



# Местные анестетики

# Местные анестетики

- **Местными анестетиками, или местноанестезирующими средствами, называются средства, вызывающие ограниченную блокаду болевой чувствительности, препятствуя возникновению и поступлению в ЦНС болевых импульсов.**

# Классификация

## по преимущественному применению

- Средства, применяемые для поверхностной анестезии: кокаин, дикаин, бензокаин (анестезин), лидокаин, пиромекаин.
- Средства, применяемые преимущественно для инфильтрационной и проводниковой анестезии: новокаин (прокаин), лидокаин, тримекаин.
- Средства применяемые для спинномозговой анестезии: прокаин, совкаин.
- Средства, применяемые для всех видов анестезии: лидокаин.

# Классификация

по химическому строению

- **Сложные эфиры аминоспиртов и ароматических кислот:**
  - Производные бензойной кислоты (кокаин);
  - Производные парааминобензойной кислоты (анестезин, новокаин, дикаин, леокаин).
- **Замещенные амиды кислот;**
  - Производные ацетинида (артикаин, лидокаин, тримекаин, пиромекаин);
  - Производные пиперидина Бупивакаин (маркаин, анекаин), Ропивакаин (наролин), Рихлокаин, Мепивакаин, Прилокаин (цитанест) 4%, Этидокаин (дуранест) 1%
- **Производные бензофурана (бензофуурокаин).**

# Механизм действия

- Местноанестезирующие средства блокируют как генерацию, так и проведение нервного импульса. Точкой приложения при этом является липофильная оболочка клеточной мембраны. Эти препараты предотвращают повышение проницаемости мембраны для ионов натрия, наблюдаемой при деполяризации, что приводит к стабилизации мембраны и невозможности проведения импульса. Одним из важнейших путей блокирования натриевых каналов является вытеснение местными анестетиками кальция из рецепторов, расположенных на внутренней поверхности мембраны. Мелкие нервные волокна блокируются раньше. Так, первыми блокируются автономные нервные волокна, затем сенсорные, проводящие температуру и боль, затем тактильные и, наконец, моторные. Восстановление функции происходит в обратном порядке.
- Анестетики могут присутствовать в растворах в ионизированном и неионизированном состоянии. В последнем случае они легче проходят клеточную оболочку, в то время как ионизированные формы связываются с рецепторами.

# Фармакокинетика

- В кислой среде местные анестетики малоэффективны, т.к. не переходят в основания и плохо проникают через мембраны клеток.
- В очаге воспаления - среда кислая, поэтому нельзя вводить местные анестетики в очаг воспаления, а необходимо его обкалывать по здоровой ткани.

# Фармакодинамика

- При действии местного анестетика в первую очередь отключаются:
- тонкие не миелинизированные волокна типа С, проводящие болевую чувствительность.
- тактильные ощущения исчезают позднее при блокаде миелинизированных волокон типа А.
- в последнюю очередь происходит блокада двигательных волокон.
- Таким образом, исчезновение чувствительности происходит в следующей последовательности; болевая, вкусовая, температурная, тактильная.

# Применение

## Терминальная анестезия.

Плохо растворимые вещества (анестезин) применяются в качестве присыпок, мазей (при лечении ожогов, ран и др.), легко растворимые – в виде растворов и аэрозолей.

# Применение

## Инфильтрационная анестезия.

Обеспечивается путем прямого воздействия на окончания нервных волокон анестетика, которым инфильтрируют подкожную жировую клетчатку. Чаще всего используют 0,25 – 0,5% растворы новокаина и лидокаина. Для пролонгации эффекта их смешивают с адреналином в концентрации 1:200 000 до 1:250 000.

# Применение

Проводниковая (регионарная) анестезия.

Препарат вводят в околоневральное пространство, чтобы вызвать прекращение проводимости импульса. При этом происходит утрата чувствительности иннервируемой области.

# Применение

Эпидуральная (перидуральная) анестезия.

Является разновидностью проводниковой анестезии, при этом анестетик вводят в пространство между наружным и внутренним листками твердой оболочки спинного мозга. Анестетик воздействует на передние и задние корешки спинного мозга, включая иннервацию нижней половины туловища.

# Применение

## Спинальная анестезия.

Разновидность проводниковой анестезии – препарат вводят в субарахноидальное пространство. Чаще других при этом виде анестезии используют новокаин и лидокаин. При выполнении анестезии блокируются симпатический отдел нервной системы, что приводит к расширению артериол, снижению венозного тонуса. Сердечный выброс и АД снижаются. При спинальной анестезии лидокаином вызывается и миорелаксационный эффект, поэтому эти средства нельзя применять при операциях в областях расположенных выше диафрагмы.

# Применение

Кроме того, местные анестетики используются путем внутривенного введения для купирования болевого синдрома при злокачественных новообразованиях, при остром панкреатите и в других случаях.

# Концентрация анестетиков

Виды анестезии	Препарат	Концентрация %
Терминальная (поверхностная)	Дикаин	0.25-2
	Лидокаин (ксикаин)	2-10
	Анестезин	5-20 (масляные р-ры)
	Пиромекаин	0.5-2
	Новокаин (при ожогах)	3-10
	Леокаин	0.3
Инфильтрационная	Лидокаин	0.25-0.5
	Тримекаин	0.25-0.5
	Новокаин	0.25-0.5
	Бензофуурокаин	1
	Рихлокаин	0.5
	Лидокаин	1-2
Проводниковая	Тримекаин	1-2
	Маркаин	0.25-0.5
	Лидокаин	1-2
Спинномозговая и эпидуральная	Новокаин	5
	Лидокаин	0.5
	Маркаин	0.5-0.75

# Современные анестетики

## ■ Артикаин

- Полученный в результате дополнительного гидролиза в плазме метаболический продукт — артикаиновая кислота — является неактивным местным обезболивающим средством и не имеет системной токсичности. Артикаиновая кислота растворяется в воде и выделяется почками в виде свободного метаболита.
- Поскольку артикаин гидролизуется в крови очень быстро, риск системной интоксикации ниже, чем у других местных анестетиков, особенно если повторное введение происходит во время **СТОМАТОЛОГИЧЕСКОГО ВМЕШАТЕЛЬСТВА.**



# Современные анестетики

- Артикаин может обеспечивать обезболивание неба после инфильтрации и анестезию пульпы после инфильтрационной анестезии на нижней челюсти в области от 5 до 5. Это позволяет при использовании артикаина уменьшить показания к проводниковым методам анестезии, что не только упрощает методику обезболивания, особенно у детей, но и уменьшает вероятность развития потенциальных осложнений, связанных с проводниковой анестезией.

# Современные анестетики

- Артикаин не содержит парабена — антибактериального консерванта, который чаще всего вызывает аллергические реакции. Концентрация метабисульфита — антиоксиданта, вещества, препятствующего окислению адреналина, — минимальная и составляет 0,5 мг на 1 мл раствора.
- Без метабисульфита адреналин, который содержится в растворе, быстро разлагается. Ультракаин содержит наименьшую концентрацию этого антиоксиданта по сравнению с другими местными анестетиками. Других же добавок, буферов и стабилизаторов лекарственная форма ультракаина не содержит.

# Современные анестетики

- Ультракаин в 6 раз эффективнее новокаина и в 2-3 раза сильнее лидокаина и мепивакаина.
- Рекомендуемая максимальная дозировка у взрослых составляет  $< 7$  мг/кг массы тела, а у детей —  $< 5$  мг/кг массы тела.
- Быстрое наступление анестезии (0,3—3 мин) позволяет поддерживать благоприятный психоэмоциональный фон, что особенно важно при работе с детьми.

# Современные анестетики

- Новокаин (прокаин)
- Используется внутрь, в/в, в/м, ректально, с помощью электрофореза
- Максимальная доза 800 мг, с адреналином 1000 мг
- Эффективность и токсичность новокаина принимается за 1

# Современные анестетики

- Дикаин (тетракаин)
- В настоящее время используется только для терминальной анестезии ввиду высокой токсичности.
- В 12-15 раз сильнее новокаина и в 8-10 раз его токсичнее.

# Современные анестетики

- Лидокаин (ксикаин).
- Анестезирующий эффект в 4 раза выше, чем у новокаина, токсичность в 2 раза выше
- Максимальная доза лидокаина в чистом виде 3 мг/кг, с адреналином - 7 мг/кг
- Влияние на миокард



- Снижает потенциал действия волокон Пуркинье
- Снижает автоматизм эктопических очагов возбуждения
- Повышает порог возбуждения кардиомиоцитов
- Уменьшает интервалы P-Q и Q-T
- **Используется при желудочковых аритмиях при инфаркте миокарда**

# Противопоказания для лидокаина

- выраженная сердечнососудистая недостаточность,
- атриовентрикулярная блокада II—III степени,
- тяжелые нарушения функции печени и почек,
- повышенная чувствительность.

# Современные анестетики

- Бупивакаин (маркаин, анекаин)
- В 10-15 раз сильнее и в 3-4 раза токсичнее новокаина.
- Является оптимальным анестетиком для проведения обезболивания родов и акушерских операций в виде 0.25-0.5% раствора.
- Максимальная доза 2 мг/кг массы тела.



# Современные анестетики

- Ропивакаин (наролин)
- Аналог бупивакаина, но обладает выраженным побочным воздействием на ССС.
- Применяется в виде 0,2 - 1% растворов для инфильтрационной, проводниковой блокаде сплетений, эпидуральной анестезии.

# Современные анестетики

- Прилокаин (цитанест) - Местный анестетик амидного типа. Механизм действия обусловлен стабилизацией мембран нейронов и предотвращением возникновения и проведения нервного импульса.
- По сравнению с лидокаином анестезирующее действие прилокаина развивается медленнее, менее выражен вазодилатирующий эффект, прилокаин менее токсичен; по интенсивности анестезирующего действия близок к лидокаину.

# Сравнение амидных анестетиков

Название	Токсичность	Анестезирующая активность
Лидокаин	2	4
Бупивакаин	7	6
Мепивакаин	2	4
Цитанест	1	4
Артикаин	1,5	5

# Токсичность анестетиков

- ЦНС
  - кокаинизм
  - судороги
- Периферическая нервная система (нейротоксичность)
  - остаточные токсические эффекты на ткань нерва (хлорпрокаин)
- Сердечно-сосудистая нервная система
  - коллапс (наиболее токсичен бупивакаин)
- Кровь
  - метгемоглобинемия
- Аллергические реакции
  - особенно опасен новокаин

# Использование с вазоконстрикторами

## ■ Вазоконстрикторы:

- адреналин, мезатон, норадреналин

Плюсы и минусы:

# Плюсы

## Положительные свойства вазоконстрикторов:

- снижают токсичность действия анестетика,
- способствуют его депонированию,
- пролонгируют действие анестетика,
- требуется меньшее количество препарата,
- минимальное кровотечение в месте анестезии,
- снижают алергизацию.

# Минусы

## Отрицательные свойства вазоконстрикторов:

- уменьшение питания тканей,
- возможность вторичного кровотечения,
- повышение артериального давления,
- тахикардия, аритмии,
- вызывают бронхоспазм,
- могут вызвать аллергическую реакцию.

Спасибо за внимание.