



# **ANESTÉSICOS LOCAIS**

---

Ufac

Farmacologia

Prof Renaldo Moreno



# Anestésicos Locais - Conceito

---

- São drogas que produzem bloqueio reversível da condução de impulsos ao longo das vias nervosas centrais e periféricas.
- Desaparecem as diversas formas de sensibilidade e a atividade motora da área em que se distribui o nervo.
- Cocaína: **primeiro anestésico local**, extraído de folhas de *Erythroxylon coca*, isolado em 1860, por Albert Niemann.



# Anestésicos Locais – Vias de administração

---

- Tópica
- Infiltração
- Bloqueio de Nervo
- Regional intravenosa
- Raquidiana
- Peridural



# Anestésicos Locais – Mecanismo de Ação

---

- Evitam a geração e a condução do impulso nervoso.
- Local primário de ação na membrana celular;
- Bloqueiam a condução por reduzir ou evitar a permeabilidade ao  $\text{Na}^+$ .



# Anestésicos Locais – Bloqueio Diferencial

---

- As funções dos nervos periféricos não são afetadas da mesma forma:
- Primeiro, há perda da função simpática; segue-se: perda da sensação térmica;
- Perda da sensação de pontadas, toque, e pressão profunda;
- Por último, da função motora.



# Anestésicos Locais – Farmacocinética

---

- São bases fracas;
- A acidose no ambiente em que a solução do anestésico local é injetada (inflamação e infecção) faz com que o mesmo não atinja o efeito ideal;
- Absorção depende:
  1. Local da injeção;
  2. Dose total administrada;
  3. Associação ou não de vaso-constritor;
  4. Propriedades da droga.

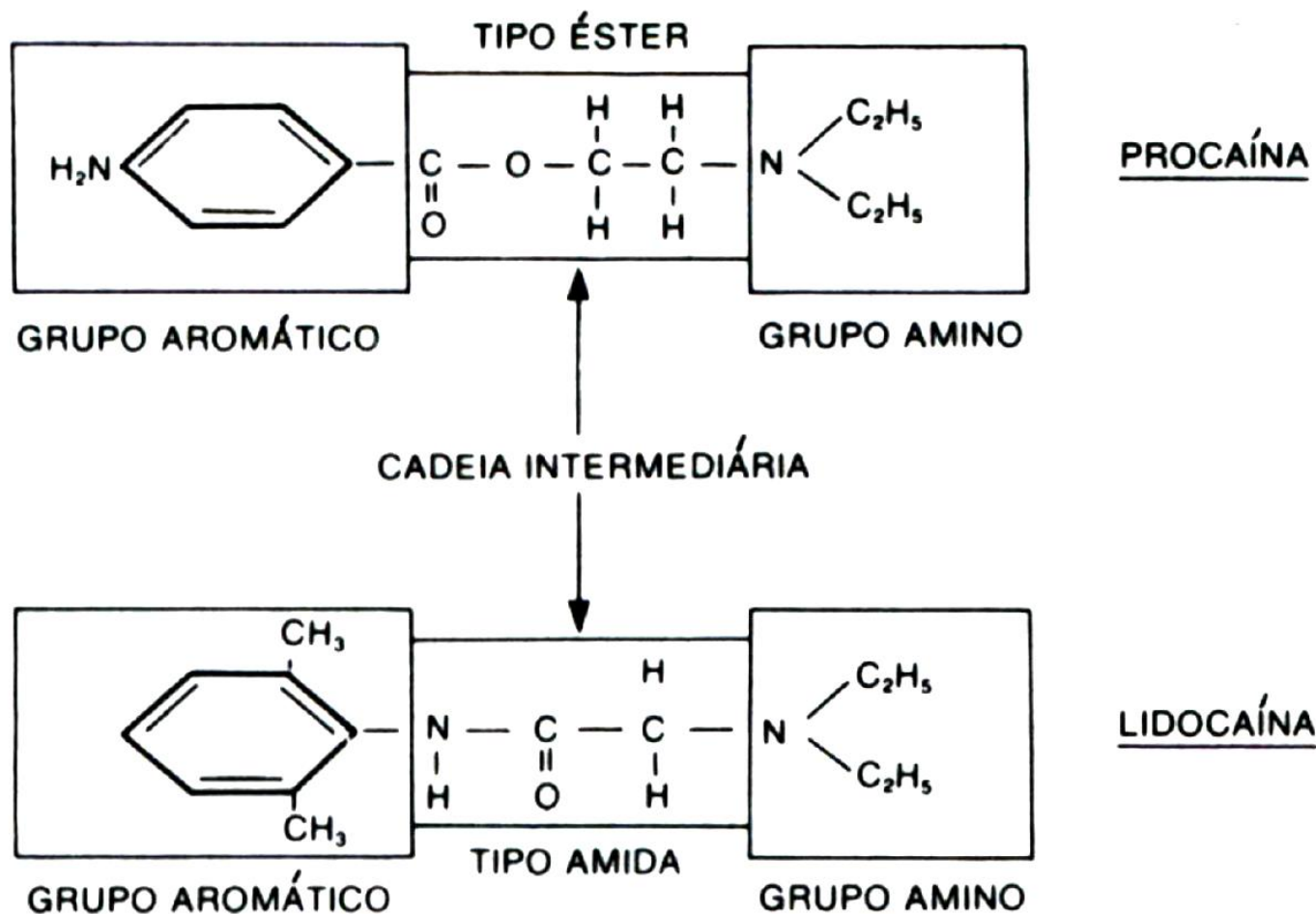


# Anestésicos Locais – Classificação

---

- Ésteres (ligação éster  $\text{-CO-}$  )
- Amidas (ligação amida  $\text{-NHC}$  )
- As diferenças se relacionam com o sítio de metabolismo e o potencial para produção de reações alérgicas.
- Ésteres. Exemplos: procaína, cloroprocaína e tetracaína. Mais alérgenos.
- Amidas. Exemplos: lidocaína, bupivacaína, ropivacaína e prilocaína. Menos ou não-alérgenos.

# Anestésicos Locais – Classificação - estrutura







# Anestésicos Locais – Metabolismo

---

- Ésteres: enzima colinesterase plasmática;
- Amidas: hepático.



# Anestésicos Locais – principais.

---

- Lidocaína:
- Toxicidade: sonolência, zumbidos, tonturas, contrações, convulsões, coma, parada cardio-respiratória (PCR).
- Uso clínico: anestésico local e antiarrítmico.



# Anestésicos Locais – principais.

---

- Bupivacaína:
- Toxicidade: é mais cardiotoxíco; depressão miocárdica grave, se IV; Uso clínico: anestésico local.



# Anestésicos Locais – principais.

---

- Procaína:
- Primeiro anestésico local sintético; trata-se de um éster;
- Uso restrito à anestesia infiltrativa;
- Potência baixa, início lento e curta duração.



# Anestésicos Locais – principais.

---

- Ropivacaína:
- Semelhante à Bupivacaína (anestesia prolongada), com menor cardiotoxicidade;
- Menor bloqueio motor.

# Anestésicos Locais – principais.

CARACTERÍSTICAS	ÉSTERES <ul style="list-style-type: none"> <li>• <i>Procaína</i></li> <li>• <i>Cloroprocaína</i></li> <li>• <i>Tetracaína</i></li> <li>• <i>Cocaína</i></li> </ul>	AMIDAS <ul style="list-style-type: none"> <li>• <i>Lidocaína</i></li> <li>• <i>Bupivacaína</i></li> <li>• <i>Ropivacaína</i></li> <li>• <i>Mepivacaína</i></li> <li>• <i>Prilocaina</i></li> </ul>
Biotransformação	Rápida pela colinesterase plasmática	Lenta, hepática
Toxicidade sistêmica	Pouco provável	Mais provável
Reações alérgicas	Possível – forma derivados do PABA	Muito rara
Estabilidade em solução	Hidrolisa em ampolas (calor, sol)	Muito estável quimicamente
Início de ação	Lenta como regra geral	Moderada à rápida
pK <sub>a</sub>	Maior do que o pH fisiológico (8,5-8,9)	Próximo do pH fisiológico (7,6-8,1)

FÁRMACO	POTÊNCIA	INÍCIO	DURAÇÃO
<i>Procaína</i>	Baixa	Rápido	Curta
<i>Cloroprocaína</i>	Baixa	Rápido	Curta
<i>Tetracaína</i>	Alta	Lento	Longa (espinal)
<i>Lidocaína</i>	Baixa	Rápido	Intermediária
<i>Mepivacaína</i>	Baixa	Moderado	Intermediária
<i>Bupivacaína</i>	Alta	Lento	Longa
<i>Ropivacaína</i>	Alta	Moderado	Longa

Resumo das propriedades farmacológicas de alguns anestésicos locais.

PABA: ácido paraminobenzoico.



# Anestésicos Locais – Uso clínico.

---

- **Anestesia Tópica.** Principalmente em mucosas do nariz, olhos, boca, garganta, árvore brônquica, esôfago, e trato geniturinário. Também pode ser aplicada na pele.
- Apresentação: soluções aquosas e géis.
- Anestésicos mais usados: tetracaína, lidocaína e prilocaína.
- Pico de ação: 2 a 8 minutos; duração: 30 a 45 min. Dose máxima para adultos: 500mg para lidocaína e 50mg para tetracaína.



# Anestésicos Locais – Uso clínico.

---

- **Anestesia por infiltração.** Consiste na injeção do anestésico diretamente no tecido sem levar em consideração o curso ou trajeto dos nervos;
- Se adicionar adrenalina, a duração pode dobrar;
- Não se deve usar anestésicos com adrenalina em infiltrações de extremidades.
- Anestésicos mais usados: lidocaína, bupivacaína e procaína;





# Anestésicos Locais – Uso clínico.

---

- **Anestesia por infiltração.**
- Doses tóxicas sem adrenalina: lidocaína (4mg/kg); bupivacaína (2mg/kg); procaína (7mg/kg).
- Com adrenalina: a dose pode ser aumentada em um terço.

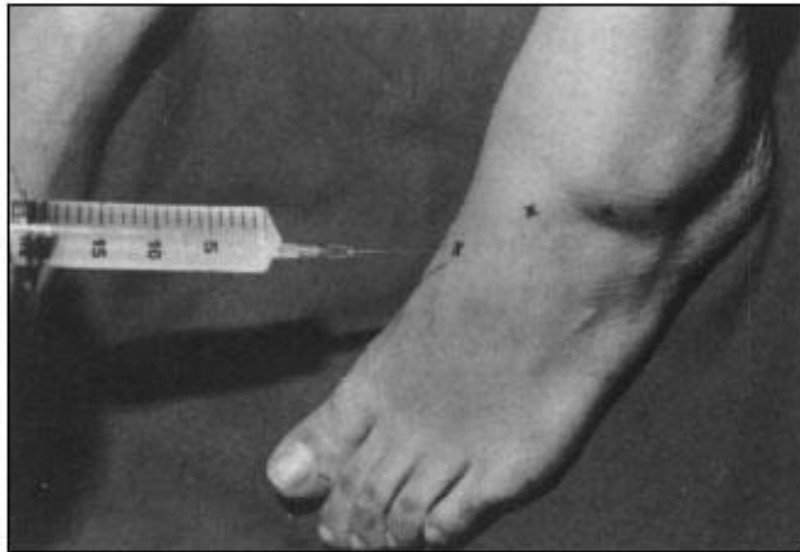


# Anestésicos Locais – Uso clínico.

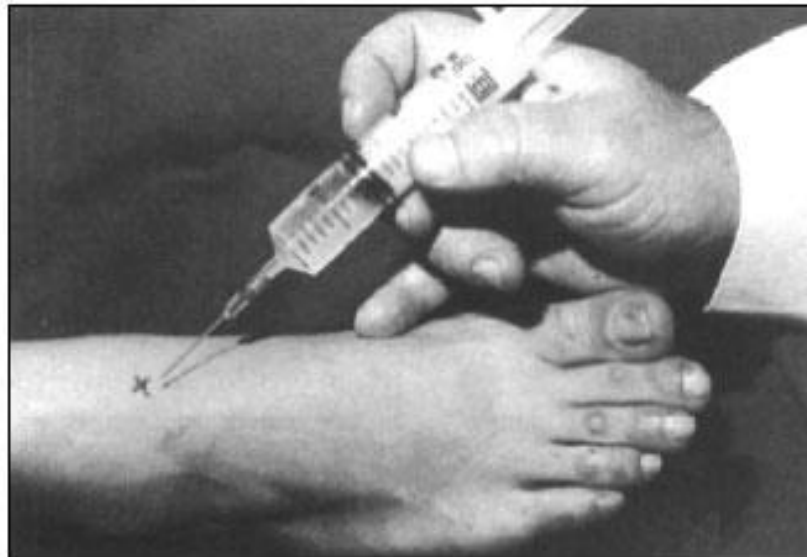
---

- **Anestesia por bloqueio de nervo.**  
Consiste em bloquear dentro ou ao redor dos nervos periféricos;
- Anestésicos mais usados: lidocaína, bupivacaína, ropivacaína; procaína.
- Duração de ação. Procaína: 20 a 45 min; lidocaína: 60 a 120 min; bupivacaína: 400 a 450 min.

# Anestesia por bloqueio de nervo



*Fig. 6 – Bloqueio do nervo fibular profundo no dorso do pé*



*Fig. 5 – Bloqueio do nervo fibular profundo ao nível do tornozelo*



# Anestésicos Locais – Uso clínico.

---

- **Anestesia regional intravenosa.**
- Utiliza-se a vasculatura para levar a solução anestésica para as terminações nervosas.
- Anestésico mais usado: lidocaína sem vasoconstritor. 40 a 50 ml.

# Anestésicos Locais – Uso clínico.

- **Anestesia regional intravenosa.**





# Anestésicos Locais – Uso clínico.

---

- **Raquianestesia.** Consiste na injeção de anestésico local no líquido (LCR), no espaço subaracnoídeo, intervertebral – L2;
- Os principais efeitos adversos decorrem do bloqueio simpático produzido pelos anestésicos;
- Complicações: infecção; hematoma; cefaléia postural; seqüelas neurológicas.

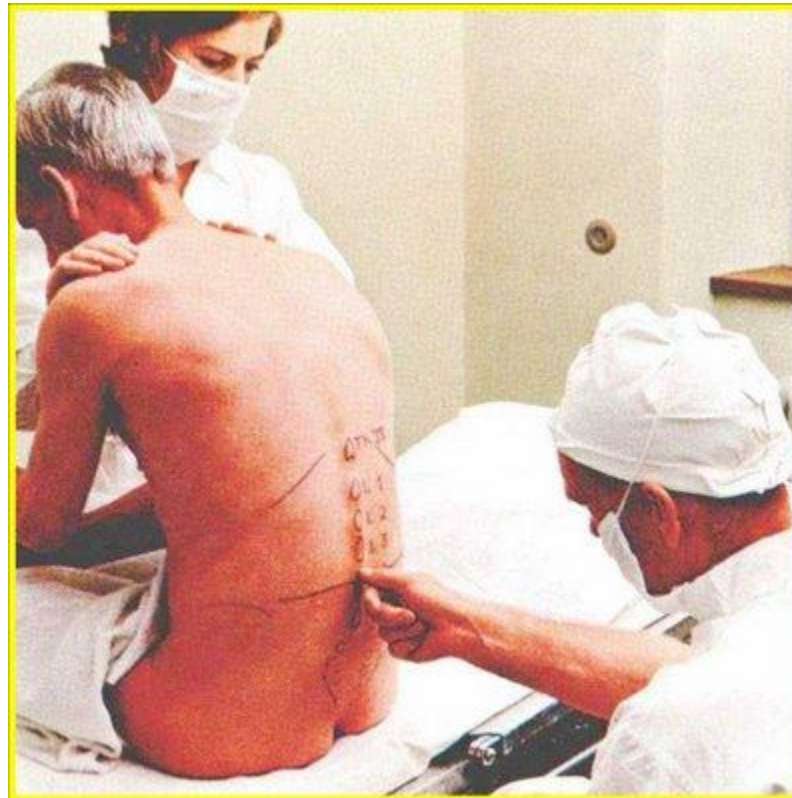
# Anestésicos Locais – Uso clínico.

- **Raquianestesia.**



# Anestésicos Locais – Uso clínico.

- **Raquianestesia.**







# Anestésicos Locais – Uso clínico.

---

- **Anestesia peridural.** Consiste na injeção de anestésico local no espaço peridural ou epidural;
- Não há perfuração das meninges;
- Pode ser utilizado um cateter: peridural contínua.
- Anestésicos mais utilizados: bupivacaína; lidocaína; opióides.

# Anestésicos Locais – Uso clínico.

- **Anestesia peridural**

