

ANESTÉSICOS LOCAIS E SUAS APLICAÇÕES NAS DIFERENTES ÁREAS DA MEDICINA

Aline Rosés Sgarabotto
Juliana Mazzaferro Krebs
Luise Sgarabotto Pezzin
Jorge Luis Hoyos
Régis Borges Aquino

UNITERMOS

ANESTÉSICOS LOCAIS.

KEYWORDS

ANESTHETICS, LOCAL.

SUMÁRIO

Anestésicos locais (ALs) são fármacos que promovem bloqueio reversível da condução nervosa, sem gerar alteração de consciência. Os ALs apresentam diversas aplicações clínicas, desde anestesia tópica de mucosas, bloqueios regionais até correção de arritmias ventriculares. São utilizados em diversas áreas que não somente a anestesia propriamente dita. (seria interessante adicionar o objetivo deste artigo aqui) Usaria ALs no texto todo.

SUMMARY

Local Anesthetics (LA) are drugs that promote reversible blockage of neural conduction, without change in consciousness. The LAs have many clinical applications, since topic mucous anesthesia, regional blockage to even ventricular arrhythmia. They are used in many areas that not just anesthesia itself.

INTRODUÇÃO

Os anestésicos locais (AL) estão gerando, cada vez mais, uma maior qualidade de bloqueio nervoso e são usados em uma grande variedade de situações clínicas tanto para o domínio da dor aguda assim como no tratamento da dor crônica.³ Esses fármacos são seguros e eficientes, mas devem ser usados com precaução pelo seu potencial de produzir neuro e cardio toxicidade.⁴

MECANISMO DE AÇÃO

Os ALs atuam na membrana celular ligando-se reversivelmente a um receptor específico no poro dos canais de sódio (Na⁺) dos nervos.¹ O processo de condução de fenômenos excitatórios através do nervo é resultado de fenômenos eletroquímicos. A condutibilidade se dá através de uma diferença de potencial da membrana, que tem seu interior mais negativo que o exterior, estabelecido principalmente pela bomba de sódio e potássio, transportando sódio para o meio extracelular e potássio para o meio intracelular.² AL impedem a geração e condução de impulsos nervosos ao interferir na permeabilidade da membrana ao sódio, bloqueando esses canais e impedindo a condução de estímulo na fibra nervosa.¹ A gradação de bloqueio nervoso é afetada pelo diâmetro do nervo. Quanto maior o diâmetro da fibra nervosa, maiores as concentrações de fármaco para atingir um bloqueio eficiente.³

ESTRUTURA QUÍMICA

A estrutura de um anestésico local consiste em um componente hidrofóbico, uma região de ligação e em uma amina substituída (região hidrofílica).¹

O radical aromático é a parte lipossolúvel da droga e a que garante a penetração no nervo. É a parte com potencial alergênico. A cadeia intermediária é a parte central que liga as partes hidrofílicas e hidrofóbicas da molécula. Quanto mais carbonos nessa estrutura central, maior a toxicidade e lipossolubilidade do fármaco. O grupo amina é a porção ionizável e que sofre influência do PH do meio.²

O que determina um maior efeito do anestésico local é a sua lipossolubilidade, que proporciona uma maior entrada do fármaco pela membrana, que é rica em lipídeos, e uma maior quantidade da droga acessa os receptores. No plasma, os anestésicos se ligam a proteínas como a albumina, por isso que suas concentrações sistêmicas aumentam devagar. Porém, quando todas as proteínas plasmáticas estão saturadas e ligadas ao fármaco, como por exemplo na injeção intravenosa acidental, os níveis plasmáticos aumentam rapidamente, com risco de toxicidade neuro e cardiovascular.³

TOXICIDADE

Dentre os sinais clínicos de intoxicação estão o formigamento de lábios e língua, zumbidos, distúrbios visuais, convulsões, depressão cardiovascular, inconsciência, coma e parada cardio respiratória. Por ser um depressor da membrana celular, devemos estar atentos para certas reações aparentemente excitatórias que o paciente intoxicado pode apresentar, e lembrar que estes fenômenos “excitatórios” sempre são resultado de depressão do sistema

nervoso central (SNC), e não devem ser utilizados outros agentes depressores no seu tratamento.² A toxicidade cardíaca se dá em doses maiores que as que causam efeito tóxico no sistema nervoso central(SNC), gerando diminuição da força contrátil e depressão da condução do estímulo no coração. Os canais rápidos de sódio são bloqueados, afetando a despolarização do miocárdio, diminuindo a velocidade de condução.²

ANESTESICOS LOCAIS DISPONÍVEIS NO MERCADO

Lidocaína: lançada em 1947, garante importante bloqueio motor, baixa toxicidade cardíaca, porém de suspeita toxicidade ao neuroeixo durante a raqueanestesia, não sendo mais usada. As ligações com os canais de sódios são feitas com uma maior velocidade, assim como a dissociação do fármaco com esses canais, dessa forma, a período de latência é menor.³

Bupivacaína: produz maior bloqueio sensorial do que motor. Tem efeito prolongado e menos tóxica para o neuroeixo na raqueanestesia. Maior cardiotoxicidade, por retardar a condução dos impulsos cardíacos e pode levar a uma parada cardíaca irreversível. As ligações com os canais de sódio são rápidas, mas a dissociação é lenta, garantindo um efeito mais duradouro da anestesia.³

Ropivacaína: cardiotoxicidade intermediária entre a lidocaína e a bupivacaína. Menos potente que a bupivacaína.

Levobupivacaína: anestésico enantiomero da bupivacaína, apresenta menor toxicidade, mas com efeito similar a ropivacaína.⁵ Ainda não caiu na preferência dos anestesistas.

APLICAÇÃO CLÍNICA

Anestesia tópica: anestesia das mucosas com lidocaína, com efeito anestésico máximo dentro de 2 a 5 minutos e a anestesia dura cerca de 30 a 45 minutos. É uma anestesia superficial sem extensão para estruturas mais profundas. O uso de anestésicos nas mucosas tem o risco de reações tóxicas sistêmicas, pela rápida absorção na circulação.¹

Anestesia por infiltração: anestesia que atua na pele e tegumentos, usada para sutura de ferimentos. É importante a observação das doses clínicas seguras preconizadas para não haver risco de neuro e cardiotoxicidade.¹ Nesta situação qualquer um deles pode ser utilizado.

Anestesia por bloqueio regional: o anestésico é injetado para atuar em um ponto distal ao local da aplicação, como no bloqueio axilar para cirurgia de mão. Para este fim, todos são empregados.

Anestesia para bloqueio nervoso: anestésico dentro ou nas proximidades do nervo. Bloqueio de plexo braquial, supraclavicular, interescalenico, nervo femoral, obturador, ileohipogástrico, ileoinguinal por exemplo.¹ Todos atuam.

Anestesia espinhal ou raquianestesia: o anestésico é injetado no espaço subaracnóideo em contato com o líquido cefalorraquidiano. Poderá ser associado a opióides e outros fármacos tipo clonidina para potencializar a analgesia e a duração.² O AL utilizado é a bupivacaína, pois ropivacaína e levobupivacaína não são liberados para este tipo de bloqueio.

Anestesia peridural: injeta-se o anestésico entre o ligamento amarelo e a duramáter. Esse bloqueio permite a colocação de cateter com a vantagem de bloqueio contínuo e pelo tempo que se estabelece. Pode ser usado na analgesia do pós-operatório imediato, controle da dor de câncer e outras aplicações.² Todos permitidos.

Arritmias cardíacas: a lidocaína intravenosa é útil no tratamento de taquicardias supra ventriculares e de disritmias ventriculares com extrasistolias. A ação consiste no bloqueio dos canais de sódio abertos ou inativados. A recuperação do bloqueio é rápida, com maiores efeitos em tecidos despolarizados (ex. isquêmicos).¹

Tratamento da dor

Contraturas de músculos periféricos estriados: com presença de trigger points cujo tratamento é infusão de lidocaína nestes pontos com desaparecimento imediato e duradouro da dor.

Síndrome dolorosa complexa regional (SDRC): devido a trauma ou injúria de nervo, com tratamento multimodal de difícil resolução, utiliza-se o Bloqueio de Beer. Consiste em venóclise com cateter de teflon, dessangramento de membro (braço ou perna) com faixa de Smarch garroteamento pneumático em raiz de membro para obstruir artéria e veias e infusão de lidocaína 0,5% de 20 a 30 ml associada clonidina 0,5 mcg/KG. Retirada do garrote após 45 minutos.

Dores resistentes a AINES e a opióides fortes em uso isolado ou associados: venóclise e infusão de lidocaína de 0,5 a 1 mg/Kg lento observando-se continuamente os sinais vitais.

Dor em coluna vertebral com pinçamento de raízes nervosas resistentes a AINES, opióides: Nestes casos o bloqueio peridural com lidocaína associada a corticóides, em aplicação única, promovem significativa melhora quando não a regressão total do quadro algico.

No tratamento da dor, somente a lidocaína tem sido utilizada. Ainda não se sabe a razão exata mas o fato é que promove analgesia permanente em muitos casos.

CONCLUSÃO

Os ALs possibilitam anestesia cirúrgica e analgesia no pós-operatório imediato. A lidocaína tem aplicação na reversão de disritmias cardíacas e de dores agudas ou crônicas diversas. Doses clinicamente seguras devem ser observadas para evitar a neuro e cardiotoxicidade dos ALs.

REFERÊNCIAS

1. Brunton LL, Lazo J S, Parker, KL, editors. Goodman e Gilman: as bases farmacológicas da terapêutica. 11 ed. Rio de Janeiro: McGraw-Hill; 2006.
2. Manica, J. Anestesiologia: princípios e técnicas. 3ª ed. Porto Alegre: Artmed; 2004.
3. McLure HA, Rubin AP. Review of local anesthetic agents. *Minerva Anesthesiol.* 2005 Mar;71(3):59-74.
4. Wolfe J.W, Butterworth J.F - Local anesthetic systemic toxicity: up date on mechanisms. *Anesthesiology*;2011 Oct;24(5):561-6.
5. Becher DE, Reed KL. Essential of local anesthetic pharmacology. *Anesth Prog.* 2006 Fall;53(3):98-108; quiz 109-10.