



GRUPO TÉCNICO DE
TRABALHO DE
FARMÁCIA MAGISTRAL



GRUPO TÉCNICO DE TRABALHO DE FARMÁCIA MAGISTRAL DO CRF-SP

INFORME TÉCNICO

ANESTÉSICOS LOCAIS POR VIA TÓPICA

1. Introdução

O crescimento da demanda e realização de procedimentos estéticos, frequentemente realizados em ambiente ambulatorial tem resgatado o interesse e a utilização de agentes anestésicos de ação local por via tópica para o controle da dor durante o procedimento e aumento do conforto do paciente, assegurando melhores resultados clínicos.

No entanto, anestésicos locais são fármacos potentes e que envolvem risco relativo de toxicidade local e sistêmica com graves consequências pela atividade depressora do sistema cardiorrespiratório, caso não sejam observados alguns cuidados de segurança para seu uso.

O anestésico local ideal deve promover redução efetiva da dor, com rápido início de ação, duração prolongada, mínimos efeitos adversos e com mínima exposição sistêmica, além de ser de fácil aplicação e remoção.

2. Recordando o mecanismo de ação dos anestésicos locais

Agentes anestésicos têm elevada afinidade por receptores intracelulares nos canais de sódio e atuam bloqueando o influxo celular de íons sódio e prevenindo a despolarização da membrana neuronal, desse modo, interrompendo a condução nervosa e a transmissão do estímulo doloroso.

O anestésico deve atravessar a membrana celular para atingir o receptor intracelular no canal de sódio. Para atravessar a membrana, deve estar na forma não ionizada e apolar. Já no meio intracelular, o anestésico sofre ionização e na forma ionizada está apto para inativar canais iônicos.



GRUPO TÉCNICO DE
TRABALHO DE
FARMÁCIA MAGISTRAL



3. Requisitos de segurança para a preparação de anestésicos locais por via tópica

- Escolha do agente anestésico: características químicas e físico-químicas (caráter iônico, pKa, solubilidade) e características relacionadas a estrutura molecular (perfil de eficácia, tempo de início e tempo de duração do bloqueio anestésico e risco de efeitos adversos e toxicidade).
- Escolha do veículo utilizado: deve facilitar a aplicação e remoção da preparação; deve ser um meio de transporte facilitador para que o anestésico permaneça na região adjacente ao local de aplicação.
 - O veículo não deve facilitar a permeação transdérmica do anestésico, ou seja, a absorção para a corrente circulatória.

A utilização de veículo transdérmico não é indicada para preparações anestésicas pré-procedimentos doloroso.

- A preparação ideal deve considerar o tipo de procedimento, a área de aplicação, facilidade da aplicação e remoção.

3.1. Fatores de riscos para toxicidade sistêmica

- Dose do anestésico: a intoxicação é dose dependente;
- Extensão da área de aplicação;
- Aplicação de quantidade excessiva de preparação anestésica;
- Tempo prolongado de aplicação do anestésico;
- Oclusão física: o ideal é utilizar um veículo oclusivo sem recobrimento físico com plásticos ou adesivos;
 - Aplicação em mucosa ou lesões epidérmicas;
 - Disfunções na função barreira epidérmica no paciente;
 - Disfunção renal ou hepática do paciente.

4. Combinações e doses de anestésicos locais por via tópica com validação científica

a) Lidocaína isolada:

Preparação em emulsão com 4% de lidocaína base

Pode ser aplicada na proporção de até 60g para uma área de no máximo 400cm² (uso adulto).



GRUPO TÉCNICO DE
TRABALHO DE
FARMÁCIA MAGISTRAL



b) Associação lidocaína com prilocaína (mistura eutética):

Preparação em emulsão com lidocaína base 2,5% e prilocaína base 2,5%

Pode ser aplicada na proporção de até 60g em uma área de no máximo 400cm² (uso adulto).

c) Associação lidocaína e tetracaína:

Preparação oclusiva com lidocaína base 7% e tetracaína base (preferencialmente) 7%

Pode ser aplicada na proporção de até 60g em uma área de no máximo 400cm² (uso adulto).

Um estudo clínico avaliou e demonstrou eficácia e segurança da preparação de lidocaína 15% associada a prilocaína 5%. É importante apontar, porém, que não existe um produto aprovado no Brasil com esta associação até o presente momento.

5. Características técnicas da preparação de anestésico local para uso por via tópica

- Potência anestésica adequada de acordo com o procedimento;
- Menor tempo de início possível;
- Tempo de duração anestésica de acordo com o procedimento;
- Baixa absorção sistêmica;
- Baixa alergenicidade;
- Facilidade para aplicação e remoção;
- Estabilidade;
- Sensorial adequado para conforto do paciente.

6. Cuidados com a aplicação de anestésicos por via tópica

a) Profissional de saúde habilitado

A aplicação deve ser realizada em ambiente ambulatorial e somente por profissional de saúde habilitado e treinado para utilizar anestésicos tópicos.

b) Preparação personalizada

A preparação anestésica deve ser adaptada e personalizada de acordo com cada paciente e caso clínico.

c) Local da aplicação

É importante redobrar o cuidado com a aplicação de anestésicos em regiões com camada córnea menos espessa (como rosto e pescoço) e mucosas, pois



GRUPO TÉCNICO DE
TRABALHO DE
FARMÁCIA MAGISTRAL



nessas regiões a penetração pode ser superior em relação a outras áreas do corpo.

d) Estado da epiderme

A presença de lesões na epiderme pode facilitar a penetração do anestésico. Por outro lado, o pH mais baixo na epiderme inflamada pode dificultar a ação do anestésico.

e) Extensão da área de aplicação

A intoxicação por anestésicos é dose dependente, portanto, é importante avaliar a extensão da área em função da quantidade de anestésico necessária para cobri-la.

f) Estratégias que aumentam a absorção

Oclusão, remoção do estrato córneo por abrasão ou desengorduramento da pele.

g) Fatores relacionados a vascularização

Vasodilatação local ou vasoconstrição.

Referências

BECKER, D.E., REED, K.L. **Local anesthetics: review of pharmacological considerations.** Anesth Prog. 2012 Summer; 59(2):90-101. Disponível em: <https://pubmed.ncbi.nlm.nih.gov/22822998/>. Acesso em: 29 mai. 2023.

CARRUTHERS, J. A. et al. **Safety of lidocaine 15% and prilocaine 5% topical ointment used as local anesthesia for intense pulsed light treatment.** Dermatol Surg. 2010; 36(7):1130-7. Disponível em: <https://pubmed.ncbi.nlm.nih.gov/20653728/>. Acesso em 29 mai. 2023.

CHEROBIN, A. C. F. P., TAVARES, G. T. **Safety of local anesthetics.** An Bras Dermatol. 2020; 95(1):82-90. Disponível em: <https://pubmed.ncbi.nlm.nih.gov/31952994/>. Acesso em: 29 mai. 2023.

FROES, G.C., OTTONI, F.A., GONTIJO, G. **Anestésicos tópicos.** Surg Cosmet Dermatol. 2010;2(2)111-16. Disponível em: <https://www.redalyc.org/pdf/2655/265521080007.pdf>. Acesso em: 29 mai. 2023.



GRUPO TÉCNICO DE
TRABALHO DE
FARMÁCIA MAGISTRAL



KOUBA D.J. *et al.* **Guidelines for the use of local anesthesia in office-based dermatologic surgery.** J Am Acad Dermatol. 2016; 74(6):1201-19. Disponível em: <https://pubmed.ncbi.nlm.nih.gov/26951939/>. Acesso em: 29 mai. 2023.

SHIPTON, E. A. **New formulations of local anaesthetics - Part I.** Anesthesiol Res Pract. 2012; 2012:546409. Disponível em: <https://www.ncbi.nlm.nih.gov/pmc/articles/PMC3235423/>. Acesso em: 30 mai. 2023.

SOBANKO, J.F., MILLER, C.J., ALSTER, T.S. **Topical anesthetics for dermatologic procedures: a review.** Dermatol Surg. 2012; 38(5):709-21. Disponível em: <https://pubmed.ncbi.nlm.nih.gov/22243434/>. Acesso em: 29 mai. 2023.

WEILBACH, C. *et al.* **Effectiveness of various formulations of local anesthetics and additives for topical anesthesia - a prospective, randomized, double-blind, placebo-controlled study.** J Pain Res. 2017; 10:1105-1109. Disponível em: <https://www.ncbi.nlm.nih.gov/pmc/articles/PMC5436754/>. Acesso em 29 mai. 2023.