

BARBITÚRICOS

Os barbitúricos são medicamentos que atuam deprimindo o SNC e foram usados inicialmente como sedativos-hipnóticos. Entretanto, devido ao perfil de efeitos adversos, caíram e desuso e hoje são usados em casos específicos de **sedação e como anticonvulsivantes**.

MEDICAMENTOS

Sufixo “-tal”

Fenobarbital

De ação longa (+ 24h), indicado como anticonvulsivante e sedação pré-anestésica.

Referência: Gardenal
Similar: Carbital, Fenocris
Genérico: Disponível

Tiopental

De ação ultracurta (10-20min), indicado para indução de anestesia geral, auxiliar em anestesia regional e controle de convulsões.

Referência: Thiopentax
Similar: -
Genérico: Indisponível

MECANISMO DE AÇÃO

Sem medicamento

O neurotransmissor GABA, que possui ação inibitória, liga-se aos receptores GABA-A, que funcionam como canais iônicos. Quando ativados, esses canais se abrem, permitindo a entrada de íons cloreto no neurônio.

Esse influxo de íons negativos causa a hiperpolarização da membrana neuronal, tornando o neurônio menos excitável e impedindo que dispare um potencial de ação.

Com medicamento

Os barbitúricos **se ligam a sítios alostéricos do receptor GABA-A**, potencializando a ação de GABA que continua conseguindo se ligar no sítio principal.

Essa interação aumenta o tempo de abertura dos canais iônicos GABA-A, intensificando o influxo de íons cloreto e reduzindo ainda mais a excitabilidade neuronal.

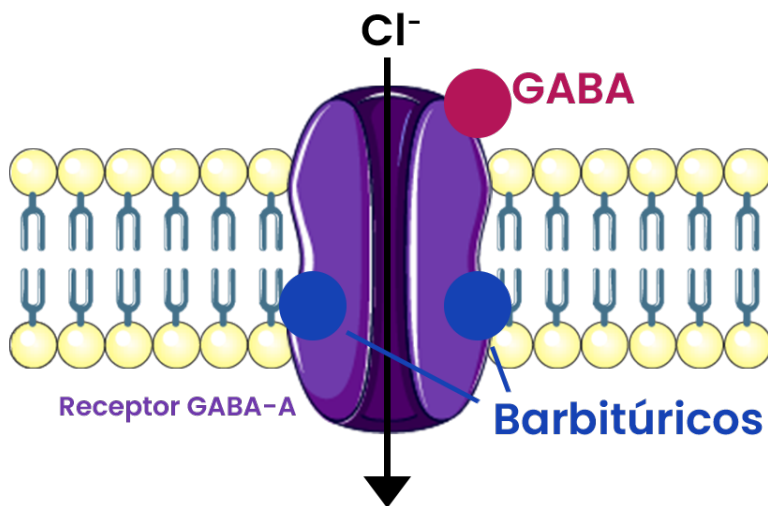
Sem o disparo de potenciais de ação, **é interrompida a neurotransmissão de informações** (efeito depressor do SNC).

Diferença com outras classes de sedativos-hipnóticos:

Os barbitúricos se ligam a sítios alostéricos diferentes dos benzodiazepínicos e hipnóticos não-benzodiazepínicos.

Enquanto os benzodiazepínicos aumentam a frequência de abertura de GABA-A, os **barbitúricos aumentam o tempo de abertura**.

Os barbitúricos bloqueiam receptores de glutamato (um neurotransmissor excitatório) e, em altas doses, também bloqueiam canais de sódio. Tudo isso somado leva a diminuição da atividade neuronal.



PRINCIPAIS USOS

Indução de anestesia

Por ter um início de ação rápido (30 segundos) e duração de ação ultracurta (10-30min), o **tiopental é usado para induzir anestesia** em procedimentos de intubação rápida. O seu perfil altamente lipofílico permite rápida penetração no SNC.

Entretanto, após rapidamente se acumular no cérebro, é **redistribuído** para outros tecidos. Apesar da duração de ação ser curta, o fármaco pode permanecer longos períodos no organismo. Hoje em dia, alguns países não o utilizam mais.

Anticonvulsivantes

O **fenobarbital** pode ser utilizado principalmente na **prevenção de convulsões** por sua duração de ação longo, maior que um dia.

Por existirem opção mais seguras no mercado, **não é de primeira escolha**, ficando reservado para quando outros anticonvulsivantes falharem.

EFEITOS ADVERSOS

Efeitos adversos comuns

Sonolência, sedação, tontura, falta de coordenação motora, náuseas, vômitos e hipotensão.

Depressão respiratória

Em doses altas, pode levar a insuficiência respiratória. Em casos mais graves, pode ocorrer parada respiratória com risco de ser fatal.

Dependência e abstinência

O uso prolongado pode causar dependência física e sintomas de abstinência ao suspender o medicamento.

Overdose

Em casos extremos de alta dosagem (inclusive por acúmulo de doses de fenobarbital) pode levar ao coma, parada respiratória e cardíaca devido a profunda depressão do SNC.

CAUTELA

Pacientes idosos

Necessário ajuste de dose. Devido aos efeitos adversos de sonolência, confusão e desorientação, idosos podem ter problemas de equilíbrio, aumentando o risco de quedas. Por possuírem uma janela terapêutica restrita, existe um risco maior de levar o paciente ao coma.

Pacientes com doenças hepáticas e renais

Necessário ajuste de dose. Pacientes com problemas como cirrose, hepatite alcoólica e doenças nos rins podem ter dificuldade em eliminar os fármacos e seus metabólitos, levando a intoxicação.

Mulheres em idade fértil

Mulheres que estão em idade fértil necessitam utilizar um método de contracepção eficaz e ininterrupto durante todo o tratamento.

CONTRAINDICAÇÕES

Porfíria

A porfíria é um grupo de doenças metabólicas causadas por defeitos na síntese do heme (molécula essencial para a hemoglobina), os barbitúricos induzem a enzima ALA-sintase, que é uma etapa crucial na produção do heme.

Lactantes

Atravessam a barreira placentária e são excretados no leite materno.

Insuficiência respiratória severa

O efeito depressor no SNC pode causar depressão respiratória. Em pacientes com insuficiência severa, pode aumentar o risco de apneia e até mesmo levar a hipoxia grave.

Insuficiência hepática grave

Devido a sua metabolização principalmente no fígado, o acúmulo do fármaco no organismo pode levar a uma grande supressão do SNC, aumentando o risco de coma ou depressão respiratória.

INTERAÇÕES

Álcool e outros depressores do SNC

Outras substâncias como álcool e medicamentos como benzodiazepínicos, opioides, anti-histamínicos sedativos e antipsicóticos podem deprimir em excesso o SNC quando combinados.

Medicamentos metabolizados pela CYP450

Os barbitúricos aumentam a atividade da CYP450, acelerando a degradação de diversas substâncias, anticoagulantes orais, anticoncepcionais orais, corticoides, anticonvulsivantes e antivirais.

Inibidores da CYP450

Por serem metabolizados principalmente pelo sistema enzimático CYP450, se for administrado com inibidores dessas enzimas, seu metabolismo pode ser reduzido, potencializando efeitos depressores do SNC. Exemplos: Cetoconazol, eritromicina, ciprofloxacino, fluoxetina.

Estimulantes

Cafeína e medicamentos estimulantes como anfetaminas podem mascarar os efeitos sedativos dos barbitúricos, aumentando o risco de uso excessivo e toxicidade.

ORIENTAÇÕES

Usar o medicamento exatamente como prescrito, não aumentar a dose ou prolongar o uso.

No caso de interrupção do tratamento, fazer o desmame gradual supervisionado por um médico, nunca interromper abruptamente.

Evitar o consumo de álcool.

Evitar o uso de outros sedativos.

