



FARMACOLOGIA DOS ANESTÉSICOS LOCAIS E VASOCONSTRITORES EM CONCURSOS PARA CIRURGIÕES DENTISTAS



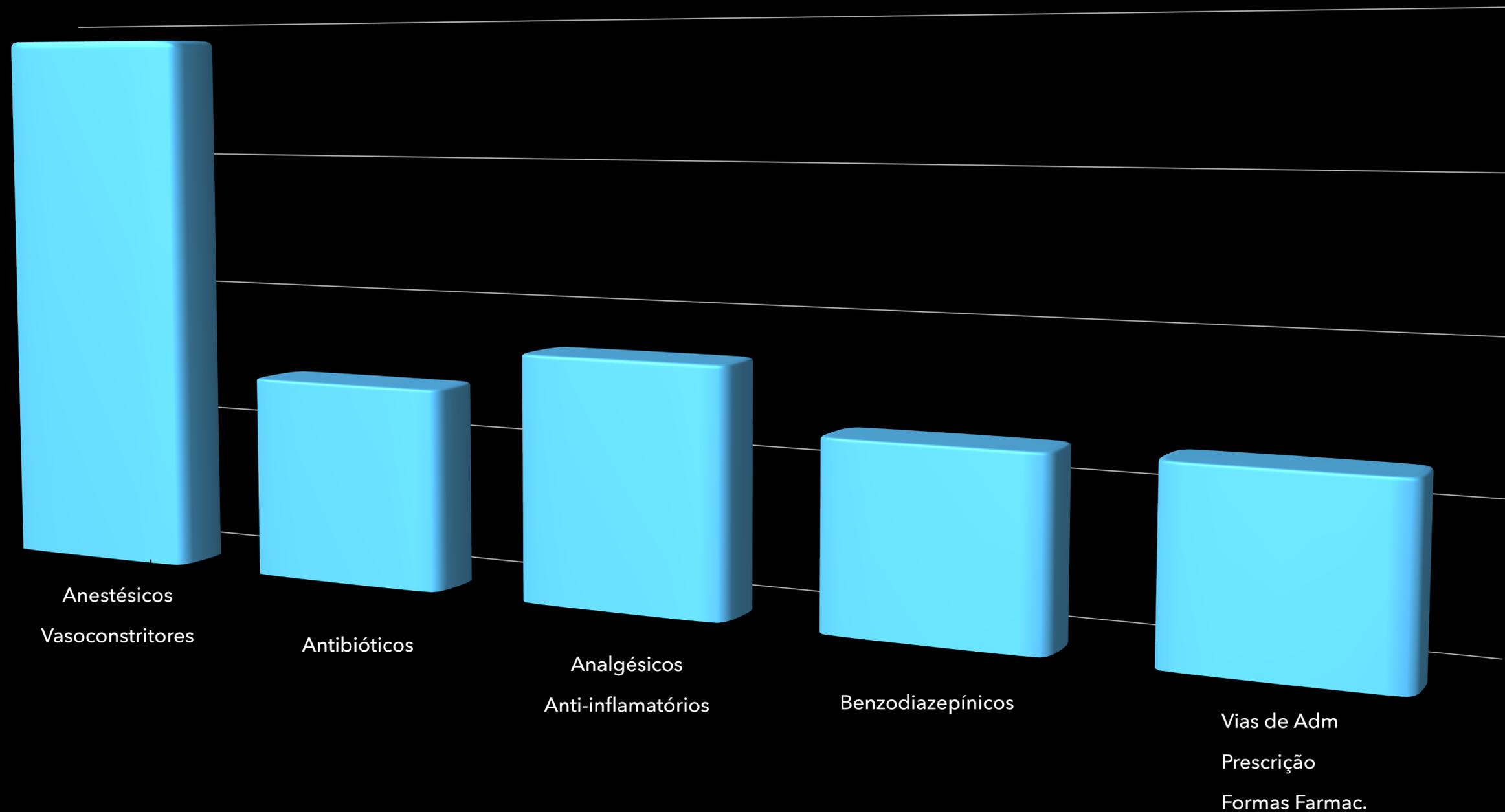
Prof. Dr. Renan Baldaia

Esp./ M.Sc. / Ph.D



@RenanBaldaia

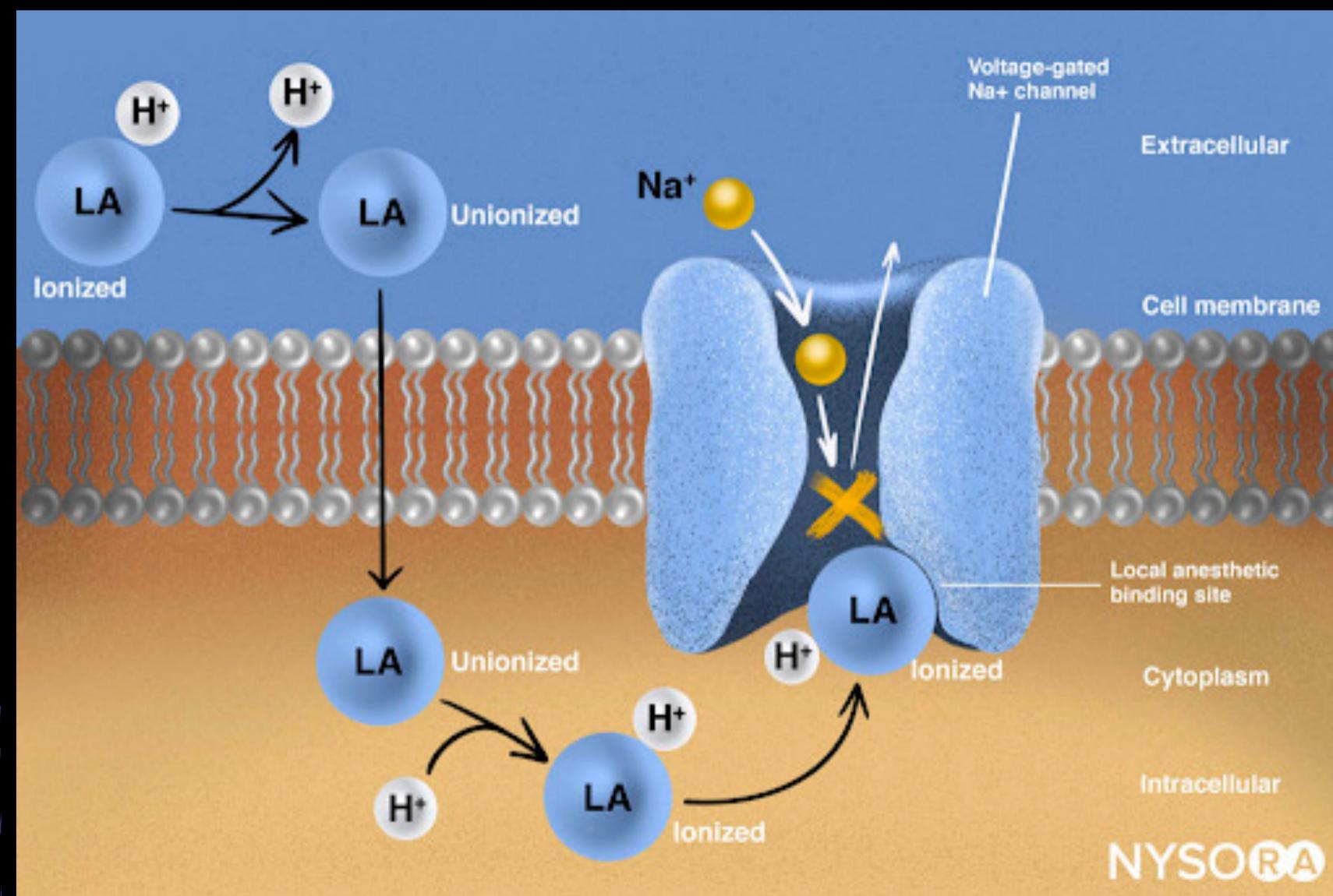
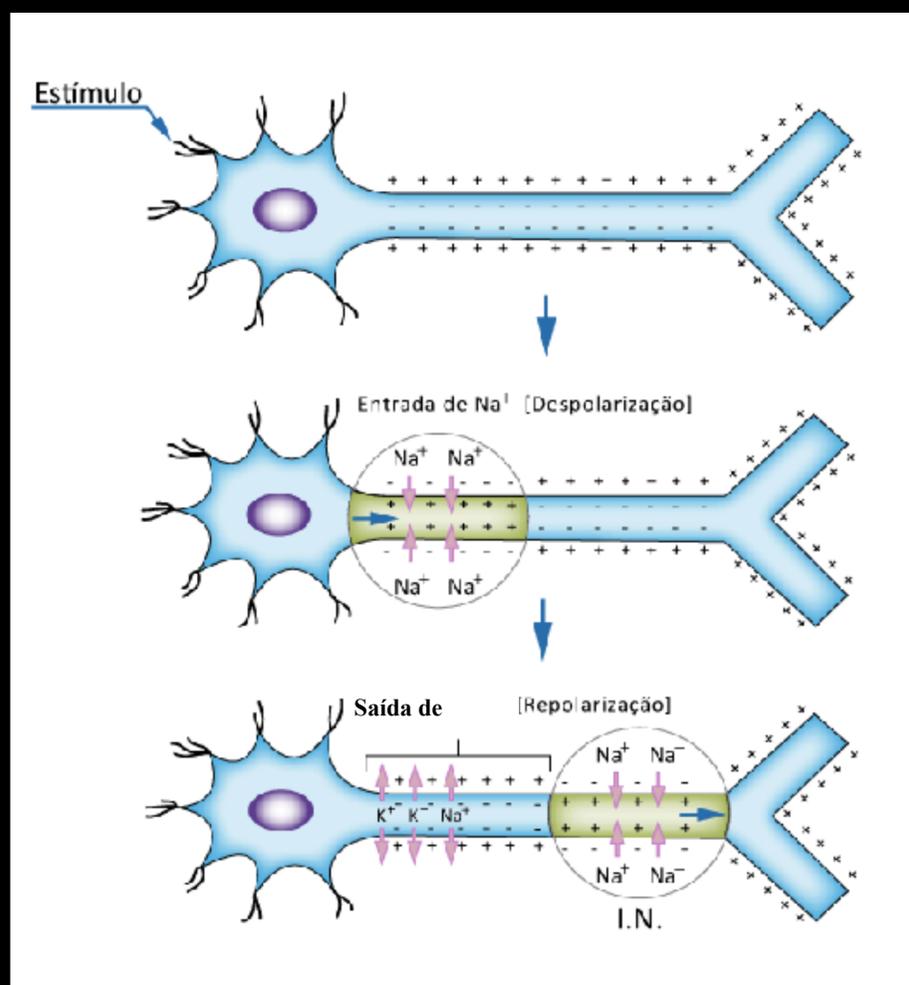
ASSUNTOS MAIS COBRADOS NAS ÚLTIMAS BANCAS VUNESP



Características ideais dos anestésicos locais

- ▶ Baixa toxicidade sistêmica - Biotransformação (tec. cardíaco e nervoso);
- ▶ Não causar lesão permanente às estruturas nervosas;
- ▶ Possuir ação reversível;
- ▶ Não ser irritante aos tecidos;
- ▶ Tempo de início de ação mais curto;
- ▶ Não causar reações de hipersensibilidade;
- ▶ Ser estável em solução.

Mecanismo de ação dos anestésicos locais



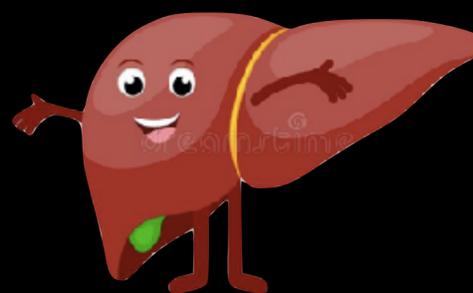
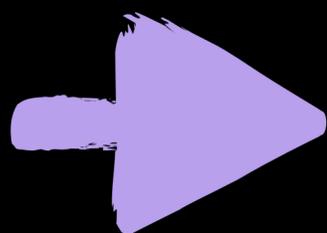
Os anestésicos locais tem como mecanismo de ação o bloqueio dos canais de sódio, impedindo a despolarização neuronal (pela ordem: autonômica, térmica, dolorosa, tátil, pressão e motora).

Metabolização e Eliminação dos Anestésicos Locais

- ✓ Lidocaína
- ✓ Mepivacaína
- ✓ Bupivacaína
- ✓ Prilocaína
- ✓ Articaína*
- ✓ Ropivacaína
- ✓ Dibucaína

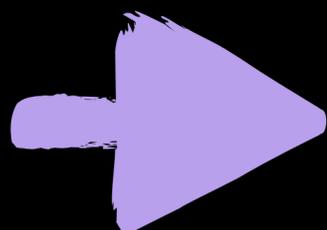
- ✓ Benzocaína
- ✓ Butacaína
- ✓ Tetracaína
- ✓ Procaína
- ✓ Cocaína
- ✓ Cloroprocaína
- ✓ Propoxicaína

Amidas



Citocromo P450

Ésteres



Pseudocolinesterases plasmáticas

Mais alérgenos

A eliminação dos anestésicos locais é por via renal

12.(IBAMSP – Santos – SP/ 2022) Assinale a alternativa que apresenta apenas anestésicos locais do tipo ésteres.

- (A) Benzocaína, tetracaína e procaína
- (B) Lidocaína, mepivacaína e prilocaína.
- (C) Propoxicaína, mepivacaína e ropivacaina.
- (D) Prilocaína, procaína e tetracaína.

RISCO PARA PACIENTES GESTANTES

RISCO A



Estudos controlados em mulheres e animais não revelam riscos.

RISCO B



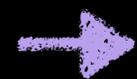
Estudos em animais não foram encontrados riscos, mas não há estudos adequados em mulheres.

RISCO C



Estudos em animais ocorreram alguns efeitos colaterais no feto, mas não há estudos em mulheres.

RISCO D



Há evidência de risco em fetos humanos. Só usar se o benefício justificar o risco.

RISCO X



Estudos revelam anormalidades no feto. Os riscos são superiores aos benefícios. Não usar em hipótese alguma.

ANESTÉSICO	Risco para gestante (FDA)
Lidocaína	B
Prilocaina	B*
Bupivacaína	C
Mepivacaína	C
Articaína	C

8.(INSTITUTO ZAMBINI - Diadema-SP/2015) A escolha da solução anestésica local no tratamento odontológico de pacientes grávidas ainda é assunto unto que gera controvérsias. Pelo menos num aspecto a opinião parece ser quase unânime: a solução anestésica local deve ser aquela que proporcione a melhor anestesia à gestante. Assim analisando os riscos envolvidos, qual seria o anestésico, abaixo de primeira escolha em grávidas?

- (A) Prilocaina.
- (B) Mepivacaina.
- (C) Lidocaina
- (D) Bupivacaina

INFLUÊNCIA DO PKA EM ANESTESIA LOCAL

PKA = CONSTANTE DE DISSOCIAÇÃO

“PKA é o pH onde o fármaco se encontra 50% ionizado e 50% não ionizado”

pH Fisiológico: 7,4

PKA Bupivacaína = 8,1	➔	~17 % da droga está na forma não-ionizada
PKA Lidocaína = 7,7	➔	~29 % da droga está na forma não-ionizada
PKA Prilocaína = 7,7	➔	~25 % da droga está na forma não-ionizada
PKA Articaína = 7,8	➔	~29 % da droga está na forma não-ionizada
PKA Mepivacaína = 7,7	➔	~33 % da droga está na forma não-ionizada

ISSO EXPLICA PORQUE A BUPIVACAÍNA TEM MAIOR TEMPO DE LATÊNCIA ENTRE OS ANESTÉSICOS LOCAIS

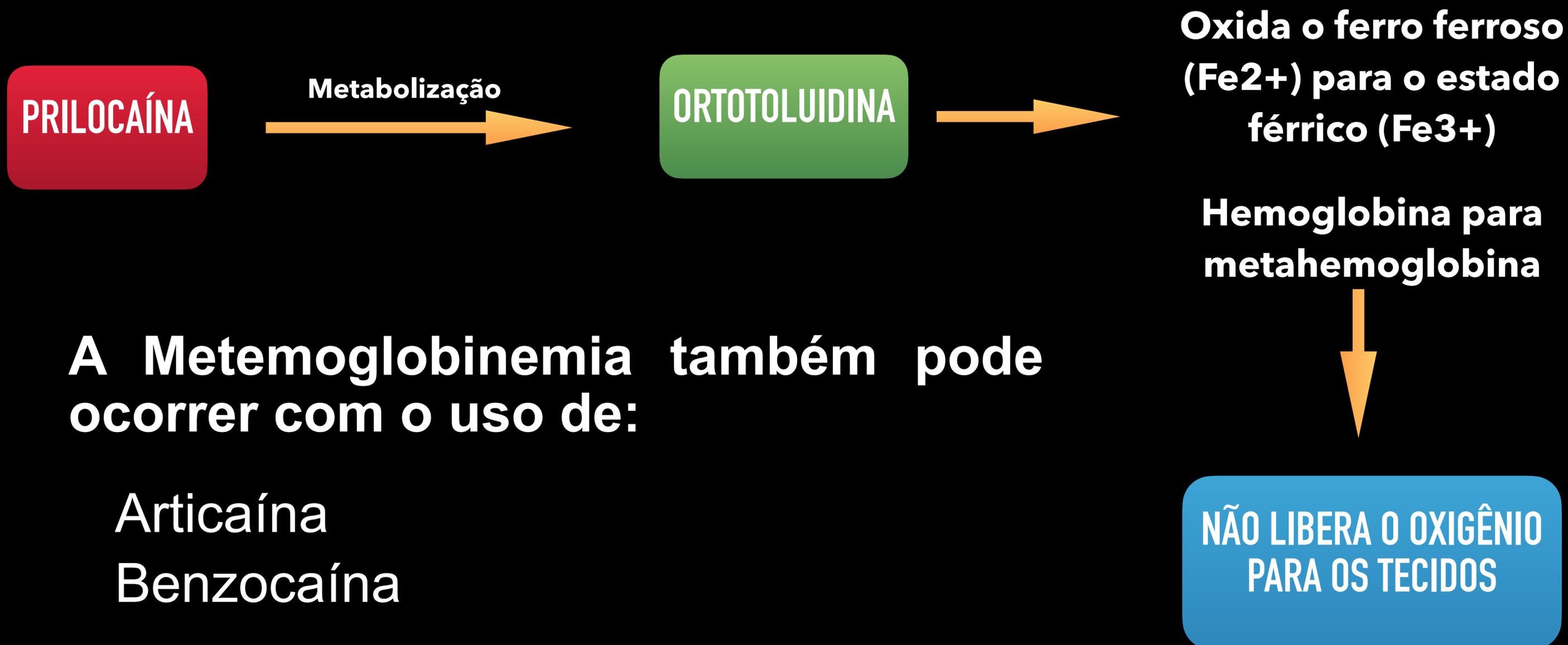
Tabela 1.4		Constantes de dissociação dos anestésicos locais.	
Agente	pK _a	Início de ação aproximado (minutos)	
Benzocaína	3,5	-	
Mepivacaína	7,7	2 a 4	
Lidocaína	7,7	2 a 4	
Prilocaina	7,7	2 a 4	
Articaína	7,8	2 a 4	
Etidocaína	7,9	2 a 4	
Ropivacaína	8,1	2 a 4	
Bupivacaína	8,1	5 a 8	
Tetracaína	8,6	10 a 15	
Cocaína	8,6	-	
Clorprocaína	8,7	6 a 12	
Propoxicaína	8,9	9 a 14	
Procaína	9,1	14 a 18	

Agente	Configuração química			Lógicas	
	Aromática (lipofílica)	Cadeia intermediária	Amina (hidrófila)	Ligação proteica	Duração
Ésteres					
Procaína				5	Curta
Clorprocaína				ND	Curta
Tetracaína				85	Longa
Amidas					
Mepivacaína				75	Moderada
Prilocaina				55	Moderada
Lidocaína				65	Moderada
Ropivacaína				94	Longa
Bupivacaína				95	Longa
Etidocaína				94	Longa

4.(VUNESP – Jundiaí – SP/ 2022) Em relação aos fatores que afetam a ação dos anestésicos locais, assinale a alternativa correta.

- (A) Quanto menor a concentração inicial do anestésico local, mais rápida é a difusão de suas moléculas e mais rápido é o seu início de ação.
- (B) Os anestésicos locais com menor solubilidade nos lipídeos produzem bloqueio de condução mais eficaz em concentrações mais baixas do que os anestésicos locais mais lipossolúveis.
- (C) As drogas com constante de dissociação (pK_a) mais baixo possuem início de ação mais rápido do que aquelas com pK_a mais alto.
- (D) Quanto menor o grau de ligação proteica da molécula de anestésico local à membrana do nervo, maior é a duração da atividade clínica do anestésico.
- (E) A infiltração de anestésicos locais com maiores propriedades vasodilatadoras proporciona uma anestesia de duração mais longa, bem como aumento da potência da droga.

ANESTÉSICOS LOCAIS E METEMOGLOBINEMIA



7.(INSTITUTO ZAMBINI - Itatiba-SP: Pacientes Especiais/2019) A Metemoglobinemia do feto pode ser definida como uma alteração hematológica em que a hemoglobina é oxidada formando a metemoglobina impedindo a molécula de transportar oxigênio. Qual anestésico deve ser evitado em quantidades excessivas em pacientes gestantes a fim de se evitar a metemoglobinemia?

(A)Bupivacaína

(B)Prilocaina

(C)Lidocaína

(D)Mepiacaína

11.(RBO - Fundação de Saúde Pública de São Sebastião-SP/2020) Assinale a alternativa que apresenta um anestésico que deve ser evitado em gestantes, por apresentar risco de metahemoglobinemia, tanto na mãe quanto no feto

- (A) Felipressina
- (B) Articaína
- (C) Lidocaína
- (D) Bupivacaina

3.(VUNESP – PM – CE/ 2022) Várias complicações estão associadas à administração de anestésicos locais. Elas podem ser divididas em locais ou sistêmicas. Assinale a alternativa que apresenta uma das complicações locais e uma medida de prevenção para minimizar o risco da sua ocorrência.

- (A)Fratura de agulha – uso de agulhas calibre 30 para bloqueio de nervo alveolar inferior em adultos ou crianças.
- (B)Dor à injeção – uso de anestésico de baixo pH.
- (C)Superdosagem – uso de dose adequada ao peso do paciente.
- (D)Lesão de tecido mole – seleção de anestésico de duração apropriada para procedimentos rápidos.
- (E)Infecção – injeção lenta da solução anestésica.

Todo anestésico local de uso clínico utilizado em odontologia promove vasodilatação, alguns mais, como a lidocaína e a bupivacaína, outros menos, como a mepivacaína.

Sem vasoconstritor



- ✓ Maior absorção do AL para o SCV;
- ✓ Maior risco de toxicidade do AL;
- ✓ Diminuição do tempo de anestesia;
- ✓ Aumento de sangramento.



Com vasoconstritor

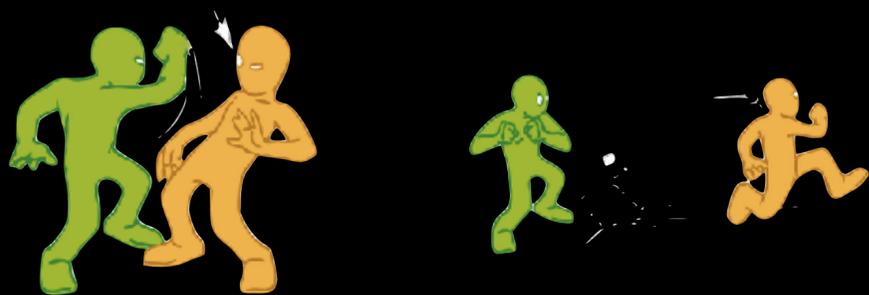
- ✓ Abs. mais lenta do AL para o SCV;
- ✓ Menor risco de toxicidade do AL;
- ✓ Aumento do tempo de anestesia;
- ✓ Isquemia local com hemostasia.

Tipos de Vasoconstritores

Adrenérgicos

Simpatomiméticos

- ✓ Epinefrina (adrenalina);
- ✓ Norepinefrina (noradrenalina);
- ✓ Corbadrina (levonordefrina);
- ✓ Fenilefrina.



**Mimetizam os efeitos do SNA simpático
(Necessitam do sulfito)**

Não adrenérgico

Hormonal

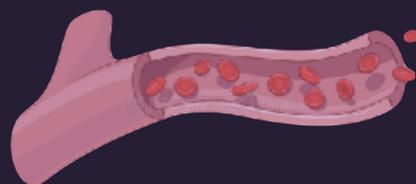
- ✓ Felipressina (octapressin)

**Mimetiza os efeitos do
hormônio vasopressina
(ADH)**

Mais seguro para pacientes que
apresentam contra-indicação aos
vasoconstritores adrenérgicos

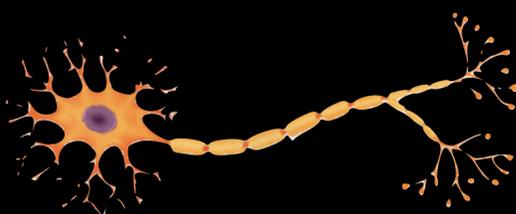
Receptores adrenérgicos

α -1



Vasoconstrição

α -2



Redução da liberação de Nora. endógena

β -1

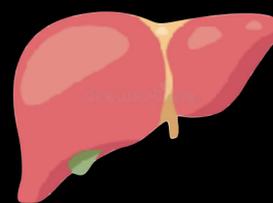
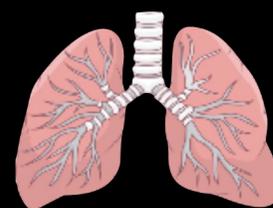


Aumento da freq. card. / Aumento da força de cont.



Aumento da PA

β -2



Vasodilatação / Broncodilação / Glicogenólise

Fármaco	α_1	α_2	β_1	β_2
Epinefrina	+++	+++	+++	+++
Norepinefrina	++	++	++	+

5.(VUNESP - Piracicaba-SP: Plantonista/2022) Vasoconstritor amina simpatomimética do tipo catecolamina, usado com frequência para prevenir ou minimizar a perda de sangue (hemostasia) durante procedimentos cirúrgicos. Atua diretamente nos receptores α e β adrenérgicos; os efeitos β predominam. Uma vez cessada a vasoconstrição α -induzida, produz um claro efeito β de rebote, levando a um aumento da perda de sangue pós-operatória. A descrição refere-se a

(A) felipressina.

(B) fenilefrina.

(C) mefentermina.

(D) efedrina.

(E) adrenalina.

10.(RBO – Monte Mor-SP/2019) Assinale a alternativa que apresenta um vasoconstritor que atua nos receptores alfa e beta, com predomínio de seus efeitos no beta, que ao estimular os receptores beta 1 do miocárdio, ocorre o efeito positivo inotrópico (força de contração) e cronotrópico (frequência de contração), com consequente aumento do débito cardíaco e frequência cardíaca.

(A)Noradrenalina.

(B)Epinefrina.

(C)Levonordefrina.

(D)Prilocaína.

Contra-indicações vasoconstritores adrenérgicos

- ✓ P.A. acima de 160 (sistólica) e 100 (diastólica);
- ✓ Histórico de IAM, sem liberação do cardiologista;
- ✓ AVE a menos de 6 meses;
- ✓ Submetidos a cirurgia de ponte de artéria coronária ou colocação de stents a menos de 3 meses;
- ✓ Angina instável;
- ✓ Arritmias cardíacas;
- ✓ ICC não tratada ou não controlada;
- ✓ Hipertireoidismo não tratado ou não controlado;
- ✓ Feocromocitoma;

Contra-indicações vasoconstritores adrenérgicos

- ✓ Diabéticos não tratado ou não controlado*;
- ✓ História de alergia a sulfitos (maior prevalência em asmáticos);
- ✓ Uso contínuo de anorexígenos derivados anfetamínicos (anfepromona, femproporex e mazindol)**;
- ✓ Usuários de drogas ilícitas psicoestimulantes nas últimas 24h (cocaína, crack, metanfetamina, ecstasy);
- ✓ Uso contínuo de antidepressivos inibidores da MAO (tranilcipromina)***;
- ✓ Uso contínuo de antidepressivos tricíclicos (amitriptilina)***;
- ✓ Uso contínuo de anti-hipertensivos BBNS (propranolol)***.

* = Não há consenso na literatura sobre essa contra-indicação,

** = Drogas atualmente proibidas no Brasil.

*** = Maior significado clínico na administração intravascular ou altas doses de soluções anestésicas com vasoconstritores adrenérgicos.

Duração da anestesia local

TABELA 3-7

Duração Média da Anestesia Pulpar e dos Tecidos Duros

Anestésico Local	Infiltração (minutos)	Bloqueio Nervoso (minutos)
Cloridrato de Lidocaína		
2% — sem vasoconstritor	5-10*	≈10-20*
2% + adrenalina 1:50.000	≈60	≥60
2% + adrenalina 1:100.000	≈60	≥60
2% + adrenalina 1:200.000	≈60	≥60
Cloridrato de Mepivacaína		
3% — sem vasoconstritor	5-10*	20-40*
2% + levonordefrina 1:20.000	≤60	≥60
2% + adrenalina 1:100.000	≤60	≥60
Cloridrato de Prilocaina		
4% — sem vasoconstritor	10-15*	40-60*
4% + adrenalina 1:200.000	≤60	60-90
Cloridrato de Articaína		
4% + adrenalina 1:100.000	≤60	≥60

*Indica a duração da anestesia pulpar geralmente inadequada para fornecer o controle da dor em um típico procedimento de 48 minutos.

1.(VUNESP – Presidente Prudente – SP:ESF/ 2022) Na seleção de um vasoconstritor em uma anestesia local odontológica, vários fatores devem ser considerados por parte do profissional, como a duração do procedimento, a necessidade de hemostasia durante e após o procedimento, a necessidade de controle pós-operatório da dor e a condição médica do paciente.

Assinale a alternativa correta com relação às propriedades dos vasoconstritores.

- (A) A adição de adrenalina 1:100.000 pode aumentar o tempo da anestesia pulpar da lidocaína a 2% de 10 para 60 minutos.
- (B) A adrenalina é o vasoconstritor mais indicado para pacientes com hipertireoidismo não controlado.
- (C) Os vasoconstritores são totalmente contraindicados para pacientes com doença cardiovascular, risco ASA 2 ou 3.
- (D) A adrenalina é eficaz em minimizar a perda de sangue durante e após os procedimentos cirúrgicos.
- (E) A felipressina contrai mais a circulação venosa do que a arterial, por isso é indicada para uma boa ação de hemostasia.

9.(RBO - Barra do Turvo-SP/2018) Assinale a alternativa que apresenta um anestésico de longa duração, que em uma anestesia mandibular pode persistir de 5 a 9 horas.

(A)Articaína.

(B)Prilocaina.

(C)Cloridrato de Bupivacaína.

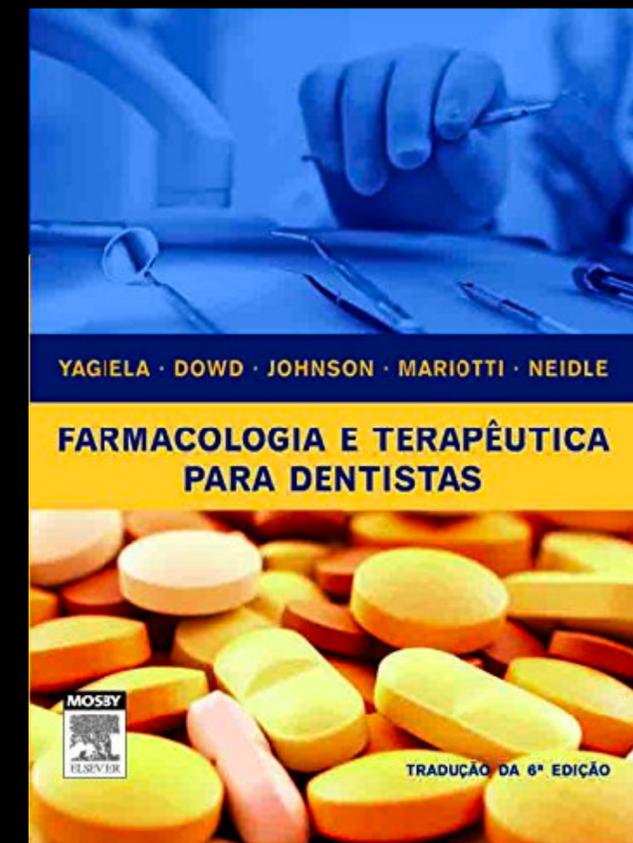
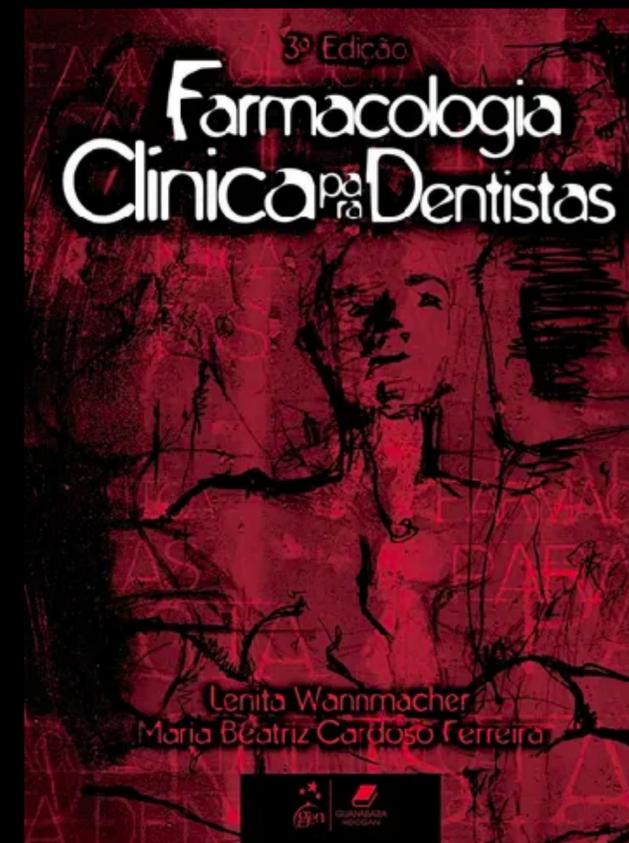
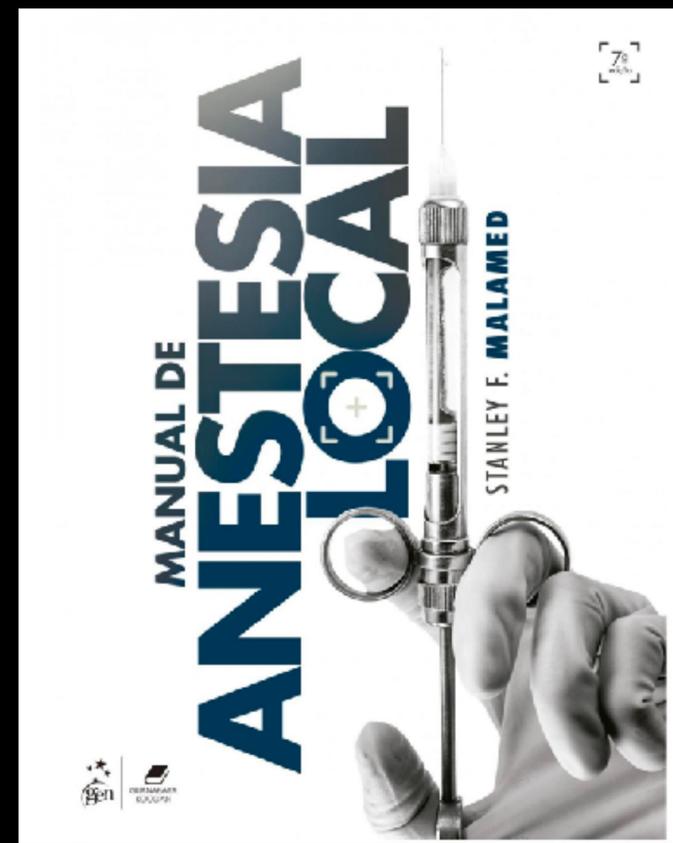
(D)Mepivacaína.

6.(FEPESE – Balneário Camboriú-SC/2023) Em pacientes alérgicos ao bissulfito de sódio, qual dos anestésicos locais citados abaixo pode ser utilizado durante o procedimento de anestesia local?

- (A) Mepivacaína 3% sem vasoconstritor
- (B) Articaina 4% + adrenalina a 1:100.000
- (C) Articaina 4% + adrenalina a 1:200.000
- (D) Licodaina 2% + adrenalina a 1:100.000
- (E) Prilocaina 4% + adrenalina a 1:200.000

13.(IBAMSP – Santos – SP/ 2022) A Bupivacaína a 0,5% com epinefrina se caracteriza como agente de:

- (A) curta duração, 30 minutos de efeito.
- (B) duração intermediária, com 1 hora de efeito
- (C) longa duração, com até 2 horas de efeito
- (D) longa duração, com até 8 horas de efeito**



"O QUE NÃO FOR INICIADO NUNCA SERÁ CONCLUÍDO"

Johann Wolfgang von Goethe