*) (assoc.)
 benzocaina (*Dequadin, Malvona...*) (assoc.)
- **Grupo amida**
Derivados xilênicos:
 lidocaína (*Xylestesin, Xylocaina*)
 mepivacaína (*Carbocaina*)
 bupivacaína (*Bup, Neocaina*)
- Derivado toluênico:**
 prilocaína (*Medicaina, Citocaina*)
- Derivado tiofênico:**
 articaína (*Scandicaina*)

Mecanismo de ação

4

1) Visão celular/química:

"É a forma ionizada da molécula a principal responsável pela ação anestésica, atuando na face interna da membrana do neurônio."

2) Visão molecular:

"Ocorre interrupção funcional do canal de sódio, por bloqueio da função do "gate" de inativação, fixando o canal no estado inativado."

Fatores que interferem no efeito de anestésicos locais

5

- pK_a do fármaco e pH do tecido
- tempo de difusão ponta da agulha ® nervo
- tempo de difusão para fora da fibra:
 - uso de vasoconstritores
- influência do diâmetro da fibra
- influência da estimulação prévia
- influência da concentração do fármaco
- término do efeito

Efeitos adversos

6

Psicogênicos

Síncope (o mais comum)
Hiperventilação
Náuseas, vômitos
Alterações FC ou PA
Falsas reações alérgicas

Hipersensibilidade

Esteres (amidas: muito raro)
Metabissulfito
Parabenos

Coração: ~ 4 propriedades

Vasos: Vasodilatação: necessidade de uso de vasoconstritores

SNC

Fase I: excitação (inquietação, irritabilidade,
- FC, - FR, - PA, abalos musculares, convulsões tônico-clônicas)

Fase II: depressão (indiferença afetiva, sonolência, - FC, - FR, - PA, coma e morte)

Respiração:
Depressão

Sangue - metemoglobinemia
Principal: prilocalina
Alguns relatos: articaina

Vasoconstritores associados a anestésicos locais ⁷

1. Aminas simpatomiméticas

- de ação predominantemente α (p.ex., noradrenalina)*
- de ação mista α e β (adrenalina)

2. Derivado do hormônio antidiurético

- felipressina (Octapressin[®])

(*) e congêneres como **α -metilnoradrenalina** (nordefrina, isoadrenalina, homoadrenalina, corbadrina, levonordefrina, neo-cobefrina etc.), **fenilefrina** (metaoxedrina, neo-sinefrina), **sinefrina** (simpatol), e vários outros

Outros tópicos de interesse ⁸

É crucial que todos os princípios da correta técnica anestésica (conhecimento de anatomia, uso de anestésico compatível com o ato cirúrgico programado, injeção lenta e fracionada, cuidados de antisepsia etc.) sejam escrupulosamente seguidos.

Hipertireoidismo: ocorre grande aumento do número e da sensibilidade de receptores β -adrenérgicos cardíacos. Cuidados: sessões curtas, pela manhã, o mais atraumáticas possível, paciente deve ter tomado sua medicação anti-tireóide e β -bloqueadora usual.

Diabetes mellitus: doença plurimetabólica com problemas de sangramento, imunidade, cicatrização, suscetibilidade a infecções, etc. Reduzir ao mínimo possível a extensão da agressão a tecidos moles.

Gravidez e lactação: não há restrição ao uso de anestésicos locais e vasoconstritores (v. slide 9).

Alcoolismo: os relatos clínicos dão conta de maior dificuldade em conseguir efeito anestésico adequado. Causa desconhecida.

Doses máximas permitidas de anestésicos locais e vasoconstritores: v. slides 10 e 11.

Uso de anestésicos locais durante a gravidez e a lactação ⁹

Fármaco	FDA	Gravidez	Lactação
Anestésicos locais injetáveis			
Lidocaína	B	sim	sim
Prilocaina	B	sim	sim
Mepivacaína	C	sim	sim
Bupivacaína	C	sim	sim
Vasoconstritores			
Adrenalina*	B/C	sim	sim
Levonordefrina**	—	sim	sim

(*) 1:100.000 ou 1:200.000
(**) 1:20.000

Doses máximas de anestésicos locais 10
 (indivíduos adultos saudáveis, por sessão)

Fármaco	mg/Kg	dose máx. (mg)	nº tubetes
Lidocaína 2%	4,4	300	8
Lidocaína 3%	4,4	300	5
Prilocaína 3%	6,0	400	7
Mepivacaína 2%	4,4	300	8
Mepivacaína 3%	4,4	300	5
Articaína 4%	7,0	490	6
Bupivacaína 0,5%	1,3	90	10

Doses máximas de vasoconstritores 11
 (indivíduos adultos saudáveis, por sessão)

Vasoconstritor	dose máx.	tubetes
Adrenalina 1:50.000	0,2 mg	5
Adrenalina 1:100.000	0,2 mg	10
Noradrenalina 1:50.000	0,34 mg	9
Levonordefrina 1:20.000	1,0 mg	11
Fenilefrina 1:2.500	4,0 mg	5
Felipressina	0,27 UI	5

Exemplos anamnéticos que devem ser valorizados para a anestesia local odontológica: 12

- O médico recomendou tirar o carpete e trocar as cortinas da casa por causa da minha alergia.
- Tenho alergia a enlatados em geral.
- Tenho alergia a vinho tinto. Tenho alergia a adrenalina.
- Tenho tireoide.
- Tomo remédios para o coração (ou: para a pressão).
- Estou passando por uma fase difícil. Tomo remédio para depressão.
- Depois que estou anestesiada não há problema, mas tenho pavor da injeção.
- Tomo remédio para a diabetes.
- Tomo insulina.
- (Mostra um laudo apontando deficiência de G-6PD) [raro]
- Estou grávida / Estou amamentando.
