

Farmacologia dos Anestésicos

Locais – Parte 2



VASOCONSTRICTORES

VASOCONSTRICTORES

- Retardar a absorção
 - reduz a toxicidade
 - aumenta a duração
 - volume menor
 - aumenta a eficácia
 - isquemia

Vasoconstritor

- Conservação:
 - lugares frescos
 - ausência de luz
- Degradação

**VASOCONSTRICTORES – CONCENTRAÇÕES
(mg / ml)**

<u>Concentração</u>	<u>mg / ml</u>
1 : 50.000	0,02 ou (20 µg/ml) = 36 µg / tubete
1 : 100.000	0,01 ou (10 µg/ml) = 18 µg / tubete
1 : 200.000	0,005 ou (5 µg/ml) = 9 µg / tubete

VASOCONSTRICTORES

- aminas simpaticomiméticas
- sintéticos
- instáveis em solução (oxidação)
- Preservador: bissulfito de sódio (0,05 - 0,1%)

pH

- tecido normal - (7,3 / 7,4)
- sol. anestésica s/ vaso - (5,5 / 6,8)
- sol. anestésica c/ vaso (bissulfito de sódio) - (3,3 / 4,2) *
 - . sensação de queimação
 - . aumenta o tempo de latência

Tipos de Vasoconstritores

- **CATECOLAMÍNICOS:**

- Adrenalina (Epinefrina)
- Noradrenalina (Norepinefrina)
- Fenilefrina
- Levonordefrina

- **NÃO CATECOLAMÍNICOS:**

- Felipressina (Octapressin)

Receptores Adrenérgicos

- **Alfa**: vasoconstrição
- **Beta 1**: coração (efeitos inotrópico e cronotrópico)
- **Beta 2**: brônquios, vasos e útero

ADRENALINA (Epinefrina)

- Atua em alfa (50%) e beta (50%)
 - Possíveis efeitos indesejados*:
 - ação beta 1: risco de taquicardia/arritmias
 - aumento do débito e frequência cardíaca
 - aumenta PA
 - Metabolismo : oxigênio e glicose
 - Potência x concentração
- OBS: uso odontológico (ação alfa)



NORADRENALINA (Norepinefrina)

- Atua em alfa (90%) e beta (10%)
- Ação alfa – vasoconstrição
- Possíveis efeitos indesejados*:
- Aumenta PA
- Reduz frequência cardíaca (ação reflexa)
- 1/4 da potência da adrenalina
- Ações metabólicas em menor grau
- Concentração*



LEVONORDEFRINA

- Ação alfa (75%) e beta (25%)
- Potência : 1/6 da adrenalina
- Ações em menor grau que a adrenalina



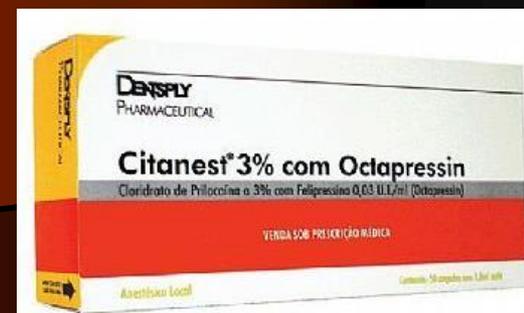
FENILEFRINA

- Ação alfa (95%)
- 5% da potência da adrenalina
- Possíveis efeitos indesejados*:
- Ação alfa - aumenta PA*
- Bradicardia reflexa
- arritmias - raras
- Ações metabólicas semelhantes à adrenalina



FELIPRESSINA

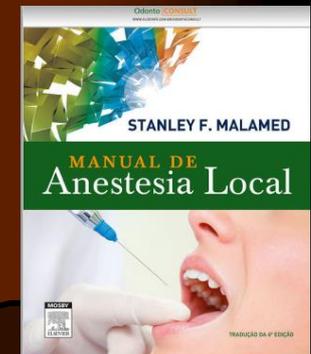
- Felipressina ou OCTAPRESSIN
- análogo sintético do H.A.D.
- amina não simpaticomimética
- estimulação vascular (venosa) - valor mínimo p/ hemostasia
- não age em receptores adrenérgicos
- ausência de efeitos C.V. diretos
- ação ocitócica / contração uterina*



DOSE MÁXIMA

- Adrenalina: 0,2mg (20ml - 1:100.000)
- Noradrenalina: 0,34mg (10ml-1:30.000)
- Levonordefrina: 1mg (20ml - 1: 20.000)
- Fenilefrina: 4mg (10ml - 1: 2.500)
- Felipressina: 0,27UI (9ml - 0,03UI/ml)

A *American Heart Association* recomenda que, em pacientes cardiopatas, a dose máxima de epinefrina seja de 40 µg por consulta, o que representam 2 tubetes de anestésico contendo epinefrina 1:100.000 (18µg) ou 4 tubetes de anestésico contendo epinefrina 1:200.000 (9µg/ml).



Efeitos colaterais e Superdosagem de Catecolamínicos

- ansiedade
- tensão
- agitação
- cefaléia pulsátil
- tremores
- fraqueza
- tonteira
- palidez
- dific. respiratória
- taquicardia
- arritmias
- surto hipertensivo

OUTRAS CONSIDERAÇÕES

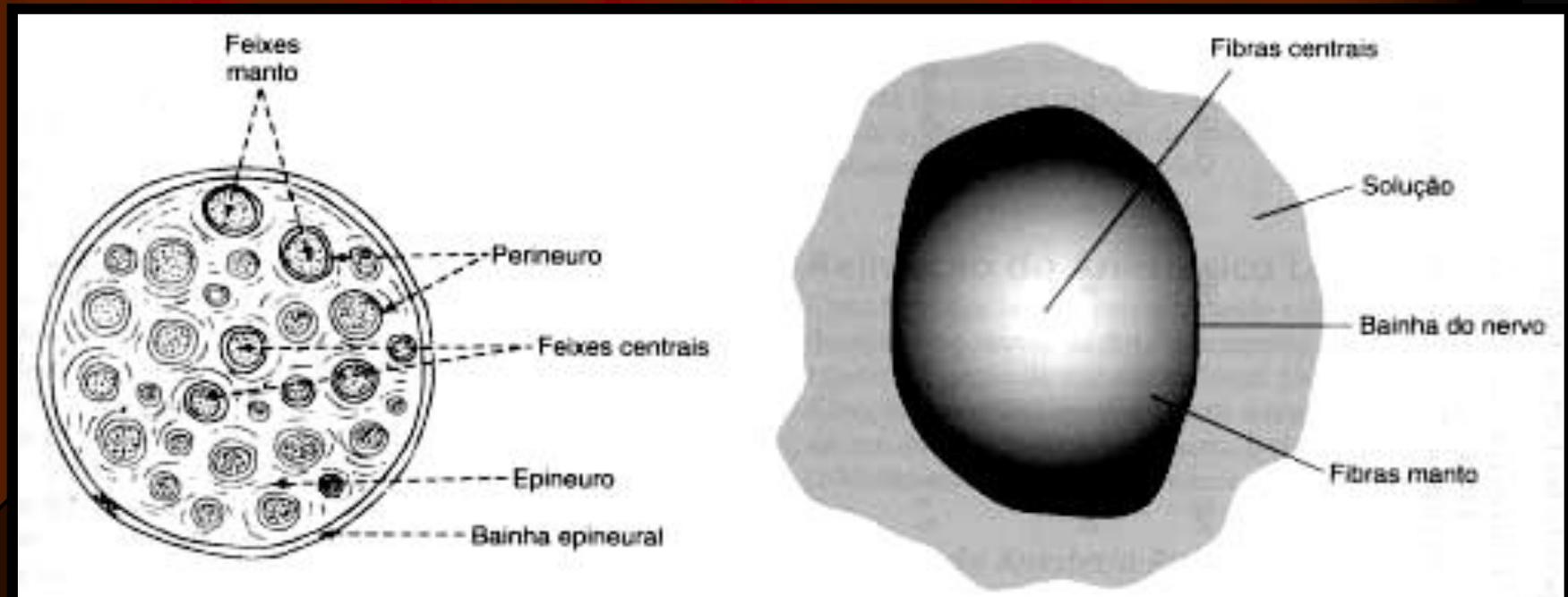
<u>NOME COMERCIAL</u>	<u>AGENTE ANESTÉSICO</u>	<u>Concentração (g / 100ml)</u>	<u>VASOC.</u>	<u>Concentração (g / ml)</u>
XYLOCAÍNA XYLESTESIN	LIDOCAÍNA	2 % <i>(20 mg / ml)</i>	✓Noradrenalina ✓Adrenalina ✓ s/ vasoc.	1 : 50.000 / 1 : 100.000 1 : 100.000 _____
NOVOCOL	LIDOCAÍNA	2 %	FENILEFRINA	1 : 2.500 <i>(0,4 mg/ml)</i>

<u>NOME COMERCIAL</u>	<u>AGENTE ANESTÉSICO</u>	<u>Concentração (g / 100ml)</u>	<u>VASOC.</u>	<u>Concentração (g / ml)</u>
MEPIVACAÍNA SCANDICAINE	MEPIVACAÍNA	2 % (20 mg / ml) 3%	✓Noradrenalina ✓Adrenalina ✓ s/ vasoc.	1 : 100.000 1 : 100.000 _____
CITANEST CITOCAÍNA BIOPRESSIN	PRILOCAÍNA	3 %	Felipressina (Octapressin)	0,03 UI / ml

<u>NOME COMERCIAL</u>	<u>AGENTE ANESTÉSICO</u>	<u>Concentração (g / 100ml)</u>	<u>VASOC.</u>	<u>Concentração (g / ml)</u>
ARTICAÍNE SEPTANEST	ARTICAÍNA	4 % <i>(40 mg / ml)</i>	✓Adrenalina	1 : 100.000 1 : 200.000
CIRUCAÍNA NEOCAÍNA	BUPIVACAÍNA	0,5%	✓Adrenalina	1 : 200.000

DIFUSÃO DO A.L.

- As fibras próximas da superfície do nervo tendem a inervar regiões mais proximais
- As fibras mais centrais inervam pontos mais distais



TAQUIFILAXIA

- ❖ **Difícil re-obtenção da anestesia profunda**
- ❖ **Tolerância crescente a uma droga administrada repetidas vezes**
- ❖ **Ocorre quando a função do nervo retorna antes da re-infiltração (dor)**
- ❖ **Duração, intensidade e propagação anestésica diminuem com re-injeção**

Recidiva da anestesia profunda imediata

- **Fibras parcialmente anestesiadas (anestésico local insuficiente)**
- **A.L. residual + infiltração = rápida anestesia profunda**

Considerações - ADRENALINA

- **Estimula a glicogenólise no fígado**
(Ação Hiperglicemiante importante quando utilizado acima de 4 tubetes 1:100.000)
- **Pode causar disritmias cardíacas em portadores de marcapassos**
- **É inativada pelas MAO (cuidados em pacientes que fazem uso de IMAO)**
- **Controlar a quantidade de tubetes em casos de HAS compensada**
- **IMPORTANTE: Controle dos níveis de ansiedade – stress**

CONSIDERAÇÕES CLÍNICAS

INFLUÊNCIA DO baixo pH

1- Áreas com infecção /ou inflamação :
pH baixo (5 a 6)

2- Anestésicos com vasoconstritor:
mais ácidos (pH ~ 3,3 a 4,2)

ARTICAÍNA*



- “Melhor DIFUSIBILIDADE anestésica da Articaína 4% pode ser explicada pelo maior grau de lipossolubilidade relacionada à sua estrutura química (Anel Tiofênico com radical lipofílico)”
- Articaína é um anestésico do tipo amida e éster, conjuntamente.
- Metabolização mista (plasma e fígado)
- Meia vida mais curta = 27 min (vs. 90 min. outras amidas)

LIDOCAÍNA*



- Cardiologia = usado no tratamento da arritmia cardíaca (E.V.)
- Ataravessa barreira HE ... *convulsões (raro)
- Produto de metabolização da Lidocaína = Monoetilglicinaxilidida e glicinexilidida

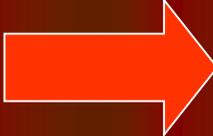


ação sedativa ocasional

CONSIDERAÇÕES CLÍNICAS

Prilocaína e Articaína

ORTOTOLUIDINA

HEMOGLOBINA  METAHEMOGLOBINA

***Metahemoglobinemia: doses séricas elevadas de Ortotoluidina / congênita.**

Características: letargia, cianose, mucosas pálidas, insuficiência respiratória.

Tabela 5.1 Principais soluções anestésicas locais disponíveis no Brasil, indicadas para uso odontológico

Lidocaína 2%	Prilocaina 3%	Mepivacaína 2%	Articaína 4%	Bupivacaína 0,5%
Epinefrina 1:100.000 ou 1:200.000	Felipressina 0,03 UI/mL	Epinefrina 1:100.000 Mepivacaína 3% sem vasoconstritor	Epinefrina 1:100.000 ou 1: 200.000	Epinefrina 1:200.000

Nota: Soluções de lidocaína 3% ou as que contêm vasoconstritores diferentes da epinefrina e felipressina, por não apresentarem qualquer vantagem para uso odontológico, não foram incluídas na tabela.

TABELA 4-1

**Anestésicos Locais Disponíveis na América do Norte
(Agosto de 2011)**

Anestésico Local (+ Vasoconstritor)	Duração da Ação*
Articaína	
4% + adrenalina a 1:100.000	Intermediária
4% + adrenalina a 1:200.000	Intermediária
Bupivacaína	
0,5% + adrenalina a 1:200.000	Longa
Lidocaína	
2% + adrenalina a 1:50.000	Intermediária
2% + adrenalina a 1:100.000	Intermediária
Mepivacaína	
3%	Curta
2% + levonordefrina a 1:20.000	Intermediária
Prilocaína	
4%	Curta (infiltração); intermediária
4% + adrenalina a 1:200.000	(bloqueio nervoso)
	Intermediária

*A classificação da duração da ação é aproximada, mas variações extremas podem ser observadas em alguns pacientes. As substâncias de curta duração fornecem anestesia pulpar ou profunda por menos de 30 minutos; as de duração intermediária, por cerca de 60 minutos; e as de longa duração, por mais de 90 minutos.

**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)

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

TABELA 3-7**Duração Média da Anestesia Pulpar e dos Tecidos Duros**

Anestésico Local	Infiltração (minutos)	Bloqueio Nervoso (minutos)
Cloridrato de Lidocaina		
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 Articaina		
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.



That's all Folks!