

## ANESTÉSICO LOCAL: CONHECIMENTO DOS ASPECTOS FARMACOLÓGICOS QUE TORNAM O SEU USO SEGURO

Daniela Mello TONOLLI<sup>1</sup>; Erica Endo AMEMIYA<sup>1</sup>; Marilia franco de OLIVEIRA<sup>1</sup>; Paula Nogueira NUNES<sup>1</sup>; Pedro Castela MOLOZZE<sup>1</sup>; Thaiana Lince Lopes DIAS<sup>1</sup>; Thais Tiemi SAITO<sup>1</sup>; Victor Oliveira MENEZES<sup>1</sup>  
Fabiana GONZALEZ<sup>2</sup>; Maria Aparecida Pedrosa dos SANTOS<sup>2</sup>

<sup>1</sup> Centro Universitário Lusíada – Autores: Curso de Medicina, Núcleo Acadêmico de Estudos e Pesquisas em Anestesia, Reanimação e Dor, pedrocmalozze@gmail.com

<sup>2</sup> Centro Universitário Lusíada – Orientadoras: Núcleos Acadêmicos de Estudos e Pesquisas em Farmacologia e Toxicologia / Anestesia, Reanimação e Dor, cidaps@uol.com.br

### Introdução

O avanço da medicina proporcionou o desenvolvimento da farmacologia, e disponibilização de fármacos, que são apresentados de forma a garantir o sucesso na sua administração.

O conhecimento da farmacologia clínica dos anestésicos locais (AL) inclui um entendimento que permite a possibilidade da sua utilização de forma segura na prática clínica e cirúrgica diária. Eles são utilizados rotineiramente em Centro Cirúrgico, Pronto Socorro, Unidade de Terapia Intensiva, Consultórios Odontológicos, dentre outros.

**O objetivo desse trabalho é compreender a farmacologia dos anestésicos locais e proporcionar conhecimento à equipe multidisciplinar que participa do momento da sua administração, e assim minimizar as complicações resultantes do seu uso.**

### Conceito

São substâncias que induzem de forma transitória a perda da sensibilidade dolorosa, motora e autonômica em uma porção do corpo.

### História

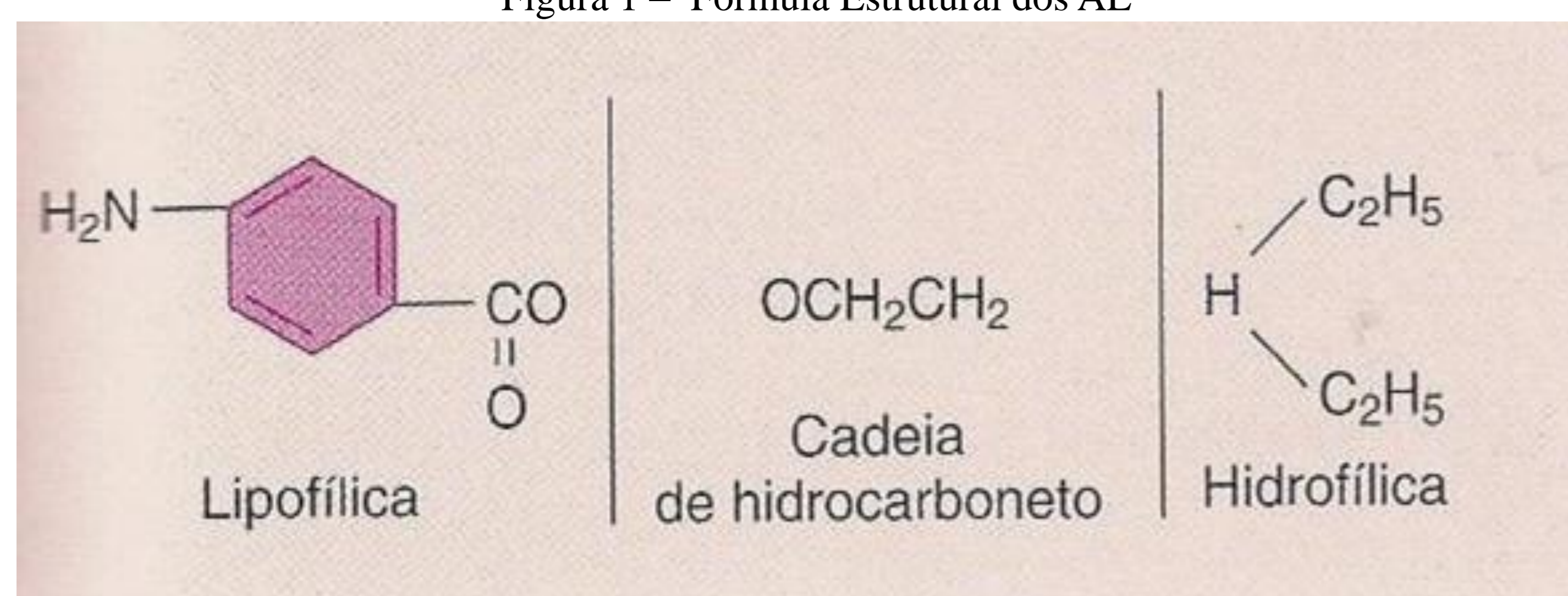
Em 1884 Karl Koller fez uma instilação de cocaína na conjuntiva ocular e a apresentou como AL. Esse fato foi um marco para a anestesia local, pois ele demonstrou a ação do fármaco como AL. Em virtude de seus efeitos sistêmicos, da potencial dependência física e psíquica, a cocaína foi substituída pela procaína em 1904. A lidocaína foi introduzida no mercado em 1948, a bupivacaína em 1950, a ropivacaína em 1966, a etidocaína em 1970, e a levobupivacaína em 2000.

### Propriedades Físico-Químicas

Os AL são classificados a partir da ligação do resíduo aromático ÉSTER ou AMIDA. A estrutura molecular básica dos AL mais é constituída de três partes (Fig. 1):

1. Grupo hidrofóbico e lipofílico, normalmente um anel aromático;
2. Cadeia intermediária, geralmente um éster ou uma amida;
3. Grupo hidrofílico, em geral uma amina terciária.

Figura 1 – Fórmula Estrutural dos AL



Fonte: Miller, Ronald D. Bases da Anestesia, Editora Elsevier, 6ª edição, Rio de Janeiro, 2012

### Classificação

Uma das classificações utilizada para os AL é a ligação entre a cadeia intermediária e o grupo aromático. Essa ligação pode ser do tipo ÉSTER ou do tipo AMIDA (Fig. 2).

- ÉSTERES: cocaína, tetracaína
- AMIDAS: lidocaína, bupivacaína e prilocaína

### Mecanismo de Ação

Centro Universitário Lusíada – UNILUS  
Programa de Pós-Graduação, Pesquisa e Extensão do UNILUS - PPGPE  
Comitê Institucional de Iniciação Científica do UNILUS - COIC  
Núcleo Acadêmico de Estudos e Pesquisas em Educação e Tecnologia do UNILUS - NAPET

Os AL agem inibindo a condução dos nervos periféricos, basicamente por um decréscimo na permeabilidade ao sódio que impede a despolarização da membrana e a condução no tecido nervoso. Essa ação dos AL é decorrente de sua interação direta com canais de Na<sup>+</sup>. Ambas as formas, ionizadas e não ionizadas, estão envolvidas na atividade farmacológica. A base, lipossolúvel, difunde-se pela membrana celular, enquanto a forma carregada é muito mais ativa em bloquear o canal de sódio.

### Farmacocinética

Os AL têm uma farmacocinética diferente da maioria dos fármacos, pois são administrados (injetados) em áreas próximas aos nervos que devem ser anestesiados. A absorção e a circulação sistêmica minimizam ou diminuem o efeito anestésico. Quanto à metabolização, os ésteres são rapidamente metabolizados pelas esterases plasmáticas, já os amidas sofrem metabolização pelas enzimas hepáticas. A excreção é feita pelos rins. A indústria farmacêutica disponibiliza preparações que atenuam a absorção dos AL através da adição de um vasoconstritor como a adrenalina ou fenilefrina. Estas preparações amenizam possíveis efeitos sistêmicos (Toxicidade), porém seu uso não pode ser feito em extremidades de corpo.

### Dose

Doses indicadas para um adulto (Fig. 2) (retiraria isso, pois esta repetindo a legenda da tabela)

Figura 2 – Dose Máxima em Adultos

Droga	Sem adrenalina	Com adrenalina
2-cloroprocaína	11 mg/kg	14 mg/kg
Lidocaína	4 a 5 mg/kg	7 mg/kg
Prilocaína	7 mg	8,5 mg/kg
Mepivacaína	4 a 5 mg/kg	7 mg/kg
Bupivacaína	2,5 mg/kg	3 mg/kg
Levobupivacaína	2 mg/kg	5,5 mg/kg
Ropivacaína	3 mg/kg	11 mg/kg

### Toxicidade

A toxicidade é proporcional ao grau de absorção vascular dos AL.

**Sintomas iniciais:** fala acelerada e empastada; distúrbios auditivos; desorientação; gosto metálico na boca; diplopia, escotomas; agitação psicomotora, parestesia lingual e perioral, tremores. **Progressão:** letargia; sonolência; diminuição dos movimentos; diminuição do tônus muscular; bradipnéia; hipotensão. **Convulsões:** movimentos tônico-clônicos generalizados; apnéia, hipóxia, cianose; hipotensão pronunciada; arritmias cardíacas; parada cardiorrespiratória. **Tratamento:** 1. Oxigenação e ventilação; 2. benzodiazepínicos (diazepam 0,2 a 0,3 mg/kg); 3. Tiopental (5 a 7 mg/kg), quando não há resposta com uso de diazepam; succinilcolina (1 mg/kg) para facilitar a ventilação e a intubação nos casos graves.

### Referências bibliográficas

- GOODMAN E GILMAN. As Bases Farmacológicas da Terapêutica. AMGH Editora, 2010  
MILLER, Ronald D. Bases da Anestesia, Editora Elsevier, 6ª edição, Rio de Janeiro, 2012  
MORGAN, G. et al. Anestesiologia Clínica, Editora Revinter, RJ, 4ª Edição, 2010.  
SAESP (Organização). Sociedade de Anestesiologia do Estado de São Paulo. 7ª Ed. São Paulo: Editora Atheneu, 2011  
Farmacologia dos Anestésicos Locais. Disponível em: <<http://grofsc.net/wp/wp-content/uploads/2013/05/Farmacologia-dos-anestésicos-locais.pdf>> Acesso em: 18/09/2015

Núcleo Acadêmico de Estudos e Pesquisas em  
Anestesia, Reanimação e Dor / UNILUS

Núcleo Acadêmico de Estudos e Pesquisas em  
Farmacologia e Toxicologia / UNILUS