

Helyi érzéstelenítők farmakológiája



SE Arc-Állcsont-Szájsebészeti és Fogászati Klinika
BUDAPEST

Definíció

Farmakokinetika: a gyógyszerek felszívódásának, eloszlásának, metabolizmusának és kiürülésének törvényei


Farmakodinámia: a gyógyszer szervezetre kifejtett hatásával, a gyógyszerválasz folyamatával foglalkozik

Definíció

Helyi érzéstelenítők olyan gyógyszerek, amelyek reverzibilis jelleggel felfüggesztik az idegszövet vezetőképességét anélkül, hogy a tudatot befolyásolnák.

Helyi érzéstelenítők szerkezete

Tercier aminok

- hidrofil centrum
 - lipofil centrum
 - összekötő lánc 
- észter
 - amid
 - éter
 - keton

Helyi érzéstelenítő készítmény =

1. Kémiai érzéstelenítő

2. Érszűkítő

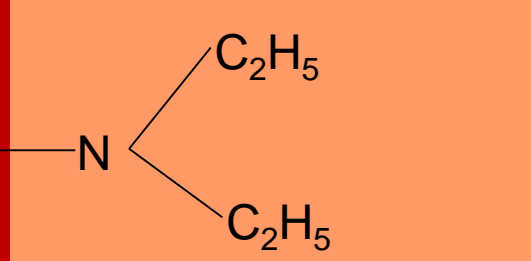
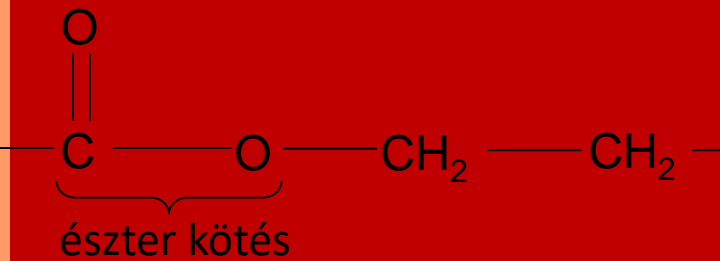
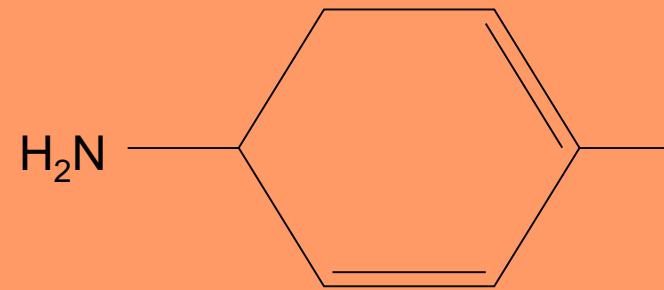
3. Konzerváló anyag

Helyi érzéstelenítők szerkezete

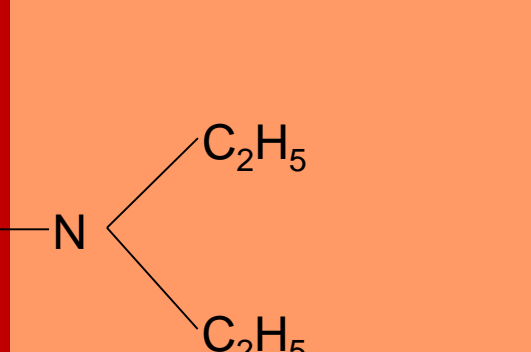
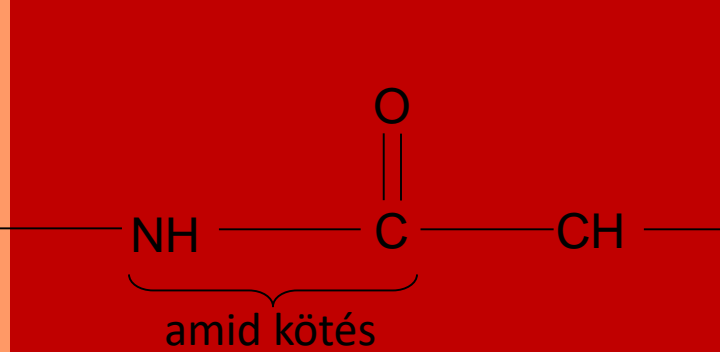
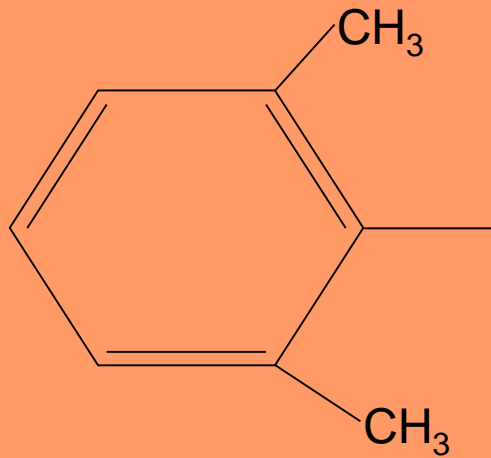
lipofil centrum

közi lánc

hidrofil centrum

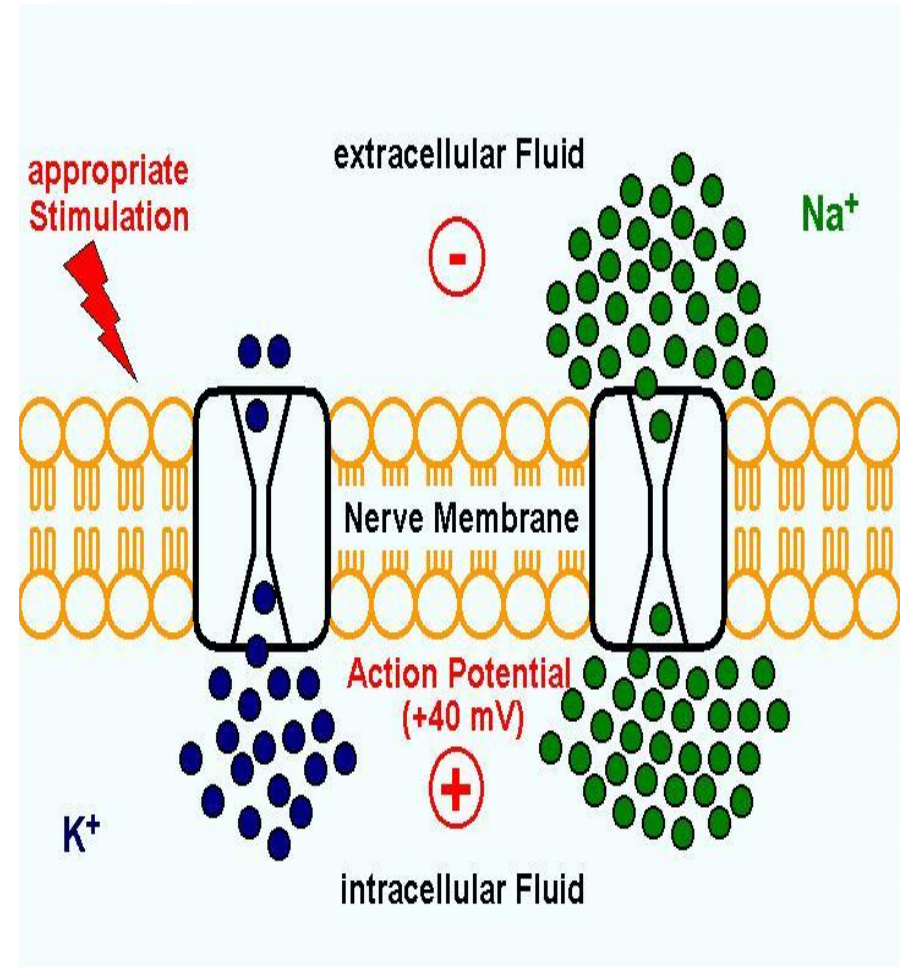
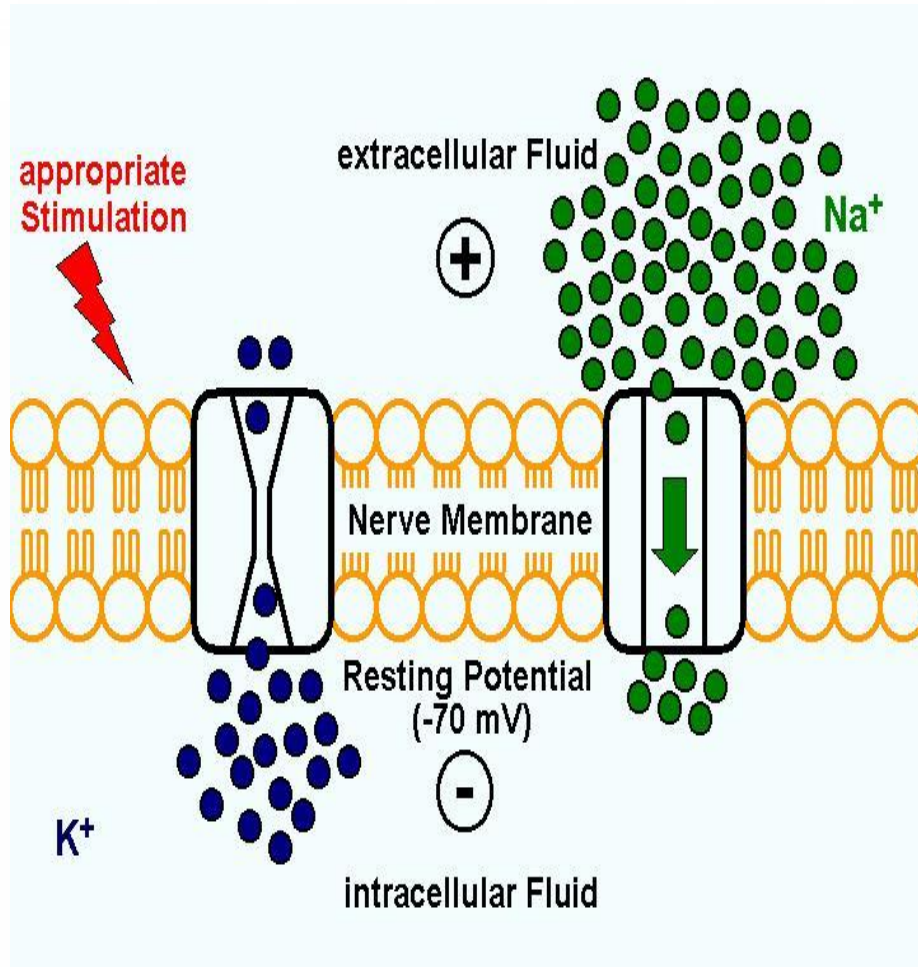


PROCAIN

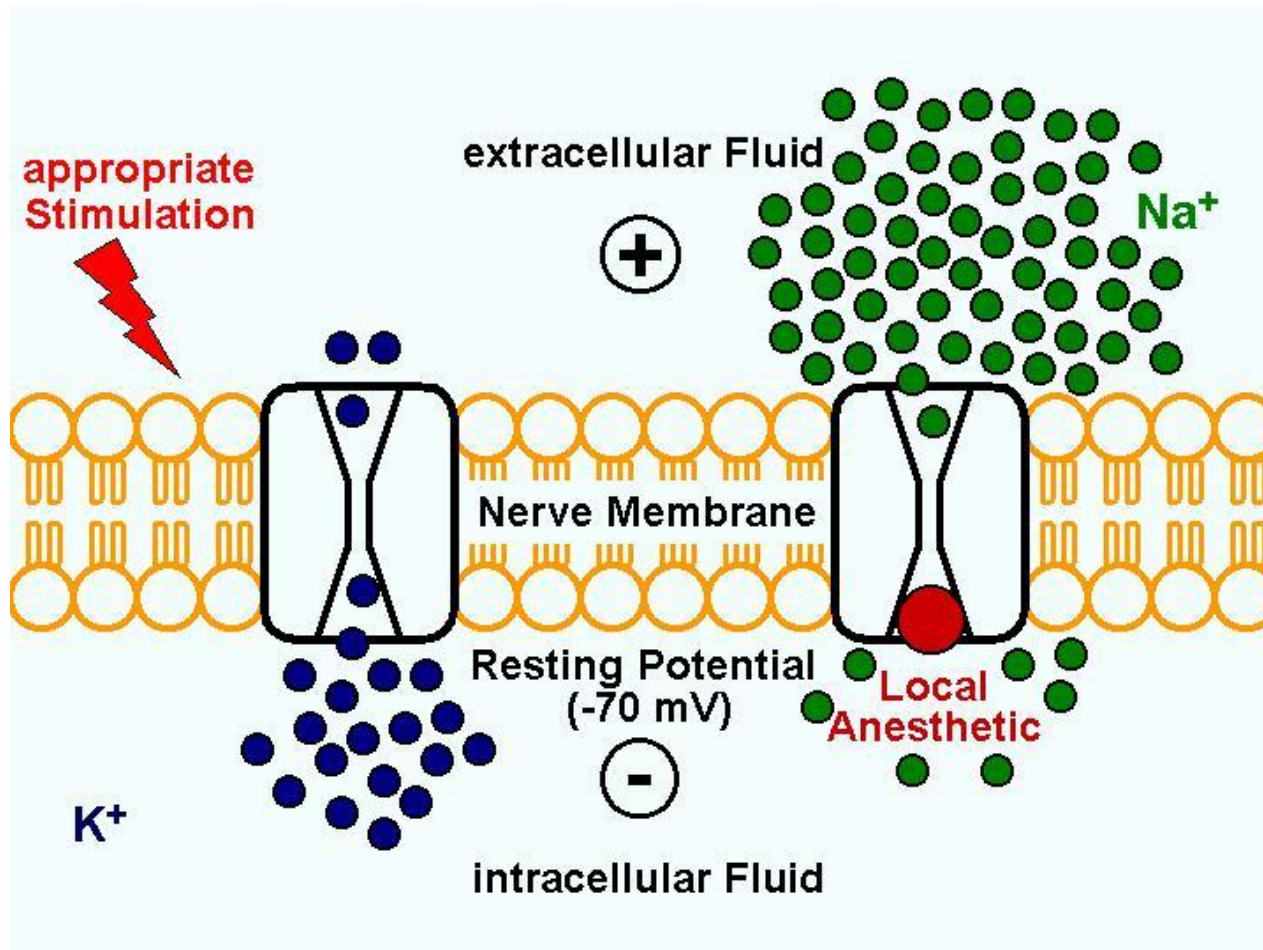


LIDOCAIN

Fiziológiás ingerület vezetés



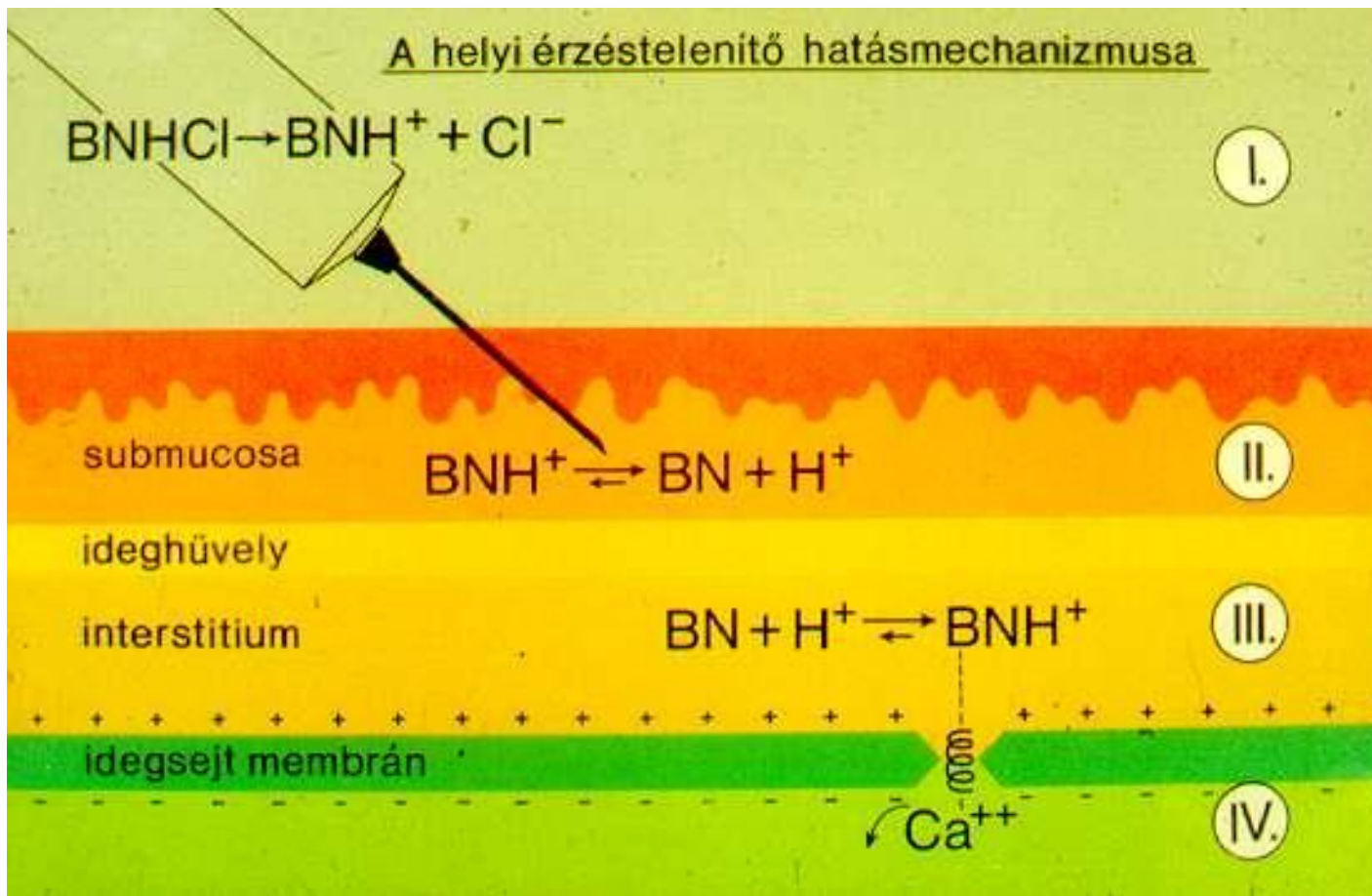
Helyi érzéstelenítő hatása



A helyi érzéstelenítők hatásmechanizmusa


- gyenge bázis
- sósavas sójukat alkamazzuk
- ff Na-csatornák gátlása
- intracellularis térbe be kell jutnia

A helyi érzéstelenítők hatásmechanizmusa



A töltetlen szabad bázis /BN/ koncentrációja függ:

- az érzéstelenítő disszociációs
állandójától /pKa/
- a környezet pH-jától



gyulladás esetén hogyan
változik a pH?

Milyen az „ideális” helyi érezéstelenítő?

1. hatékony
2. nem toxikus, nincs mellékhatása
3. gyors
4. megfelelő hatástartam

Hatáserősség

1. hatékony

**Mértéke: a legkisebb hatékony
koncentráció**

Függ:

- az érzéstelenítőszer lipid oldékonyságától
- az érzéstelenítőszer disszociációs állandójától / PK_a /

Toxicitás

2. nem toxikus

- Terápiás index = $\frac{LD_{50}}{ED_{50}}$

$$\frac{\text{letális adag}}{\text{hatékony adag}}$$

- függ az érzéstelenítő lebomlásának a gyorsaságától

Latencia idő

3. gyors

- az érzéstelenítőszert lipid oldékonyságától és pK_a (disszociációs konstans) értékétől függ
- függ az érzéstelenítés technikájától

Hatástartam

4. megfelelő hatástartam

Függ

- a koncentrációtól
- az erekre gyakorolt hatásától
- fehérjekötődés mértékétől

A magas fehérje kötődés előnyei a helyi érzéstelenítőknél

- terhességben az érzéstelenítő kevésbé jut be a magzati vérkeringésbe
- a kardiovaszkuláris és a központi idegrendszeri hatások kockázata kisebb

Helyi érzéstelenítő készítmény =

1. Kémiai érzéstelenítő

2. Érszűkítő

3. Konzerváló anyag

Vazokonstriktorok

Miért?

- kiserek vazokonstriktója
- vérzés mértéke csökken
- relatív toxicitás csökken
- hatástartam, hatásereőség nő

Vazokonstriktorok

Mit?

- adrenalin
- noradrenalin
- corbasil

Vazokonstriktorok

Mennyit?

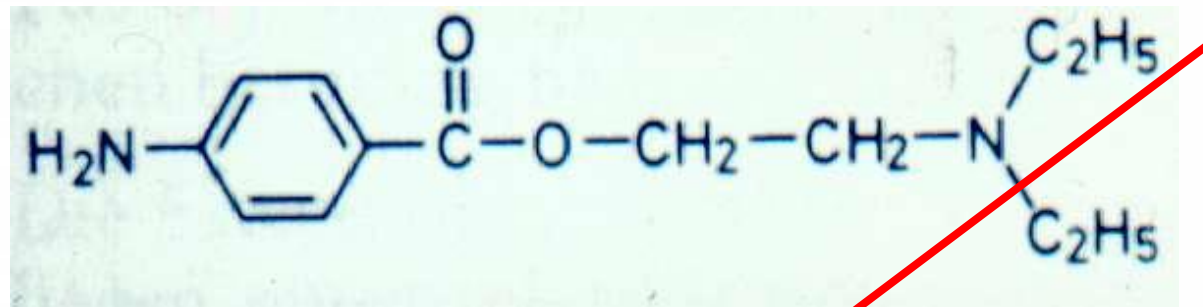
- 2%-os Lidocain, 0,001% Adrenalin
→ 10 mikrogramm adrenalin
- 4%-os Ultracain, 0,00125% Adrenalin
→ 12,5 mikrogramm adrenalin

Vazokonstriktorok

Indikáció

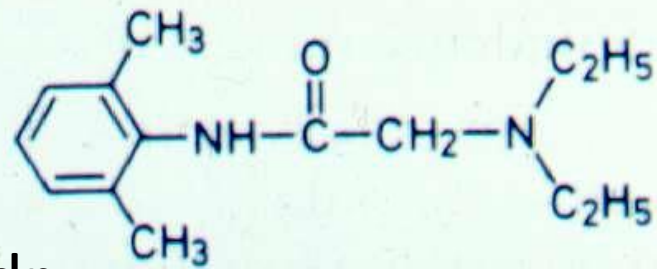
- adrenalin tartalmút ha lehet
Kivéve: akut hipertireózisban
(receptor upregulatio)

Procaïn



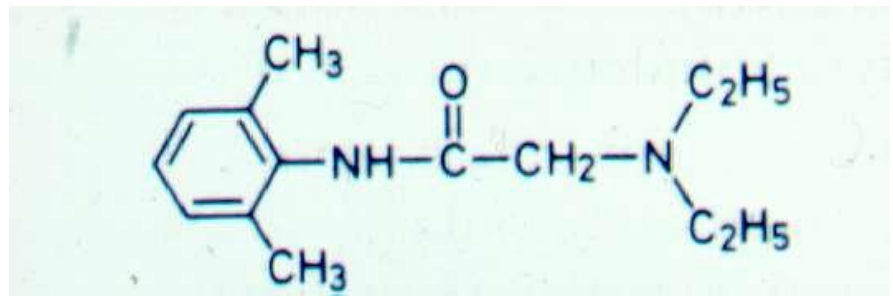
- **Készítmény:** Procainum hydrochloricum /2%/
Corbocain /4%/ + corbadrin
- **Észter**
- **Hatáserősség:** 1
- **Toxicitás:** 1
- **Latencia idő:** 5-10 min.
- **Hatástartam:** 30-40 min.
- **Mellékhatás:** értágító, allergén
- **Maximális dózis:** 500mg

Lidocain



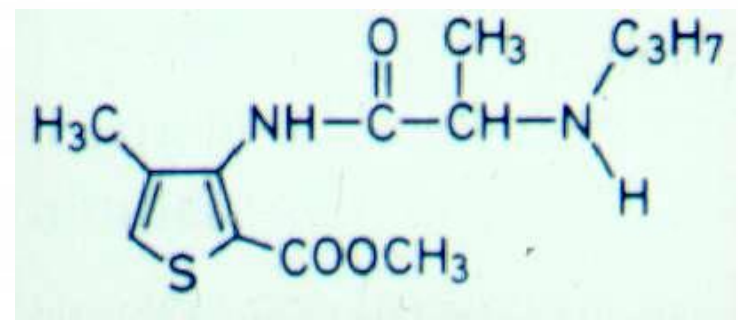
- **Készítmény:** Lidocain 2% c. Adr.
Lidocain kenőcs 5%
Lidocain spray 10%
- **Amid**
- **Hatáserősség:** 2-4
- **Toxicitás:** 2
- **Latencia idő:** 2-3 min.
- **Hatástartam:** 100-200 min.
- **Mellékhatás:** nagyobb dózisban szedatív hatás
- **Maximális dózis:** adrenalin tartalmú 20 mg
adrenalin mentes 10 mg

Lidocain



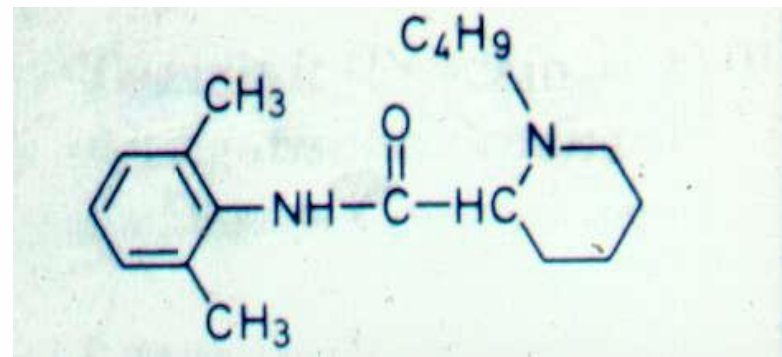
- jó diffúziós képesség
- nyh. Érzéstelenítő tulajdonság
- máj (CYP1A2) enzim bontja
- vesén keresztül ürül
- ritkán allergizál

Articain



- **Készítmény:** Ultracain, 4% DS forte.
Septanest , Ubistesin
- **Észter és amid csoport is**
- **Hatáserősség:** 5
- **Toxicitás:** 1,5
- **Latencia idő:** 2-4 min.
- **Hatástartam:** 180-240 min.
- **Megjegyzés:** kitűnő diffúziós képesség
- **Maximális dózis:** 12,5 ml

Bupivacain



- **Készítmény:** Marcain 0,5% c. Adr.
- **Hatáserősség:** 16
- **Toxicitás:** 8
- **Latencia idő:** 4-6 min.
- **Hatástartam:** 180-540 min.
- **Mellékhatás:** szívritmus zavarok
- **Alkalmazás:** neuralgiáknál, hosszú kezeléseknél

Felületi érzéstelenítésre használt szerek

- Tetracain
- Benzocain

Csak felületi érzéstelenítéshez!!!

Articain előnyei a Lidocainnal szemben a klinikumban

- A gyorsabb metabolizmus miatt ismételt adagok biztonságosabbak**
- Jobb diffúziós képessége miatt, gyulladt szöveteknél és kompakt csontnál jobban alkalmazható**
- Alacsonyabb adrenalin tartalom miatt, „rizikó” pácienseknél biztonságosabb /Ubistesin™
1:200.000/**

HELYI ÉRZÉSTELENÍTŐSZEREK FEHÉRJE KÖTŐDÉSE (%)

LIDOCAIN 64

ARTICAIN 95

BUPIVACAIN 96

