

ANESTEZICE LOCALE

= deprimă reversibil sensibilitatea și transmiterea impulsurilor prin fibrele nervoase, efectul farmacologic exercitându-se într-un teritoriu limitat

-Previn apariția senzației de durere prin inhibiția generării și conducerii potențialului de acțiune la nivelul fibrelor nervoase

-în funcție de diametru și de prezența/absența mielinei, primele influențate vor fi fibrele de tip B, ale sistemului nervos autonom, ulterior cele de tip C, pentru durere → tip A delta, pentru percepția senzației de căldură → A gamma-proprioceptive → A beta-sensibilitatea tactilă și presiune → A alpha-motorii somatice

Mecanism de actiune

- stabilizatoare de membrana

- scad, reversibil, frecventa depolarizarii si repolarizarii membranare si inhiba transmisia nervoasa, prin blocarea conductibilitatii la nivelul canalelor de Na

- anestezia locala este caracterizata prin scaderea propagarii PA si scaderea conductibilitatii nervoase

Exista doua mecanisme prin care anestezicele locale pot influenta infuxul ionilor de Na:

- principal- prin intermediul blocarii influxului de Na la nivelul canalelor specifice de la nivelul membrane neuronale

- scaderea numarului de canale de sodiu

Efecte farmacodinamice

-inițial, apare o senzație de căldură, datorată paraliziei fibrelor vegetative simpatice vasoconstrictoare, apoi dispar sensibilitatea termică și dureroasă, propriocepția, senzația tactilă și cea de presiune și, la sfârșit, apare deprimarea funcției motorii.

Indicatii

- interventii chirurgicale minore
- durere musculara, articulara etc
- ocazional, tratamentul paraplegiei spastice

TIPURI DE ANESTEZIE LOCO-REGIONALA

-anestezia de suprafață (de contact): se realizează prin aplicarea anestezicului local prin badijonaj, pe tegumentele sau mucoasele lezate (mucoasa bucală, faringiană, esofagiană, mucoasa nazală, conjunctiva și corneea, mucoasa aparatului genito-urinar); determină anestezierea receptorilor senzitivi de suprafață, neinteresând stratul submucos;

-anestezia prin infiltrație: se realizează prin injectarea substanței în profunzimea țesuturilor, strat cu strat și interesează tegumentele și țesuturile subjacente din profunzime

-anestezia de conducere (regională) poate fi: anestezie prin bloc nervos, anestezie rahidiană și anestezie epidurală; constă în injectarea substanței anestezice locale în imediata vecinătate a unui trunchi nervos.

Anestezia prin bloc nervos, numită și **anestezie tronculară** sau **plexală**, se realizează prin injectarea substanței anestezice în vecinătatea nervilor periferici sau a plexurilor nervoase (nervi intercostali, cranieni, plex brahial, cervical etc.).

Rahianestezia (anestezia spinală) constă în introducerea anestezicului local în spațiul subarahnoidian, unde vine în contact cu lichidul cefalorahidian. Injectarea se face de obicei între vertebrele L₃-L₄, permițând obținerea anestezierii abdomenului inferior, perineului și membrelor inferioare.

Anestezia epidurală se realizează după administrarea anestezicului local în spațiul epidural, cel mai frecvent la nivelul regiunii lombare (mai rar toracale). Anestezicul difuzează prin dura mater și ajunge în spațiul subarahnoidian; de asemenea, pătrunde în spațiul paravertebral, producând suplimentar bloc nervos paravertebral.

-osoasă: se introduce anestezicul local în spongioasa osului;

-anestezia arterială: se realizează prin introducerea anestezicului intraarterial, realizându-se anestezierea zonei situată distal de locul de injectare.

CLASIFICAREA ANESTEZICELOR LOCALE

Din punct de vedere al structurii chimice, anestezicele locale se împart în:

- anestezice cu structură esterică**: cocaina, procaina (novocaina), benzocaina (anestezina), tetracaina;
- anestezice cu structură amidică**: lidocaina (xilina), bupivacaina (marcaina), mepivacaina, etidocaina, ropivacaina.

Din punctul de vedere al duratei de acțiune, anestezicele locale pot fi:

- anestezice locale cu durată mare de acțiune** (peste 3-4 ore): tetracaina, bupivacaina, etidocaina)
- anestezice locale cu durată medie de acțiune** (1-3 ore): lidocaina, mepivacaina, prilocaina;
- anestezice locale cu durată scurtă de acțiune** (1/2-1 oră): procaina, cocaina.

ANESTEZICE LOCALE CU STRUCTURĂ ESTERICĂ

Cocaina

Cocaina este un alcaloid din frunze de *Erythroxylon cola*, care se utilizează numai în anestezia de suprafață. Determină efecte slabe pe tegumentele intacte, însă după aplicarea pe pielea lezată, efectul anestezic se instalează în 2-5 minute și durează 1/2-1 oră.

La nivelul mucoaselor, cocaina determină efecte intense și prelungite. Suprimă sensibilitatea termică, dureroasă, tactilă și de presiune.

Cocaina determină efecte sistemice de tip simpatomimetic, exprimate sub formă de vasoconstricție, tahicardie, creșterea tensiunii arteriale, midriază, scăderea peristalticii intestinale.

PROCAINA-NOVOCAINA

Efectul anestezic local se instalează lent, în 15-20 de minute și are durată scurtă (în medie, 20-60 minute).

Are potență de 3-4 ori mai mică decât cocaina, dar și toxicitatea este de 4 ori mai redusă

-Procaina se indică în:

- anestezia prin infiltrație, injectabil, sub formă de soluție 0,5-1% (20-100 ml),

- anestezie tronculară, injectabil 2-5 ml soluție 1%,

- în rahianestezie, administrând intrarahidian 1-2 ml soluție 4-8%,

- în ulcer, sub formă de soluție 0,5-1%, 15-20 ml, administrată oral.

Pentru efectele generale, procaina se administrează în perfuzie intravenoasă lentă, 15-20 ml soluție 0,5-1%, în 15-20 minute, cu monitorizarea tensiunii arteriale, frecvenței cardiace și a respirației.

PROCAINA-NOVOCAINA

Efecte adverse:

toxicitatea hepatică marcată
manifestările alergice, accidentele circulatorii, cu hipotensiune arterială (prin vasodilatație arteriolară și venulară), colaps, stop cardiac,
fenomenele excitatorii nervoase (chiar convulsii la doze mari sau administrare intravenoasă rapidă),
paralizia respirației,
antagonizarea efectului antibacterian al sulfamidelor

Ex.
Rp/ Procaina 4%
fiole III
DS inj, prin infiltratie locala, 1 fi la nevoie

CLORPROCAINA (Nescaina)

- cea mai scurta durata de actiune, cu debut rapid, in 3-5 minute;
- anestezie de infiltratie in ginecologie, ca solutie 2%-bloc paracervical
- in anestezia epidurala, solutie 0.75%, in cazul nasterii pe cale naturala

BENZOCAINA (Anestezina, Anbesol, Orajel)

- Benzocaina este un ester al acidului paraaminobenzoic cu etanolul, folosit în exclusivitate în anestezia de suprafață, aplicat pe tegumentele și mucoasele lezate.

Se indică în gingivite, stomatite, arsuri tegumentare, ragade, fisuri anale, sub formă de tablete pentru supt, soluții, unguente și, respectiv, supozitoare, cu 0,5% benzocaină.

Sub formă de poțiuni, 0,5-1% benzocaină, în epigastralgie și vărsături prin iritație gastrică.

Ex.

Rp/ Benzocaina

Pulbere 10g

DS extern, aplicatii locale x2/zi

TETRACAINA

Tetracaina, ca și procaina, este un ester al acidului paraaminobenzoic.

Are acțiune anestezică locală instalată lent (5-10 minute de la administrarea locală) și de durată mare (3-4 ore).

Se administrează topic, sub formă de unguente sau soluții cu 0,5% tetracaină, în afecțiuni oftalmologice sau sub formă de soluții 2%, în afecțiuni ale mucoasei nazale sau faringiene.

Se indică și în anestezia prin infiltrație, sub formă de soluție 0,1-0,2%.

ARTICAINA (Ultracaine, Astracaine, Septonest)

- anestezia cu Articaina 4% și Adrenalina 2/100.000 este similară administrării de Lidocaina 2% cu Epinephrine 1/100.000 (2-3 ore);
- max. 7 mg/kg.

ANESTEZICE LOCALE CU STRUCTURĂ AMIDICĂ

Lidocaina (xilina)

Lidocaina este un anestezic local cu structură amidică, activ în toate tipurile de anestezie locală, inclusiv anestezia de contact (sub formă de soluție 2-4% sau unguent cu lidocaină 5%).

Are potență mai mare decât procaina, durata anesteziei locale fiind de 1-1,5 ore. Efectul se instalează la 2-5 minute de la administrarea prin infiltrație a soluției de lidocaină 1% sau intrarahidiană (soluție 4%) și după 10-15 minute, în cazul anesteziei plexale (soluție 2%).

- indicații: toate tipurile de anestezie

- de suprafață- spray cu Lidocaina 5-10%, plasture 2,5-5%;
- anestezia prin infiltrație – 5-50 ml din soluția 1% sau 2%
- blocaj nervos , 3-5 ml -2%;
- rahianestezie– 1,5-2 ml din sol. 4%;
- în adm IV , 5-10 ml din sol 1% -antiaritmice pentru prevenirea aritmiilor

ventriculare din IMA, chirurgia CV, cateterizare etc

Fi 1% 5/10 ml

Fi 2% 2 ml

FI 4% 2ml

Efectele adverse, apărute după administrarea lidocainei ca anestezic local, includ: somnolență, amețeli, paretezii, dezorientare, fasciculații musculare, mai rar reacții alergice și excepțional hipertermie malignă.

În caz de supradozare (doza maximă este de 4 mg/kg corp/zi) sau administrare intravenoasă rapidă, lidocaina poate determina convulsii, tahicardie, tahipnee, hipertensiune arterială, urmate de comă, bradicardie, hipotensiune, deprimare respiratorie.

Ex.

Rp/Lidocaina 2%

fiole III

DS inj, prin infiltratie locala, 1 fiola

Bupivacaina

Bupivacaina are potență mare și efect prelungit (4-8 ore), datorită liposolubilității marcate. Efectul anestezic local se instalează lent (10-15 minute de la administrare).

Soluția 0,125% conferă analgezie moderată, fără relaxare musculară, fiind indicată în anestezia peridurală cu infuzie continuă și în realizarea analgeziei în cursul nașterii naturale

ROPIVACAINA (Naropin)

- indicații similar cu bupivacaine, dar risc de cardiotoxicitate cu 50% mai redus
- rahianestezie sau epidurală, soluție 1%

PRILOCAINA (Cytanest, Xylonest)

- latență și durată > comparativ cu **Lidocaina**;
- indicații: anestezia prin infiltratie, blocaj nervos, anestezia regională IV, soluție 0,5-1%
- max 7 mg/kg (methemoglobinemie).

MEPIVACAINA (Carbocaine, Polocaine)

- durata medie de actiune
- indicatii: anestezia prin infiltratie locala, blocaj nervos, epidurala, solutie 1-2%
- maxim 7 mg/kg (max 1000 mg/zi).

ANTIISTAMINICE H₁ (AH₁)

Reprezintă o clasă de substanțe care antagonizează, competitiv, fixarea histaminei pe receptorii H₁.

În funcție de cronologia sintezei principalelor preparate antihistaminice, acestea se clasifică în:

- antihistaminice H₁ din prima generație**, care generează și efecte la nivel SNC și de tip anticolinergic;
- antihistaminice H₁ din a doua generație**, care nu penetrează bariera hematoencefalică (BHE), și nu produc efecte anticolinergice.

- in procesul alergic, antihistaminicele H1 amelioreaza edemul si pruritul, fara efect asupra bronhospasmului sau hTA
- Dozele uzuale ale antihist. H1 din prima generatie produc sedare, somnolenta sau chiar efect hipnotic
- dozele mari pot induce fenomene excitatorii-iritabilitate, neliniste, convulsii, coma
- antihistaminicele H2 din a doua generatie sunt lipsite de efectele adverse de tip sedare
- Pot de asemenea determina:
 - efect antiemetic –derivatii de fenotiazina;
 - efect neuroleptic (Prometazina);
 - efect antiparkinsonian (Ciproheptadina, Difenhydramina);
 - efecte anticolinergice (cresterea vascozitatii secretiilor);
 - efect antiaritmic (Antazolina);
 - efect antiserotoninergic (Ciproheptadina);
 - efect de tip anestezic local (Prometazina si Difenhidramina prin bocarea canalelor de Na^+).

Indicatii

- rinita, conjunctivita alergica;
- reactii alergice cutanate;
- reactii alergice sistemice (boala serului, reactii transfuzionale, angioedem);
- pruritul din dermatita atopica sau dermatita de contact
- soc anafilactic, asociat adrenalinei sau GC;
- greata, varsaturile din raul de miscare;
- in scop sedative, hypnotic, neuroleptic

Efecte adverse

- cu exceptia celor din a doua generatie, toate induc fenomene inhibitorii la nivelul SNC (sedare, somnolenta, somn hipnotic, scaderea reflexelor, slabiciune musculara, vertij);
- dozele mari fenomene excitatorii SNC, greata, varsaturi, diaree, uscaciunea mucoaselor;
- Pot induce hTA ortostatica, rareori aritmii ventriculare

Prometazina

Este utilizată ca antialergic, dar și ca antiemetic și sedativ.

Are și efect antimuscarinic puternic.

Se absoarbe doar 25% după administrare orală.

Substanța circulă legată puternic de proteinele plasmatică și are un $t_{1/2}$ de 10 ore.

Se administrează oral, 30-90 mg/zi.

Reacțiile adverse sunt rare și constau în sedare, hipotensiune arterială, leucopenie, icter, tulburări extrapiramidale

Ex.

Dg: Rinita alergică

Rp/PrometazinA 0.03g

Drajee X

DS oral, 1 dxx3/zi la nevoie

Clorpiramina

Clorpiramina are efecte antialergic și slab sedativ.

Se administrează oral, 25 mg de 2-4 ori/zi.

Generează rareori reacții secundare, reprezentate mai ales de tulburări digestive și de sedare.

Clorfeniramina

Are acțiuni antialergică puternică, sedativă și anticolinergică slabe.

Se administrează în doze de 10-20 mg/zi.

Generează frecvent sedare.

Ex.

Rp/ Clorfeniramina 0.004g

cpr XXX

DS oral, 1cpr/zi la nevoie

Ciproheptadina

Posedă acțiune anticolinergică moderată, sedativă ușoară și efect anti-5HT₂ redus.

Concentrația plasmatică maximă este atinsă în 6-9 ore și se administrează oral în doză de 4mgx3-4/zi.

ANTIISTAMINICE DIN A DOUA GENERAȚIE

Clemastina

Are efect antialergic puternic.

Străbate în proporție foarte redusă BHE, generând un slab efect sedativ.

Se administrează oral, 1-2 mg/zi.

Ex.Rp/ Clemastina 0.001g

cpr XXX

DS oral, 1 cpr/zi, la nevoie

Astemizolul

Are efect antialergic intens.

Nu posedă acțiuni sedative sau anticolinergice.

Se administrează oral, 10 mg odată pe zi.

$T_{1/2}$ este de circa 20 ore, iar pentru metabolizii săi (cei mai mulți fiind activi) acesta este de 160-480 ore.

Loratidina-Aerius

Reprezintă unul din cele mai noi și mai eficiente antialergice.

Reacțiile adverse <<<<<.

Cpr 10 mg

Ex. Rp/ Loratadina 0.01g

Cpr X

DS oral 1 cpr la nevoie