

# Местноанестезирующие средства

(местные анестетики) - это лекарственные средства, которые при прямом контакте с окончаниями чувствительных (афферентных) нервов и мембраной нервных волокон вызывают в них прекращение образования нервных импульсов и их проведения.

**Показание к применению** - местная анестезия (от греч. *an* – отрицание + *aesthesia* – боль, ощущение).

**Способ применения** - нанесение растворов или мазей на слизистые оболочки, или путем введения растворов к нервным стволам, в окружающие их ткани, и к спинному мозгу (эпи-..., пери-..., суб-...).

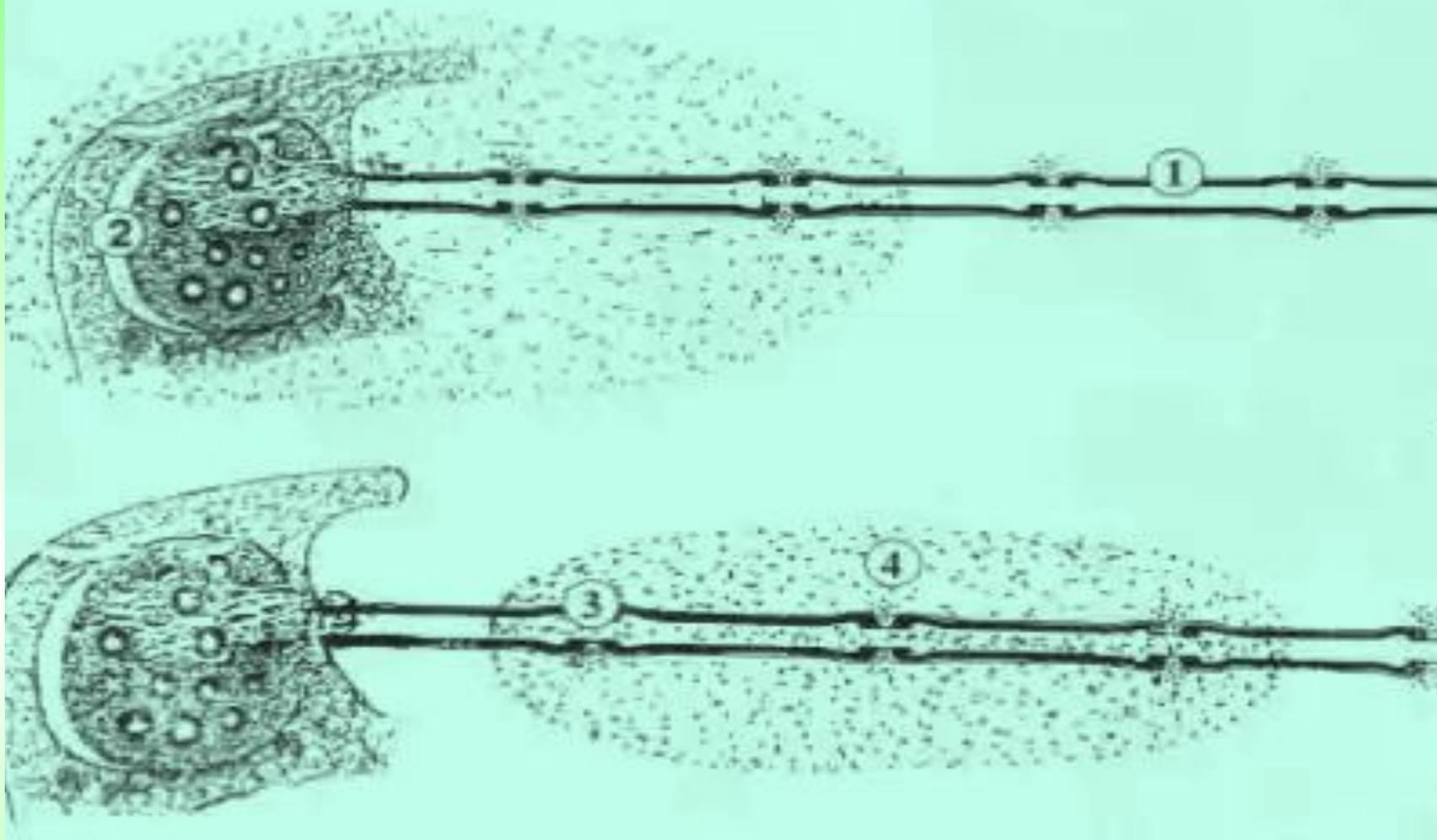
## Местная анестезия

```
graph TD; A[Местная анестезия] --> B[• Аппликационная, терминальная, поверхностная]; A --> C[• Инфильтрационная]; A --> D[• Регионарная - проводниковая];
```

- Аппликационная,  
терминальная,  
поверхностная

- Инфильтрационная

- Регионарная  
- проводниковая



Фармакологический механизм действия местных анестетиков (схема). Блокада нервного волокна при:

- а) инфильтрационной анестезии;
- б) проводниковой анестезии.

# Виды местной анестезии -

**Поверхностная** (терминальная)

+ вяжущие, обволакивающие,  
раздражающие, прижигающие.

**Инфильтрационная**

(тугой ползучий инфильтрат по  
Вишневскому)

**Проводниковая**

(по Лукашевичу-Оберсту, лечебные  
блокады, спинно-мозговая)

# СТРУКТУРА МЕСТНЫХ АНЕСТЕТИКОВ

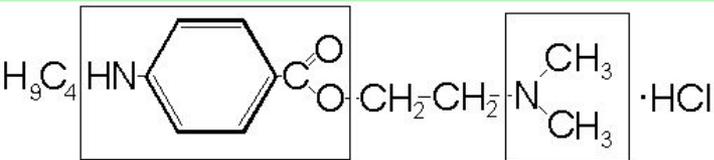
Три основных фрагмента:

**ароматическое ядро** (липофильное);

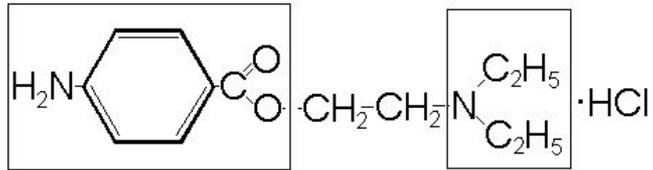
**промежуточная цепочка**

(алифатическая - сложный эфир или замещенный амид);

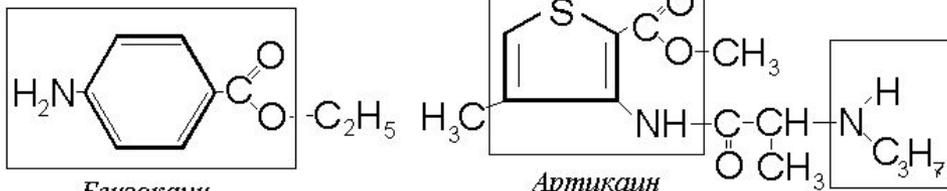
**аминогруппа** (полярная, гидрофильная).



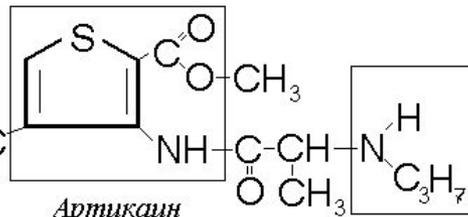
Тетракаин



Прокаин



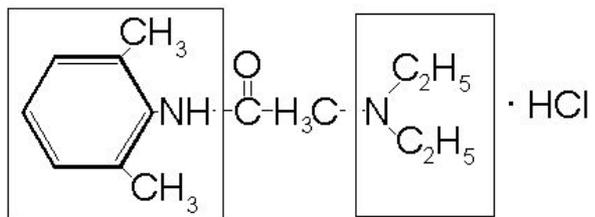
Бензокаин



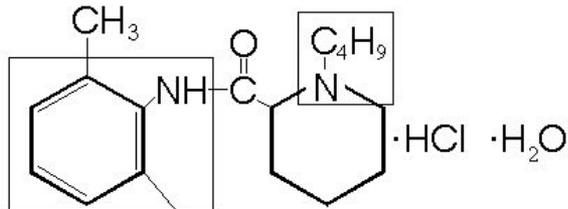
Артикаин

Ароматическое ядро	Промежуточное звено	Аминоалкильная группа
A.	$-O-\overset{\text{O}}{\parallel}{\text{C}}-\text{R}-$	$-\text{N}\begin{matrix} \text{R}_1 \\ \text{R}_2 \end{matrix}$
B.	$-\text{NH}-\text{R}-$	$-\text{N}\begin{matrix} \text{R}_1 \\ \text{R}_2 \end{matrix}$

## 1. Сложные эфиры ПАБК



Лидокаин



Бупивакаин

## 2. Замещенные амиды - не гидролизуются эстеразами.

Во взаимодействии с мембраной нервных волокон участвуют полярные, и неполярные группировки.

**Химическая структура МА имеет три основных фрагмента:**

- 1. Ароматическое кольцо.**
- 2. Промежуточную цепь.**
- 3. Аминогруппу.**

**Ароматическая группа обладает отвечает за:**

- 1) силу и избирательность местно-анестезирующего действия;**
- 2) липоидотропность;**
- 3) взаимодействие с мембранами.**

**Ароматическую группу называют анестезийоформной группой, поскольку именно она проникает через клеточную мембрану нервного волокна и определяет наличие местноанестезирующего эффекта веществ.**

**Промежуточная группа отвечает за:**

- 1) стойкость; 2) продолжительность действия местного анестетика (чем меньше радикалов, тем длительнее действие местного анестетика).**

**Аминогруппа отвечает за растворимость в воде и специфические местноанестезирующие свойства.**

## Классификация местных анестетиков

**ПРИРОДНЫЕ : КОКАИН**

**СИНТЕТИЧЕСКИЕ АЗОТИСТЫЕ СОЕДИНЕНИЯ**

• ***СЛОЖНЫЕ ЭФИРЫ:***

**ПРОКАИН (НОВОКАИН)**

**БЕНЗОКАИН (АНЕСТЕЗИН)**

**АМЕТОКАИН (ДИКАИН)**

• ***АМИДЫ***

**ЛИДОКАИН**

**АРТИКАИН (УЛЬТРАКАИН)**

**БУПИВАКАИН (МАРКАИН)**

**ТРИМЕКАИН**

**ПИРОМЕКАИН**

**МЕПИВАКАИН**

**РОПИВАКАИН**

**ПРИЛОКАИН**

**ЭТИДОКАИН**

**ДРУГИЕ ЛЕКАРСТВЕННЫЕ СРЕДСТВА С МА ЭФФЕКТАМИ**

**ГВОЗДИЧНОЕ МАСЛО, ФЕНОЛ, АМИНАЗИН, ДИМЕДРОЛ.**

**ЗАМОРАЖИВАНИЕ - АЭРОЗОЛЬ ЭТИЛХЛОРИДА**

## **Классификация местных анестетиков по продолжительности действия**

- 1. Короткого действия (30 мин. и менее): НОВОКАИН, МЕПИВАКАИН**
- 2. Средней продолжительности действия (1-1,5 часа): ЛИДОКАИН, АРТИКАИН, ТРИМЕКАИН, ПРИЛОКАИН**
- 3. Длительного действия (более 2 часов): БУПИВАКАИН, ЭТИДОКАИН**

## **Классификация местных анестетиков по применению**

- 1. Для аппликационной (терминальной) анестезии: ДИКАИН, ПИРОМЕКАИН. АНЕСТЕЗИН. ЛИДОКАИН**
- 2. Для инфильтрационной и проводниковой анестезии: НОВОКАИН. ЛИДОКАИН, ТРИМЕКАИН. МЕПИВАКАИН, ПРИЛОКАИН, БУПИВАКАИН. ЭТИДОКАИН, АРТИКАИН**

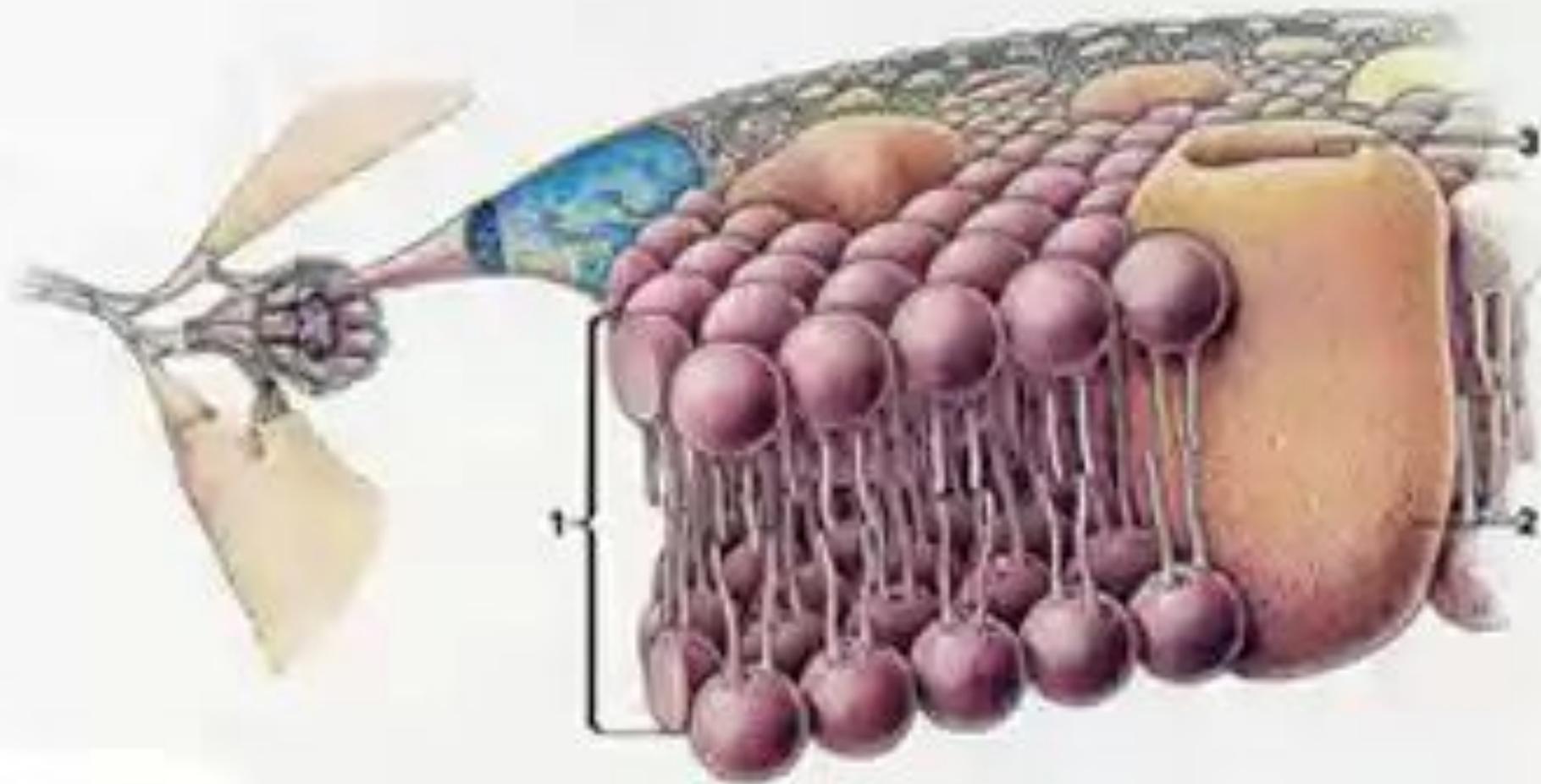
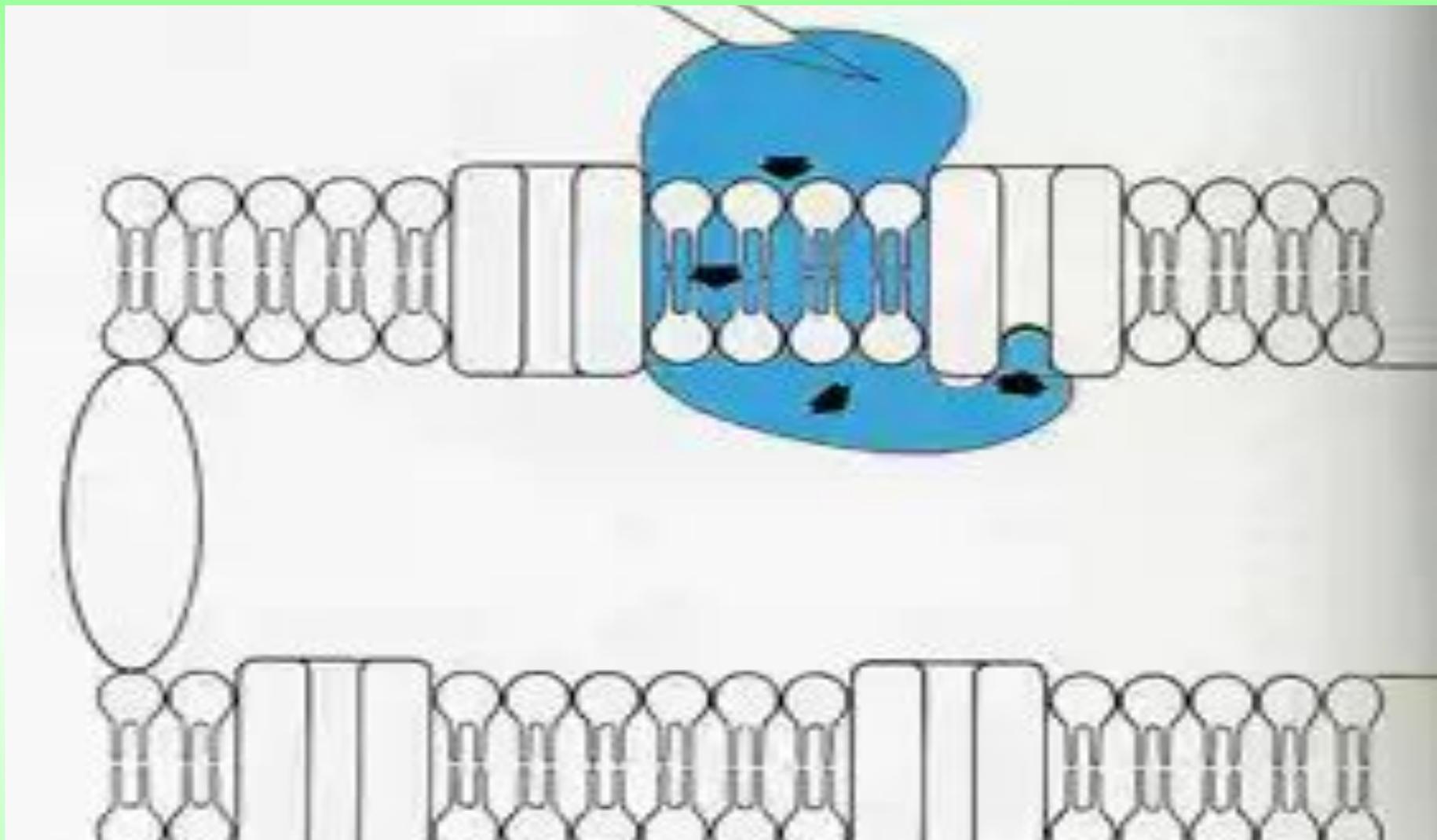
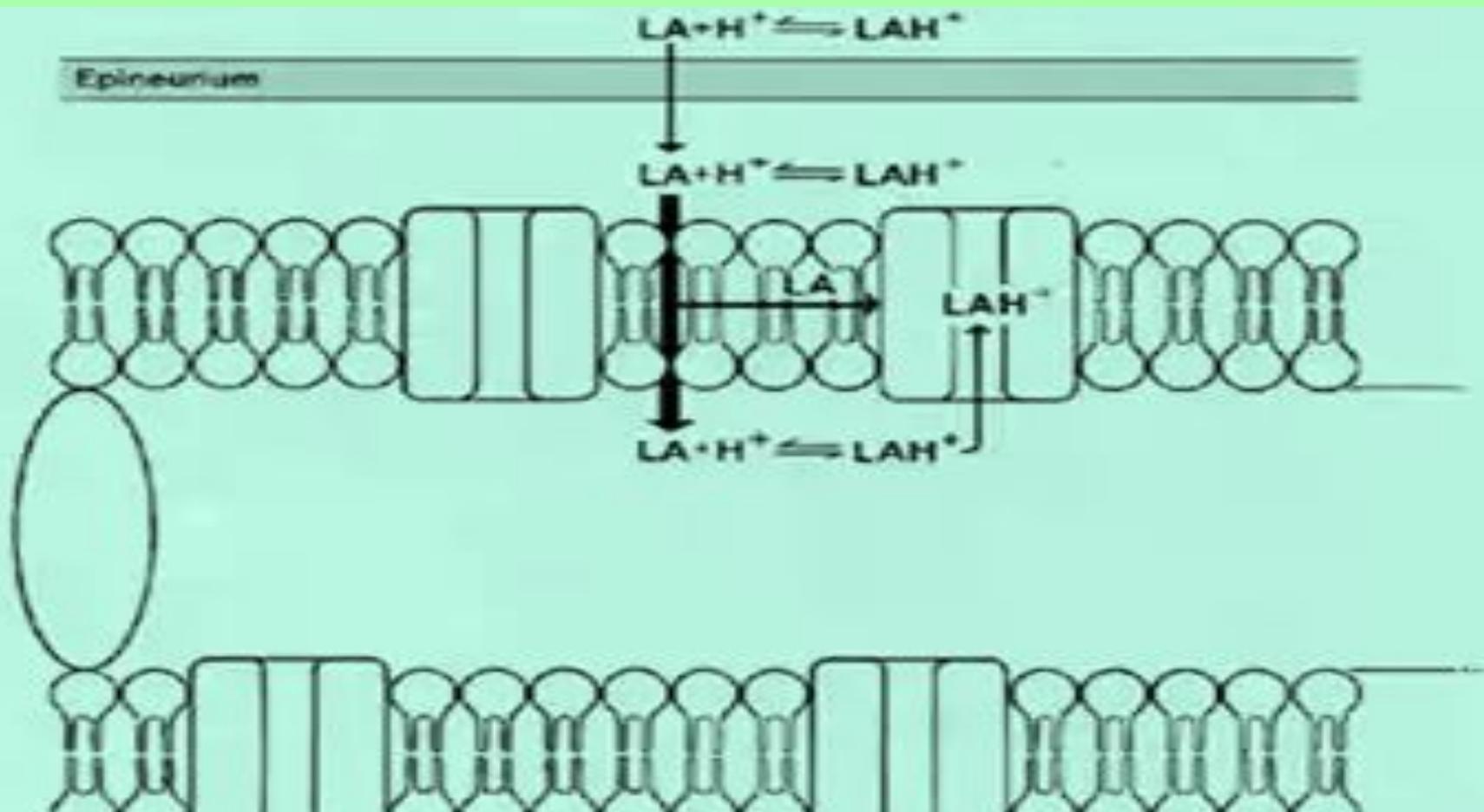


Диаграмма структуры мембраны нервной клетки, которая состоит из липидного бислоя и молекул белка, которые содержат натриевые каналы.

1. Липидный бислой
2. Молекула белка
3. Натриевый канал



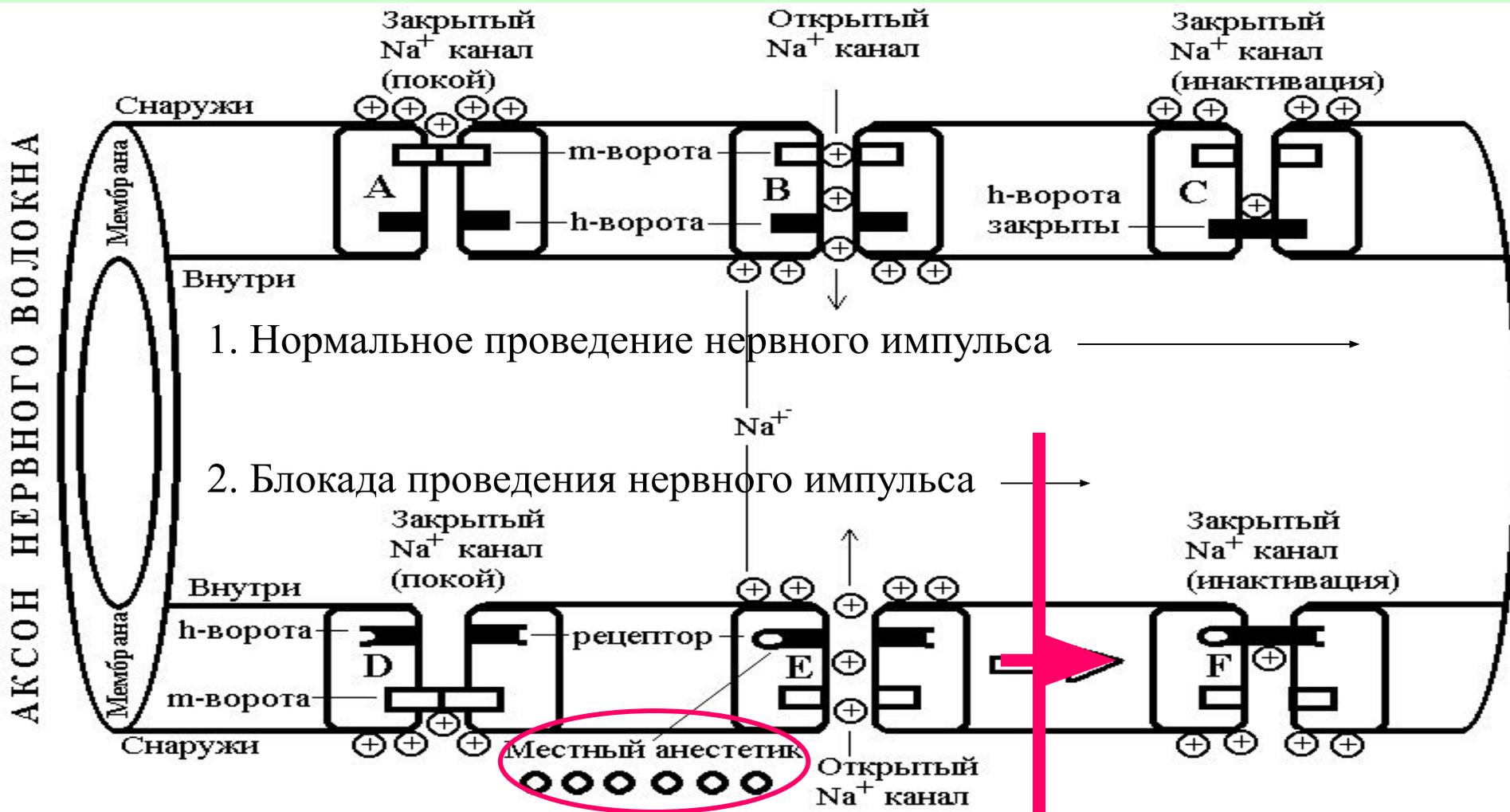
Прохождение молекул местного анестетика через мембрану нервной клетки и вхождение в натриевый канал со стороны аксоплазматической поверхности.

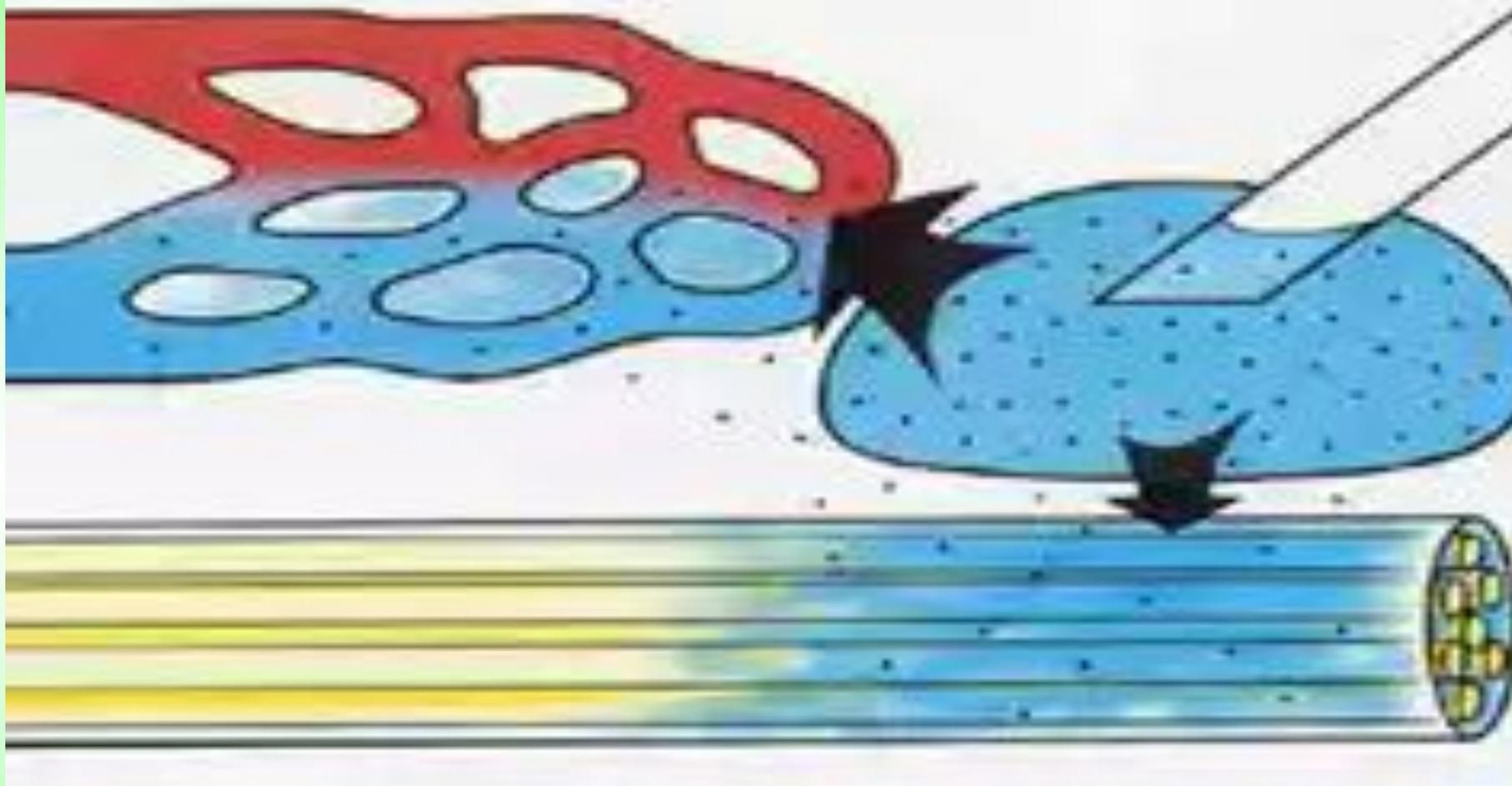


**Диффузия агентов местных анестетиков через нервную оболочку и мембрану к рецепторным участкам в натриевом канале. Только незаряженная форма (LA) может пройти сквозь липидную мембрану. Когда она достигает аксоплазмы, происходит ионизация и заряженная катионная форма (LAH<sup>+</sup>) соприкасается с рецептором.**

# Механизм действия местных анестетиков

Связывание с внутренними h-воротами и ИНАКТИВАЦИЯ - ЗАКРЫТИЕ НАТРИЕВЫХ КАНАЛОВ В АКСОНАХ НЕЙРОНОВ





**Вслед за инъекцией часть препарата адсорбируется в сосудистое ложе. Остаток диффундирует в нервные волокна и жировую ткань.**

**Вяжущие средства** - это лекарственные средства, которые вызывают частичную денатурацию белков слизи или раневого экссудата с образованием различных альбуминатов, за счет чего происходит снижение болевых ощущений, ограничение секреции или выделения экссудата, что и способствует уменьшению воспалительной реакции.

Такое действие оказывают многие вещества растительного происхождения (зверобой, черника, дуб и др.), а также слабые растворы солей некоторых металлов (серебро, висмут, алюминий, свинец и др.). Соли этих же металлов в растворах с высокой их концентрацией могут оказывать раздражающее и/или прижигающее действие.

При больших концентрациях вяжущих средств наступает повреждение живых клеток. Этот вид действия называют **прижигающим**.

**Обволакивающие средства** – это любые вещества, которые образуют с водой коллоидные растворы и не обладают раздражающими и токсическими свойствами (крахмальная слизь).

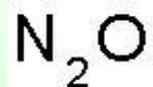
Растворы обволакивающих веществ на поверхности тканей, воспаленных участках, язвах образуют защитное мягкое покрытие, предохраняющее ткани и находящиеся в них окончания чувствительных нервов от раздражения.

Обволакивающие средства оказывают местное противовоспалительное и болеутоляющее действие.

**СРЕДСТВА ДЛЯ НАРКОЗА (ОБЩИЕ АНЕСТЕТИКИ)** – (от лат. *narcosis* – оцепенение, оглушение) – это лекарственные средства, вызывающие **НАРКОЗ** - обратимое угнетение функций ЦНС, сопровождающееся выключением сознания, подавлением чувствительности, в том числе болевой (анальгезией), угнетением соматических и вегетативных рефлексов, снижением мышечного тонуса.

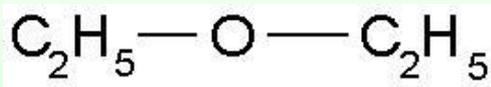
В Российской Федерации - около 20 веществ для наркоза

*неорганические*

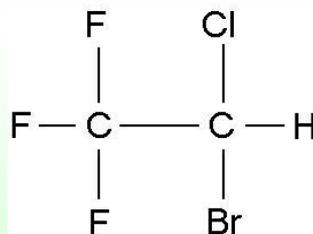


Азота закись

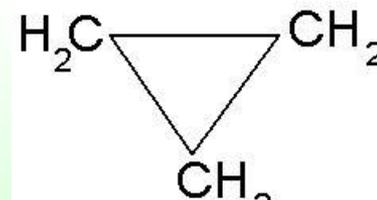
*алифатические*



Эфир для наркоза

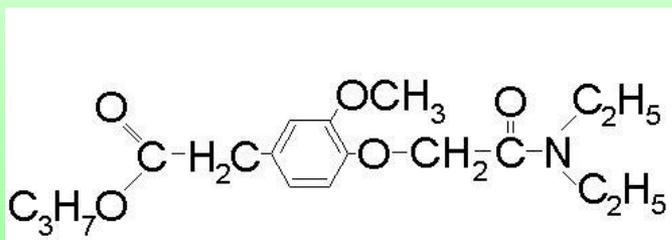


Фторотан



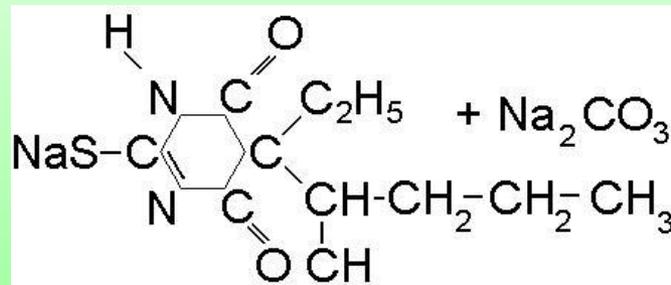
Циклопропан

*ароматические*

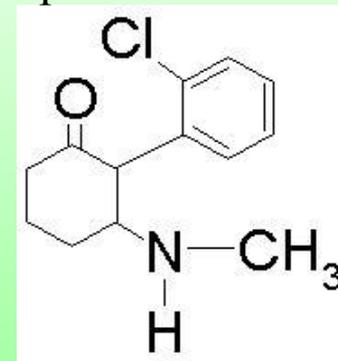


Пропанидид

*гетероциклические*



Тиопентал-натрий



Кетамин

# **Классификация средств для наркоза**

## **I. СРЕДСТВА ДЛЯ ИНГАЛЯЦИОННОГО НАРКОЗА**

### **1.1. Жидкие летучие вещества**

**Диэтиловый эфир для наркоза, Галотан (Фторотан),**

**Энфлуран, изофлуран, севофлуран, .**

### **1.2. Газообразные вещества**

**Азота закись, Ксенон.**

## **II. СРЕДСТВА ДЛЯ НЕИНГАЛЯЦИОННОГО НАРКОЗА**

**Короткого действия (наркоз < 15 минут): Кетамин,**

**Пропофол, Пропанидид**

**Средней продолжительности действия (20-30 минут):**

**Гексенал, Тиопентал-натрий.**

**Длительного действия (> 30-60 минут): Натрия оксибутират**

**Фармакодинамика** - еще совсем недавно не существовало единой теории, объясняющей механизм действия средств для наркоза.

Имелось различные теории (предположения) -

- биофизические (адсорбционная, теория клеточной проницаемости, липидная и белковая теория, теория гидратированных микрокристаллов), и
- биохимические (обменная, гипоксическая, рецептарная).

В последнее время доминирует **теория РЕЦЕПТАРНОГО КОМПОНЕНТА:**

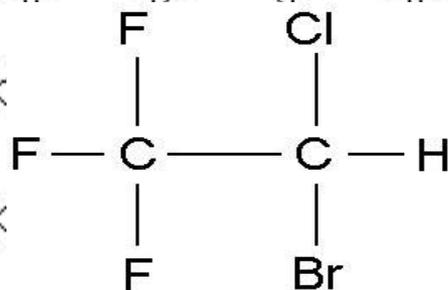
- **Все ингаляционные** (кроме азота закиси) и **неингаляционные** (кроме кетамина) - это агонисты ГАМКа-бензодиазепин-барбитурового комплекса (потенцируют действие ГАМК)
- **Кетамин** - антагонист глутаматных рецепторов NMDA-типа
- **Азота закись** - точный механизм действия не установлен



# Механизм взаимного потенцирования действия средств, угнетающих ЦНС

ГАЛОТАН

ГАМК

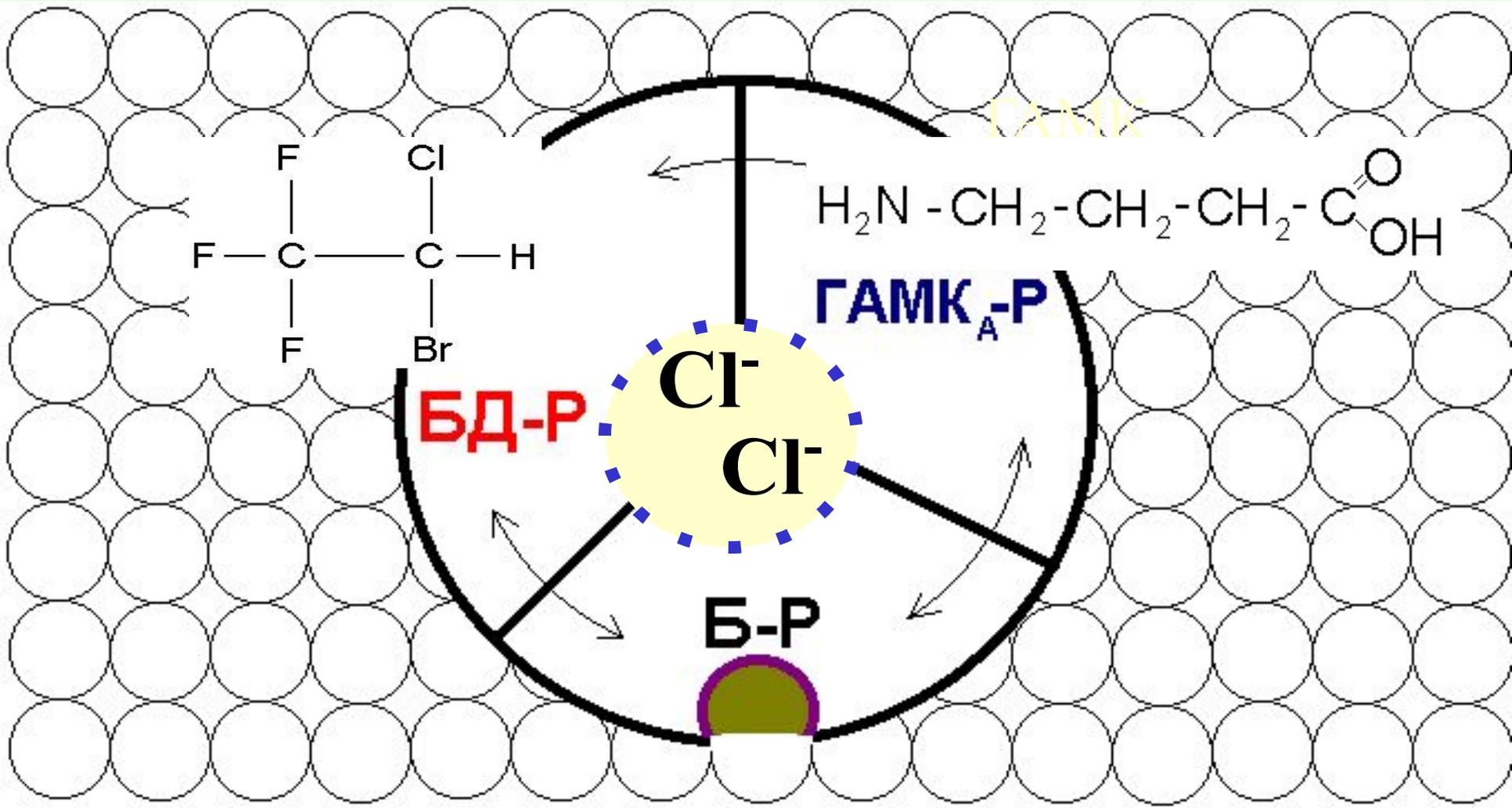
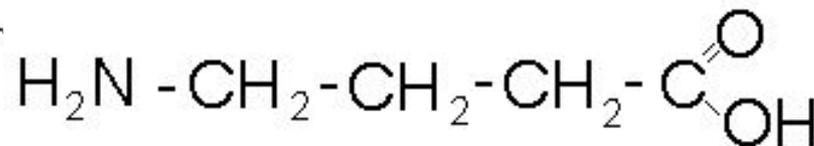


БД-Р

Cl<sup>-</sup>  
Cl<sup>-</sup>

Б-Р

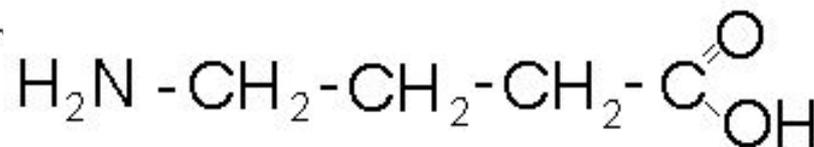
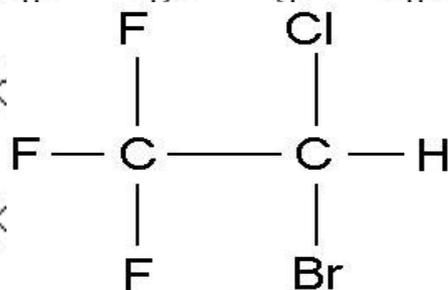
ГАМК<sub>A</sub>-Р



# Механизм взаимного потенцирования действия средств, угнетающих ЦНС

**ГАЛОТАН**

**ГАМК**

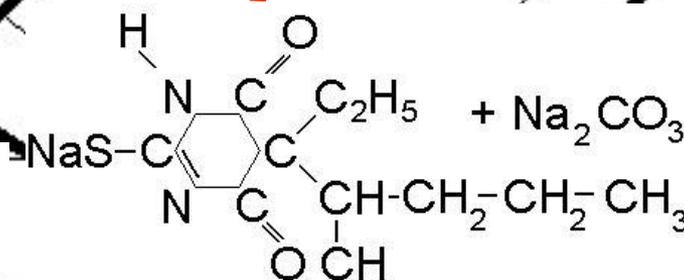


**ГАМК<sub>A</sub>-P**

**БД-Р**



**ТИОПЕНТАЛ**



# ОСОБЫЕ ВИДЫ ЛЕКАРСТВЕННОГО НАРКОЗА

**КЕТАМИНОВЫЙ НАРКОЗ =**

**Диссоциативная анестезия** (амнезия, кататония) +  
**Феномен возникновения** (сны наяву).

**НЕЙРОЛЕПТАНАЛГЕЗИЯ** (Фентанил + Дроперидол)

**ТРАНКВИЛАНАЛГЕЗИЯ** (Фентанил + Феназепам)

**АУТОАНАЛЬГЕЗИЯ** (Трилен)

**Побочные эффекты средств для наркоза** - стимуляция вагуса, угнетение дыхания, нарушения ритма сердца **предупреждаются премедикацией.**

**Компоненты премедикации =**

**Наркотический анальгетик** (промедол) +

**М-холинолитик** (атропин) +

транквилизатор (диазепам) + антигистаминное средство (дифенгидрамин) + нейролептик (дроперидол) + седативное средство (валериана, персен, бромиды).