

Farmacologia dos Anestésicos

Locais – Parte 1



Prof. Dr. Samuel P. Xavier Depto Cirurgia TBMFP- FORP/USP

Prof. Dr. Samuel P. Xavier Depto Cirurgia TBMFP- FORP/USP

Odonto **CONSULT**
WWW.ELSEVIER.COM.BR/ODONTOCONSULT



STANLEY F. MALAMED

MANUAL DE
Anestesia Local



TRADUÇÃO DA 4ª EDIÇÃO

Propriedades ideais

- reversível
- não irritante
- não tóxico
- atuar rapidamente
- tempo de duração
- pequeno risco de reações alérgicas
- esterilização
- estabilidade
- biotransformação
- preço

Alphacaine
Lidocaina



Cirucaína 0,5%



Articaine



BioPressin DENTSPY



Scandicaína 2%



Scandicaína
nor-adrenalina



Mepivacaína



BioCaina DENTSPY



Septanest



Prilocaina 3%

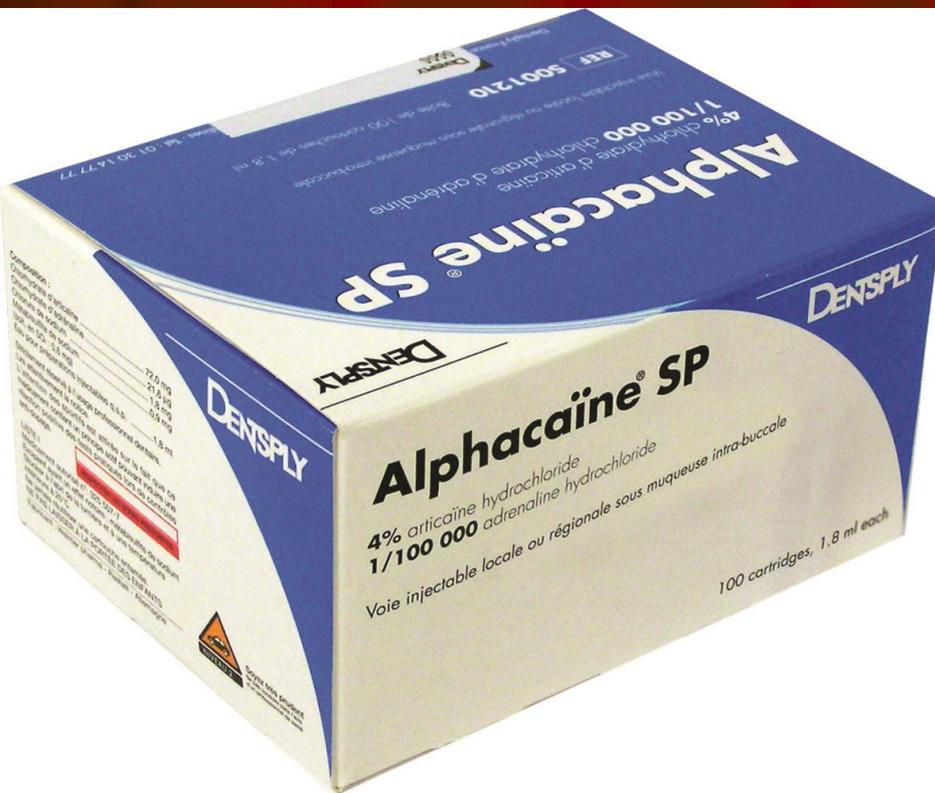


Lidostesim 3%



Alphacaine (Dentsply) ≠ Alphacaine (DFL)

Articaína 4%



Lidocaína 2%



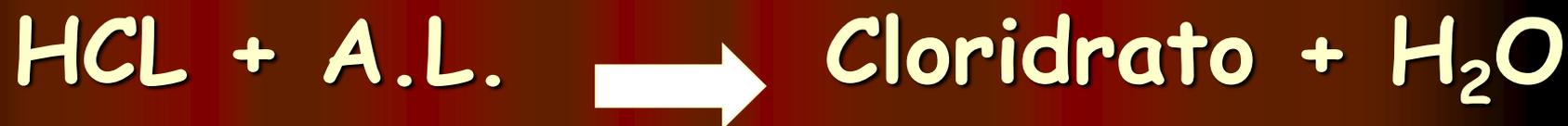
Solução Anestésica

- **Agente anestésico**
 - **Preservador do anestésico**
 - **Vasocostnstritor**
 - **Preservador do vasoconstritor**
 - **Veículo aquoso isotônico**
-

Agente Anestésico

- Bases fracas (Aminas) pouco solúveis

Na fábrica:



Ácido + Base = Sal + Água

pH da solução: $\pm 5,5$

Agente Anestésico

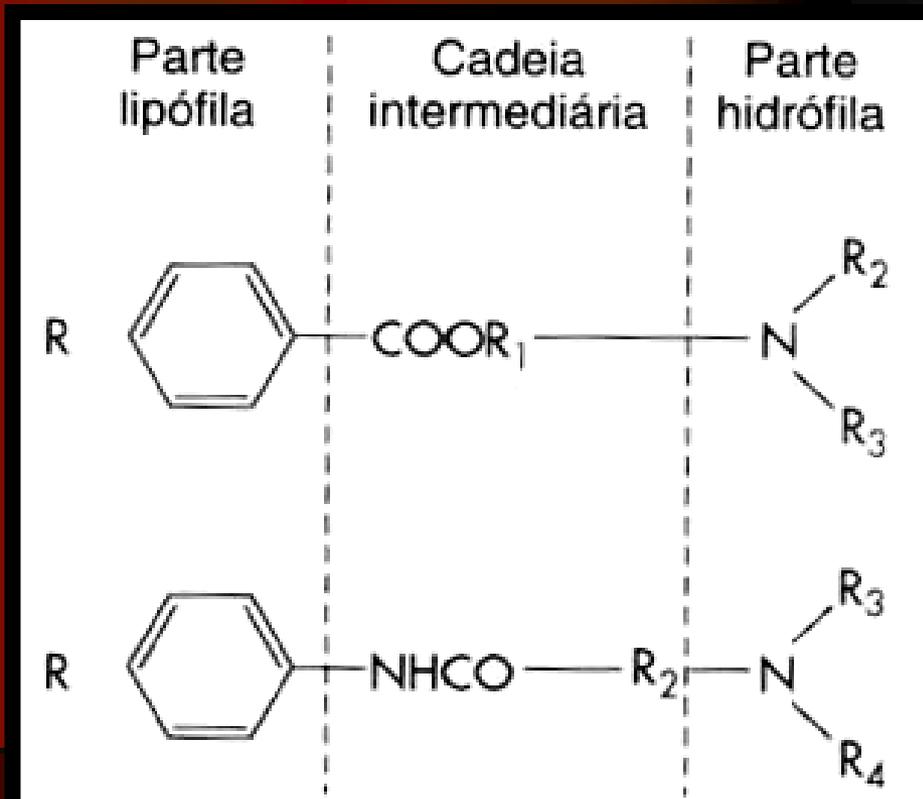
- Anfipáticos

- Benzocaína*

(não adequado para injeção pois não há parte hidrófila)



- ÉSTER / AMIDA



Agente Anestésico

● ÉSTER



Cocaína

Cloroprocaína

Procaína

Propoxicaína

Tetracaína

● AMIDA



Lidocaína

Mepivacaína

Prilocaína

Bupivacaína

Articaína*

*(mista amida –éster)

METABOLIZAÇÃO - ÉSTER

Plasma: Pseudocolinesterase

Processo de hidrólise

*** Produto metabólico: Ácido para amino benzóico (PABA)**

Reações Alérgicas !!!

**1:2800 pseudocolinesterase atípica
(Risco de Toxicidade)**

METABOLIZAÇÃO-AMIDA

Fígado: Sistema microssomal
(*Prilocaína: fígado e pulmões)

Considerações Clínicas-

Risco de Toxicidade:

- pacientes com função hepática deficiente
 - pacientes com fluxo sanguíneo hepático diminuído (ICC)
- *Contra-indicações relativas**

REAÇÕES ALÉRGICAS

- **Hipersensibilidade**
- **Amplo espectro de reações**
- **Imediatas ou tardias**
- **Reações mais comuns: dermatites**
- **Outras: broncoespasmo (crise de asma), anafilaxia.**

“ A introdução de A.L. tipo amida a partir da década de 40, diminui dramaticamente a incidência de reações alérgicas”

(Brown et al., 1990)

Meia Vida (horas)

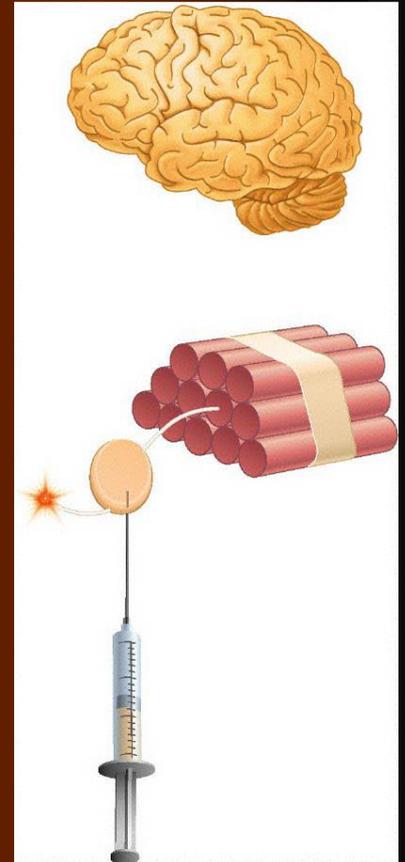
tempo necessário para redução de 50% do nível sanguíneo

➤ Articaína	0,5
➤ Prilocaína	1,6
➤ Lidocaína	1,6
➤ Mepivacaína	1,9
➤ Bupivacaína	3,5

“A velocidade com que o AL é removido do sangue é descrito como meia-vida de eliminação”

AL- Mecanismo de Ação

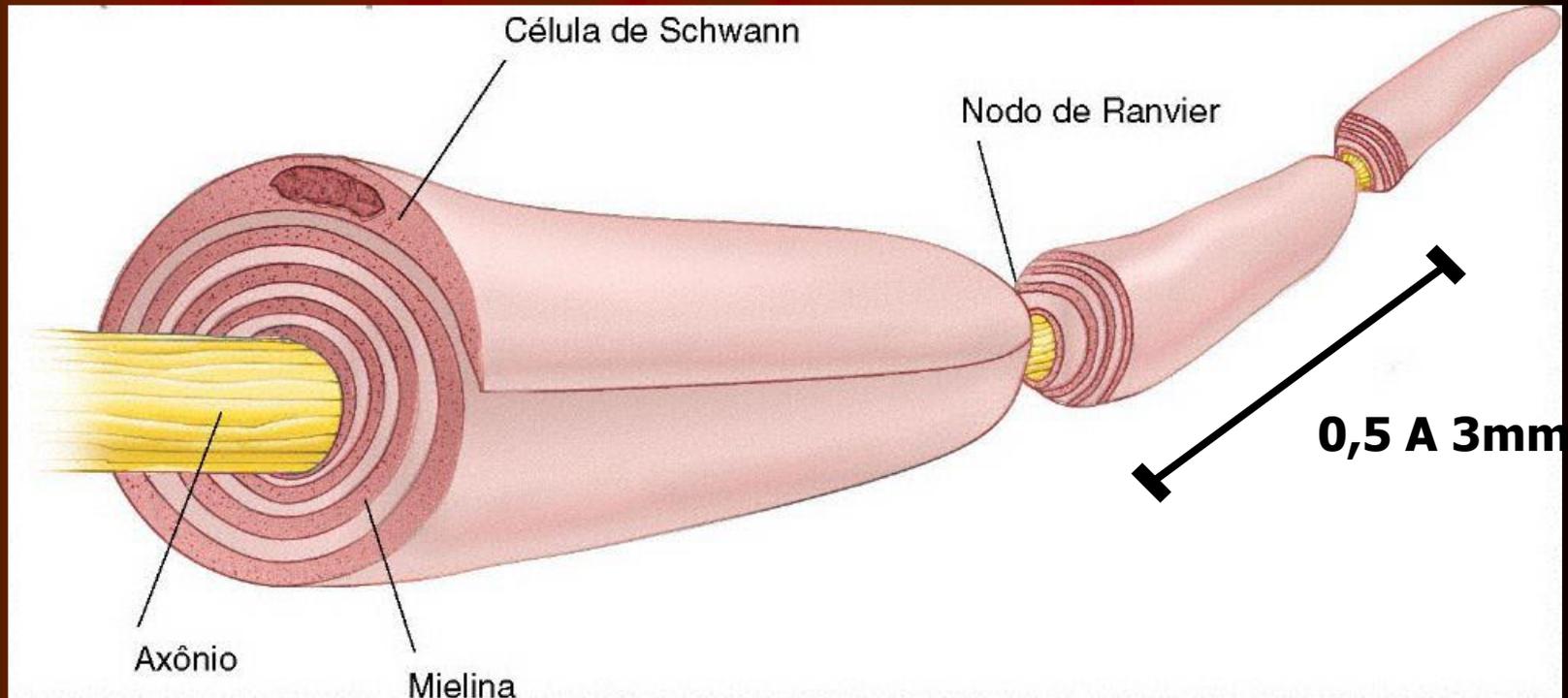
“O Anestésico Local atua na membrana diminuindo a permeabilidade aos íons Na^+ e K^+ , impedindo a despolarização e a condução nervosa”



Condução nervosa

- **Estímulo: elétrico, térmico, químico, mecânico**
- **Permeabilidade**
- **Lei do “Tudo ou nada”**
- **Despolarização: Na^+ e K^+ , DDP**
- **Repolarização**

Impulso: uniforme e autopropagável - SALTATÓRIO



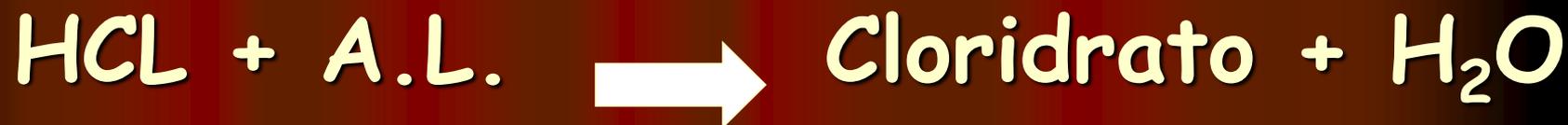
Deposito de A.L. deve atingir Nodos de Ranvier:

“Um mínimo de 8-10mm deve ser coberto pela solução anestésica para assegurar um bloqueio anestésico”

Agente Anestésico

- Bases fracas (Aminas) pouco solúveis

Na fábrica:



Ácido + Base = Sal + Água

pH da solução: $\pm 5,5$

Dissociação dos A.L.

Sal anestésico em solução



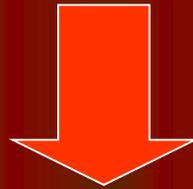
2º – Ligam-se a receptores do canal de Na^+

1º - Difundem-se pela bainha do nervo (LIPOFÍLICAS)

Henderson - Hasselbalch

$$\text{Log} \frac{\text{Base}}{\text{Ácido}} = \text{pH} - \text{pK}_a$$

$$\text{pH} = \text{PK}_a$$

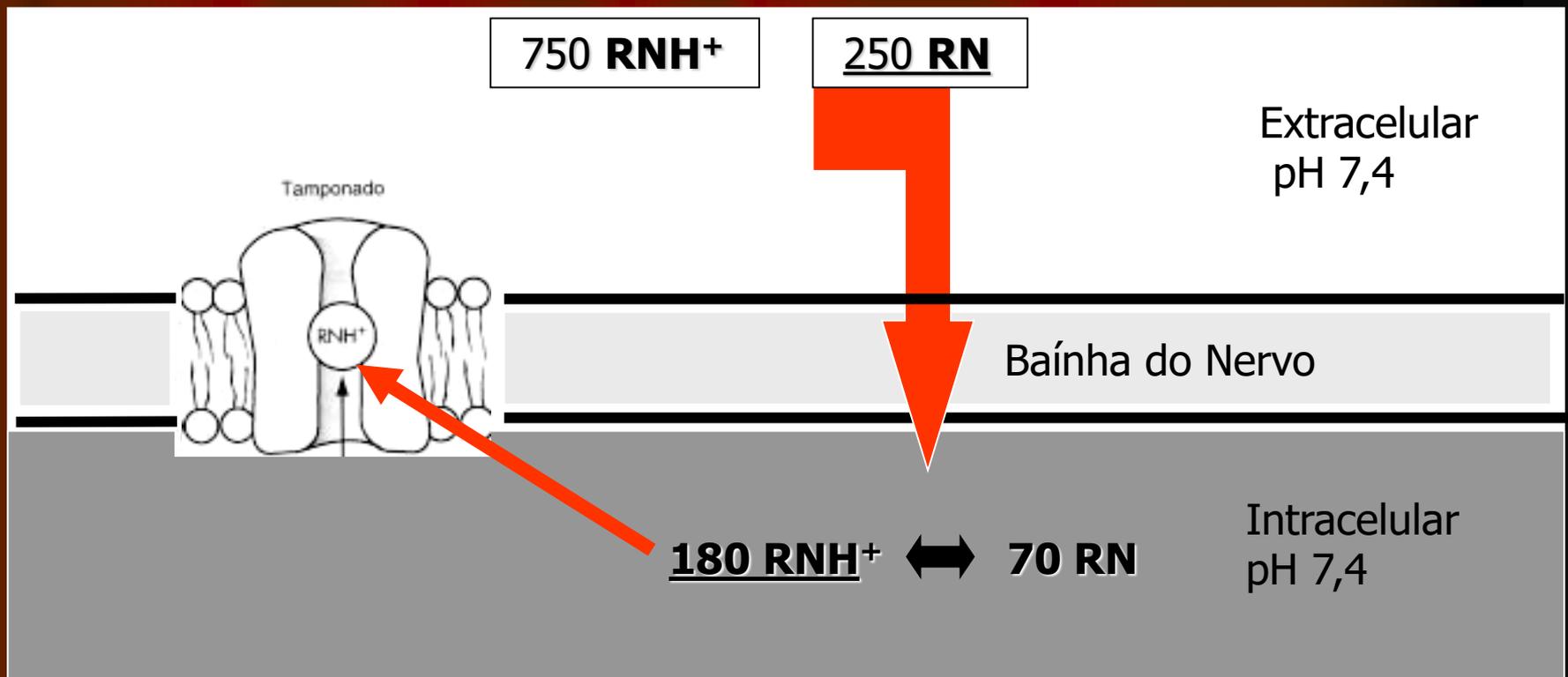


50% RN / 50% RNH⁺

Ação na Membrana Nervosa

pH normal tecidual $\sim 7,4$; pKa Prilocaína = 7,9

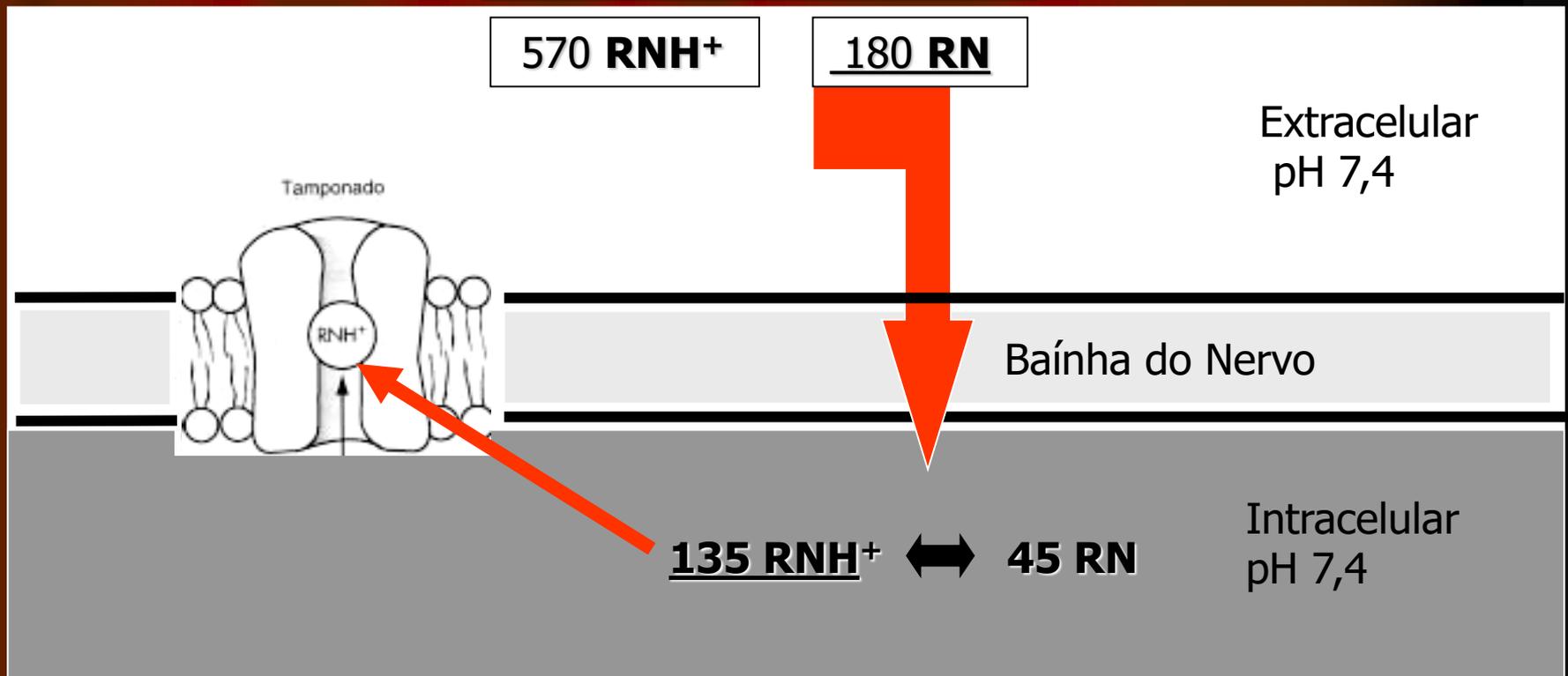
1000 moléculas A.L.



Ação na Membrana Nervosa

pH normal tecidual $\sim 7,4$; pKa Prilocaina = $7,9$

750 moléculas RNH⁺



Influência do pKa

$$\text{Log} \frac{\text{Base}}{\text{Ácido}} = \text{pH} - \text{pK}_a$$

- “Quanto maior o pKa, menos moléculas RN para se difundir pela baínha do nervo”

Consideração Clínica:

- **Maior tempo de latência (indução)**

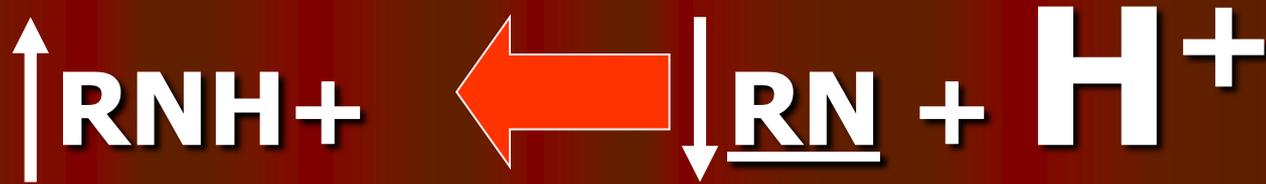
Constante de Dissociação (pK_a)

➤ Mepivacaína	7,7
➤ Lidocaína	7,7
➤ Articaína	7,8
➤ Prilocaína	7,7
➤ Bupivacaína	8,1

TABELA 1-4**Constantes de Dissociação (pK_a) dos Anestésicos Locais**

Agente	pK_a	% Base (RN) em pH 7,4	Início de Ação Aproximado, min
Benzocaína	3,5	100	—
Mepivacaína	7,7	33	2-4
Lidocaína	7,7	29	2-4
Prilocaína	7,7	25	2-4
Articaína	7,8	29	2-4
Etidocaína	7,9	25	2-4
Ropivacaína	8,1	17	2-4
Bupivacaína	8,1	17	5-8
Tetracaína	8,6	7	10-15
Cocaína	8,6	7	—
Cloroprocaína	8,7	6	6-12
Propoxicaína	8,9	4	9-14
Procaína	9,1	2	14-18
Procainamida	9,3	1	—

Influência do pH



- “Quanto menor o pH, menos moléculas RN para se difundir pela bainha do nervo”

Consideração Clínica:

- Maior tempo de latência (indução)
- Menor eficácia // Insucesso da anestesia

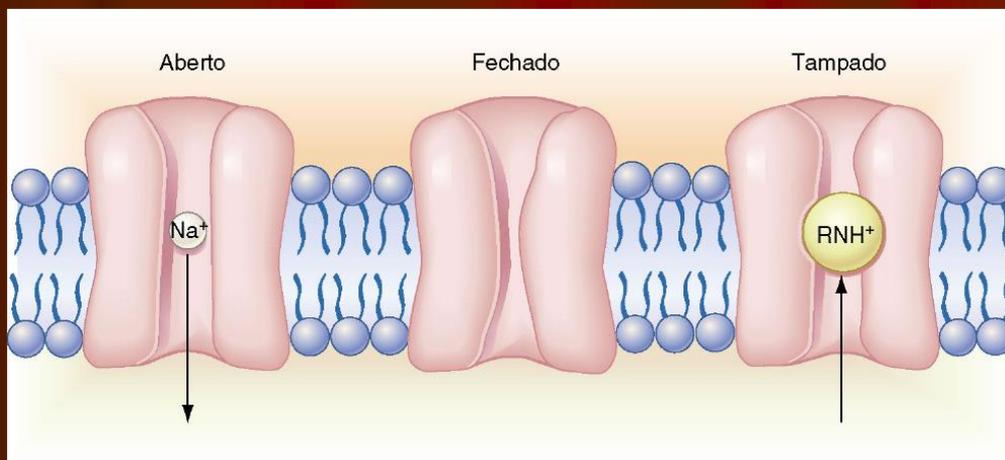
Potência Vasodilatadora Relativa

➤ Prilocaína	0,5
➤ Mepivacaína	0,8
➤ Articaína	1,0
➤ Lidocaína	1,0
➤ Bupivacaína	2,5

Influência na Potência e Duração

Ligação com as proteínas do canal de Na⁺

- Quanto maior a aderência nos receptores mais longa a DURAÇÃO da anestesia



QUADRO 4-1 Duração de Ação Aproximada dos Anestésicos Locais

Curta Duração (Anestesia Pulpar de Aproximadamente 30 Minutos)

Mepivacaína a 3%
Prilocaína a 4% (por infiltração)

Duração Intermediária (Anestesia Pulpar de Aproximadamente 60 Minutos)

Articaína a 4% + adrenalina a 1:100.000
Articaína a 4% + adrenalina a 1:200.000
Lidocaína a 2% + adrenalina a 1:50.000
Lidocaína a 2% + adrenalina a 1:100.000
Mepivacaína a 2% + levonordefrina a 1:20.000
Prilocaína a 4% (somente por bloqueio nervoso)
Prilocaína a 4% + adrenalina a 1:200.000

Longa Duração (Anestesia Pulpar de Mais de 90 Minutos)

Bupivacaína a 0,5% + adrenalina a 1:200.000 (por bloqueio nervoso)

Consideração Clínica

- Ex: BUPIVACAÍNA

TABELA 4-17**Duração da Anestesia Pulpar e de Tecidos Moles dos Anestésicos Locais Disponíveis**

Formulação da Substância	DURAÇÃO (APROXIMADA EM MINUTOS)	
	Polpa Dentária	Tecidos Moles
Mepivacaína a 3% (infiltração)	5-10	90-120
Prilocaína a 4% (infiltração)	10-15	60-120
Prilocaína a 4% (bloqueio nervoso)	40-60	120-240
Articaína a 4% + adrenalina a 1:200.000	45-60	180-240
Lidocaína a 2% + adrenalina a 1:50.000	60	180-300
Lidocaína a 2% + adrenalina a 1:100.000	60	180-300
Mepivacaína a 2% + levonordefrina a 1:20.000	60	180-300
Articaína a 4% + adrenalina a 1:100.000	60-75	180-300
Prilocaína a 4% + adrenalina a 1:200.000	60-90	180-480
Bupivacaína a 0,5% + adrenalina a 1:200.000	> 90	240-720

**AGENTE ANESTÉSICO – CONCENTRAÇÕES
(g / 100ml)**

<u>Concentração</u>	<u>mg / ml</u>	<u>mg por tubete (1,8 ml)</u>
0,5 %	5	9
2 %	20	36
3 %	30	54

Cálculo da dose máxima e nº de tubetes

TABELA 4-4

Doses Máximas Recomendadas (DMRs) de Anestésicos Locais Disponíveis na América do Norte

Anestésico Local	FABRICANTE E FDA (DMR)		
	mg/kg	mg/lb	DMR, mg
Articaína			
Com vasoconstritor	7,0	3,2	Nenhuma citada
Bupivacaína			
Com vasoconstritor	Nenhuma citada	Nenhuma citada	90
Com vasoconstritor (Canadá)	2,0	0,9	90
Lidocaína			
Com vasoconstritor	7,0	3,2	500
Mepivacaína			
Sem vasoconstritor	6,6	3,0	400
Com vasoconstritor	6,6	3,0	400
Prilocaina			
Sem vasoconstritor	8,0	3,6	600
Com vasoconstritor	8,0	3,6	600

Cálculo da dose máxima e nº de tubetes

TABELA 4-4

Doses Máximas Recomendadas (DMRs) de Anestésicos Locais Disponíveis na América do Norte

Anestésico Local	FABRICANTE E FDA (DMR)		
	mg/kg	mg/lb	DMR, mg
Articaína			
Com vasoconstritor	7,0	3,2	Nenhuma citada
Bupivacaína			
Com vasoconstritor	Nenhuma citada	Nenhuma citada	90
Com vasoconstritor (Canadá)	2,0	0,9	90
Lidocaína			
Com vasoconstritor	7,0	3,2	500
Mepivacaína			
Sem vasoconstritor	6,6	3,0	400
Com vasoconstritor	6,6	3,0	400
Prilocaína			
Sem vasoconstritor	8,0	3,6	600
Com vasoconstritor	8,0	3,6	600

QUADRO 4-2 Cálculo da Dose Máxima e do Número de Tubetes (Uma Substância)

Paciente: 22 Anos, Saudável, Mulher, 50 kg

Anestésico Local: Lidocaína + Adrenalina a 1:100.000

Lidocaína 2% = 36 mg/tubete

Lidocaína: 7,0 mg/kg = 350 mg (DMR)

Número de tubetes: $350/36 =$ aproximadamente $9\frac{3}{4}$

Paciente: 40 Anos, Saudável, Homem, 90 kg

Anestésico Local: Articaína + Adrenalina a 1:200.000

Articaína 4% = 72 mg/tubete

Articaína: 7,0 mg/kg = 630 mg (DMR)

Número de tubetes: $630/72 =$ aproximadamente 9,0

Paciente: 6 Anos, Saudável, Homem, 20 kg

Anestésico Local: Mepivacaína, sem Vasoconstritor

Mepivacaína 3% = 54 mg/tubete

Mepivacaína: 6,6 mg/kg = 132 mg (DMR)

Número de tubetes: $132/54 =$ aproximadamente 2,5

DMR, Dose máxima recomendada.

Classificação do estado de saúde Associação Americana de Anestesiologistas

- **ASA I:** pessoas saudáveis, sem doenças crônicas ou graves e que não adotam comportamentos de risco, como fumar e consumir álcool em excesso
- **ASA II:** indivíduos com patologias sistêmicas leves a moderadas
- **ASA III:** doença sistêmica grave, que envolve limitações, porém não incapacita o paciente
- **ASA IV:** patologia grave e incapacitante
- **ASA V:** paciente que, provavelmente, não sobreviverá por mais de 24 horas
- **ASA VI:** pessoa que teve morte encefálica, e terá os órgãos retirados para doação

