



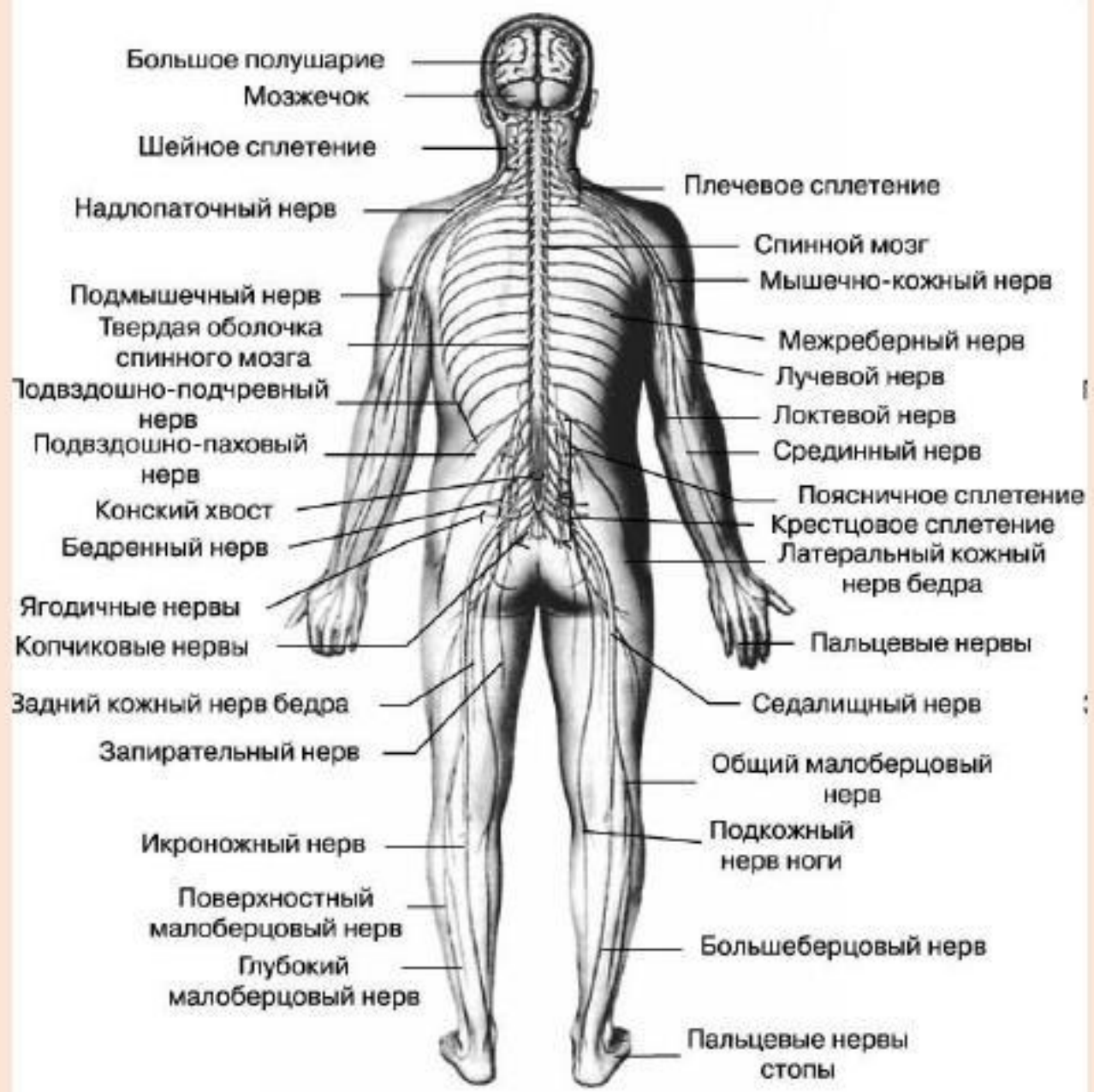
Дисциплина «Фармакология»

Лекция 11

Тема: Средства, влияющие на афферентную нервную систему. Местные анестетики.



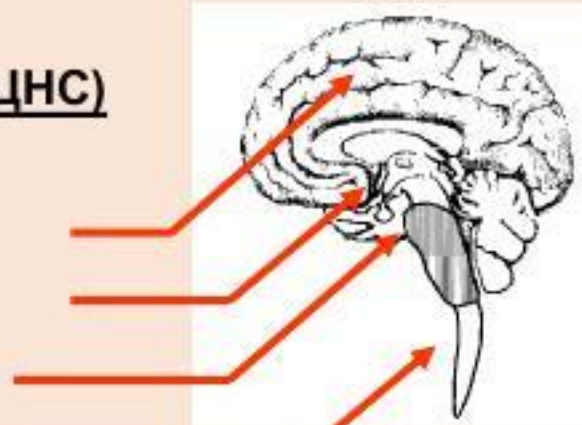
Нервная система человека



НЕРВНАЯ СИСТЕМА – система быстрой регуляции (генерация, переключение, и проведение нервных импульсов).

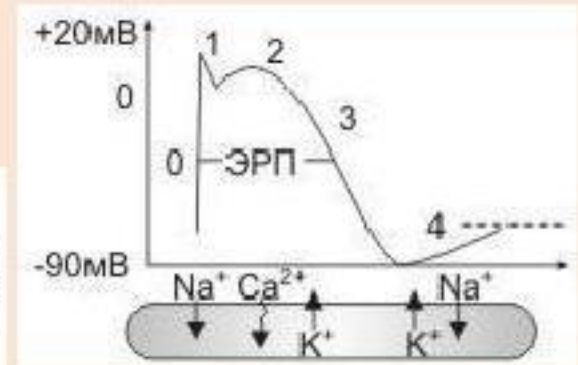
А. Центральная нервная система (ЦНС)

1. Головной мозг:
 - а. Кора головного мозга
 - б. Подкорковые центры
 - в. Продолговатый мозг
2. Спинной мозг



Б. Периферическая нервная система

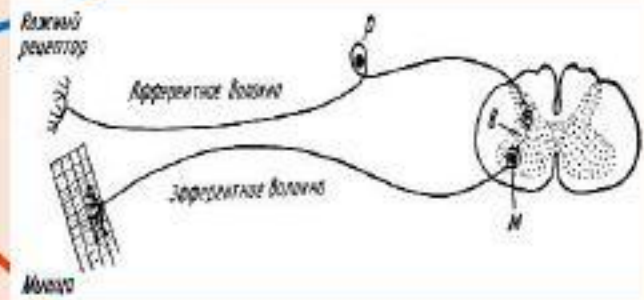
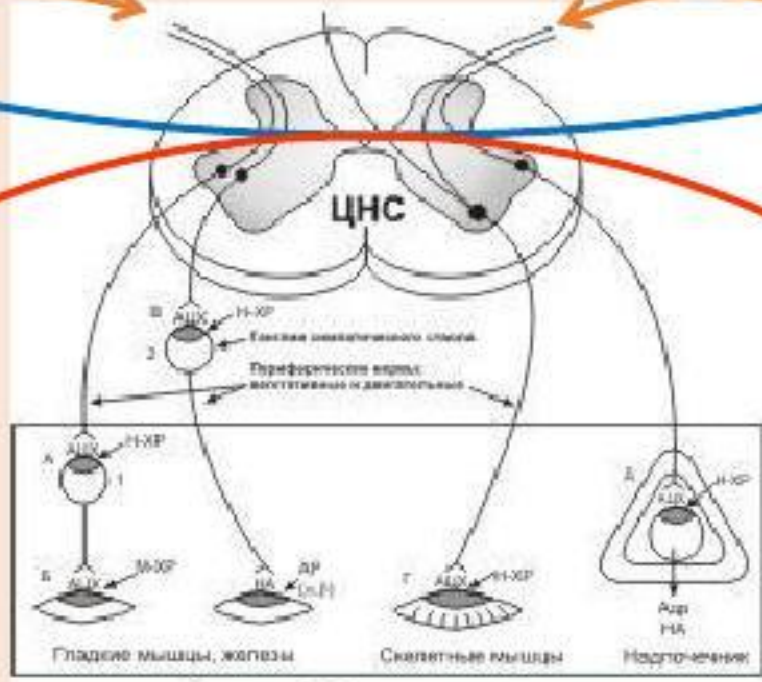
1. Афферентная
2. Эфферентная





Периферическая нервная система

Афферентная (чувствительная) часть



Эфферентная (исполнительная) часть

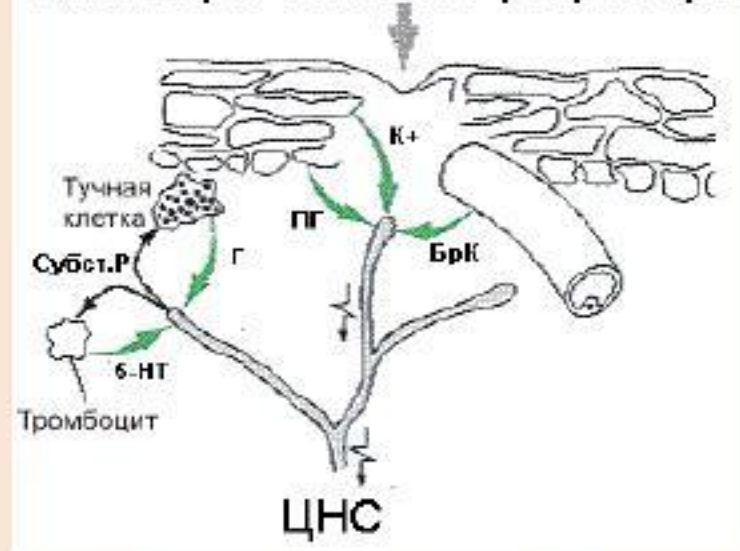
Афферентная иннервация

1. Чувствительные нервные окончания

(рецепторы чувствительных нервных волокон):

- **Болевые** (механо-, хемо-, термо-);
- Тактильные (осязание);
- Вестибулярные (положение тела);
- Слуховые;
- Зрительные;
- Обонятельные;
- Вкусовые (горько, сладко, кисло);
- Температурные.

Активация болевого рецептора



2. Чувствительные волокна

A_β – миелинизированные (35-100 м/с) - от механо- и терморесепторов к мотонейронам передних рогов спинного мозга и в ЦНС (чувство острой локализованной боли).

C – немиелинизированные (0,2-2 м/с) – от хеморесепторов к вегетативным нейронам боковых рогов (симпатический отдел ВНС) и в ЦНС (хроническая нелокализованная боль).

Распространение нервного импульса вдоль миелинизированных и немиелинизированных волокон.



а. В миелинизированных нервных волокнах импульс перескакивает от одного узелка Ранвье к следующему.

б. В немиелинизированных нервных волокнах импульс проходит вдоль всей длины волокна.

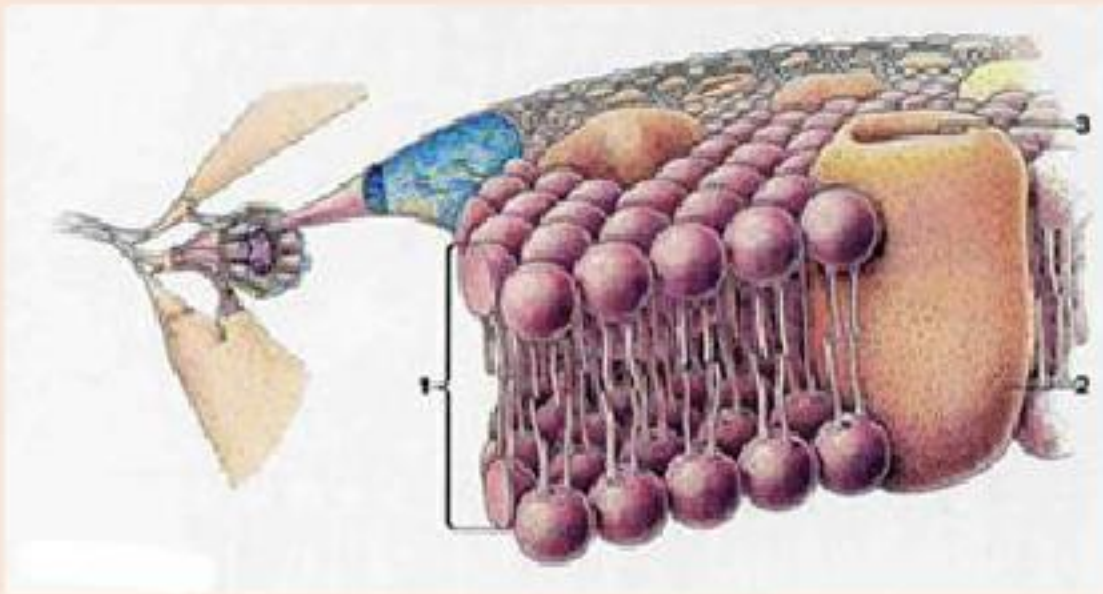
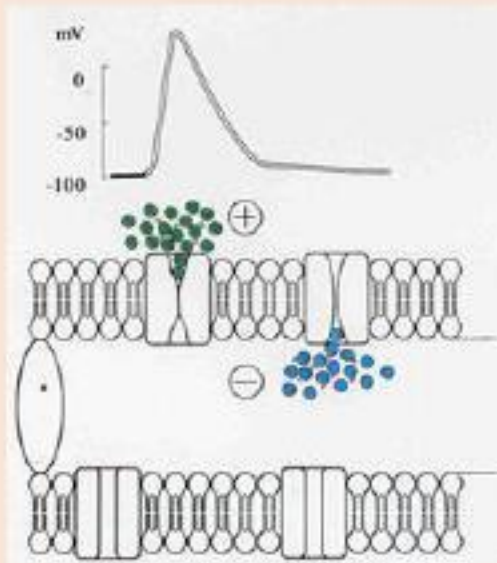
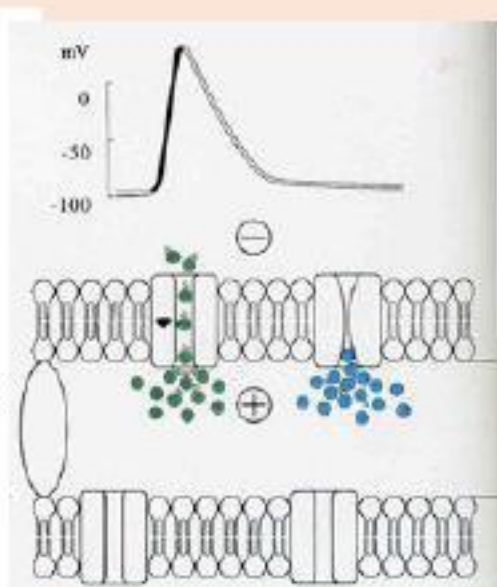


Диаграмма структуры мембраны нервной клетки, которая состоит из липидного бислоя и молекул белка, которые содержат натриевые каналы.

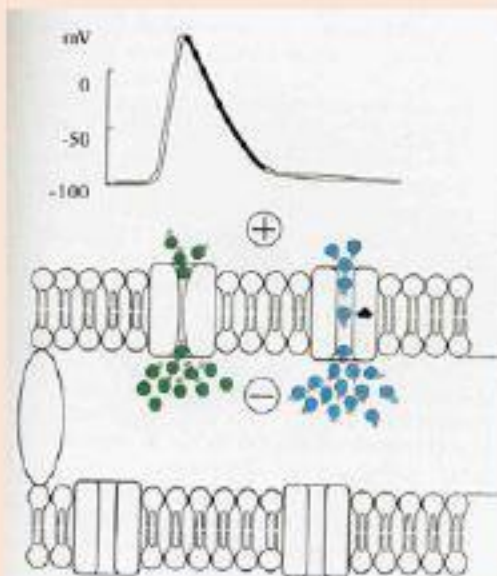
1. Липидный бислой
2. Молекула белка
3. Натриевый канал



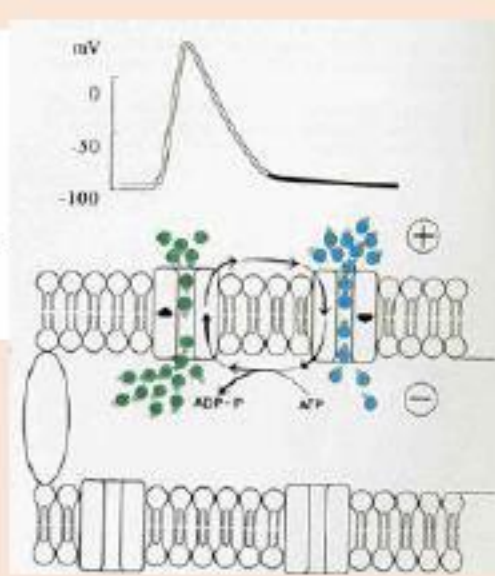
а. Состояние покоя. Нервное волокно полностью поляризовано избытком ионов Na (зеленые) с наружной стороны и ионов K (синие) с внутренней стороны мембраны.



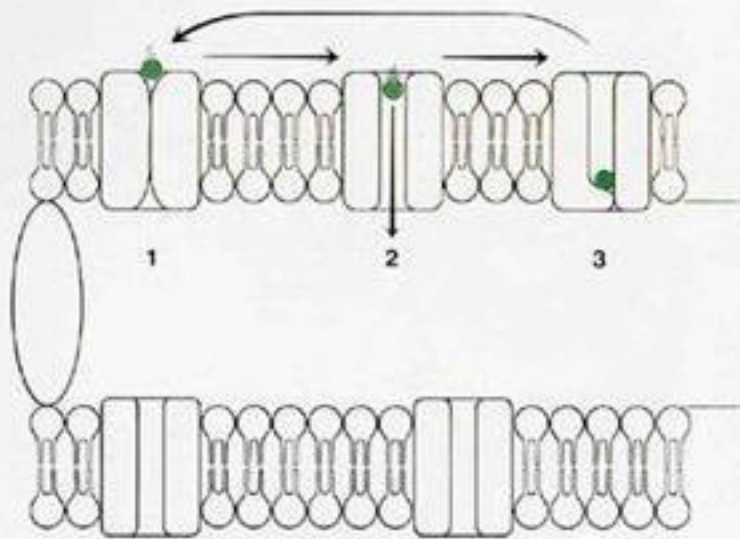
б. Деполяризация происходит из-за движения ионов Na внутрь клетки.



с. Реполяризация происходит из-за движения ионов K наружу из клетки



д. Нервное волокно полностью поляризовано. Натрий-калиевый насос возвращает ионы на исходные позиции.



Различные состояния натриевого канала.

1.Закрытый.

2.Открытый.

3.Инактивированный.

В покое канал закрыт, так что ни ионы натрия, ни молекулы препарата не могут проникнуть в него. Стимуляция нерва открывает канал, позволяя ионам натрия пройти внутрь. С завершением фазы деполяризации прежде, чем вернуться в закрытое состояние покоя, канал проходит фазу инактивации.

По фактору действия ЛС, влияющие на афферентную иннервацию, делятся на вещества угнетающего и стимулирующего типа.

ЛС угнетающего типа могут действовать следующим образом:

- а) снижать чувствительность окончаний афферентных нервов;
- б) предохранять окончания чувствительных нервов от воздействия раздражающих агентов;
- в) угнетать проведение возбуждения по афферентным нервным волокнам.

ЛС стимулирующего типа действия избирательно возбуждают окончания чувствительных нервов.

Средства, влияющие на афферентную иннервацию

I. Снижающие чувствительность нервных окончаний

- Адсорбирующие
- Обволакивающие
- Вяжущие
- Местные анестетики



II. Повышающие чувствительность нервных окончаний

- Раздражающие
- Отхаркивающие
- Горечи
- Слабительные
- Желчегонные

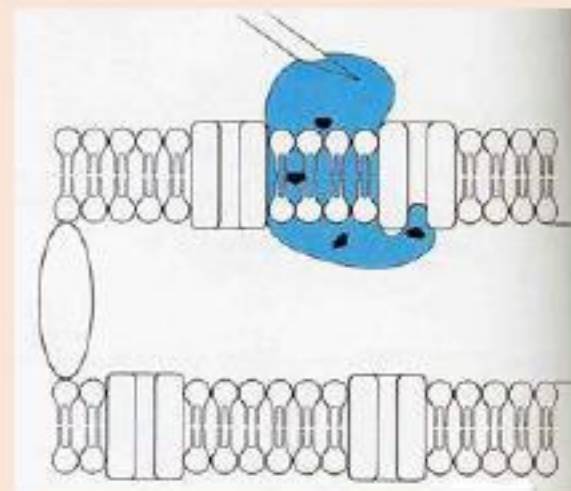
МЕСТНЫЕ АНЕСТЕТИКИ

Анестезирующие средства вызывают **местную потерю чувствительности**.

В первую очередь они **устраняют чувство боли**, в связи с чем их используют главным образом для местного обезболивания (местной анестезии). При повышении концентрации местные анестетики угнетают другие виды рецепторов (температурные и др.).

Механизм действия:

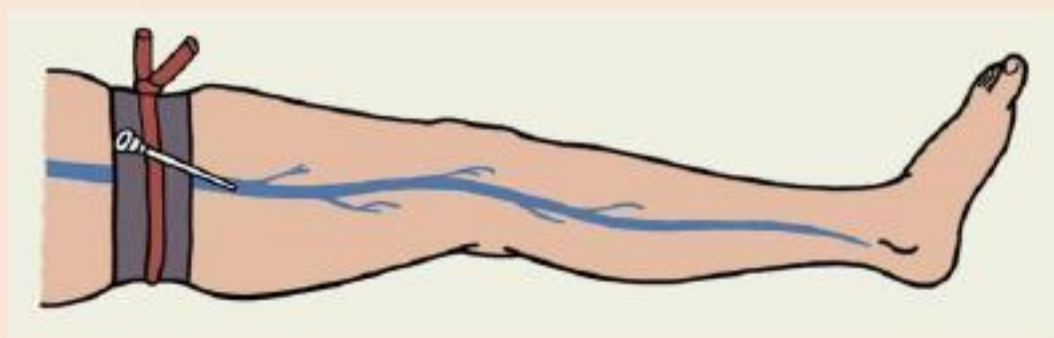
Воздействуя на окончания чувствительных нервов и нервные волокна, анестетики препятствуют регенерации и проведению возбуждения. МА угнетают проведение импульсов по афферентным (чувствительным) нервным волокнам, связанное с тем, **что анестетики понижают проницаемость клеточных мембран для ионов натрия**, т.е. являются **блокаторами натриевых каналов**.



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

Требования, предъявляемые к местным анестетикам:

- должны иметь высокую избирательность действия, не оказывая раздражающего действия на ткани.
- должны обладать коротким латентным периодом.
- должны обладать достаточной эффективностью для проведения различных видов вмешательств.
- желательно, чтобы они суживали кровеносные сосуды (или хотя бы не расширяли их) либо сочетались с сосудосуживающими средствами. Сужение сосудов усиливает местную анестезию, уменьшает кровотечение из тканей, а также возможность токсических эффектов, задерживая всасывание анестетика.



Внутривенная местная анестезия

Виды местной анестезии

1. поверхностная или терминальная, когда анестетик наносится на кожу или слизистые оболочки, где он блокирует местные окончания чувствительных нервов; кроме того анестетик может наноситься на язвенную или ожоговую поверхность.
2. инфильтрационная анестезия - когда раствором анестетика последовательно пропитывают кожу и более глубоко лежащие ткани, через который пройдет операционный разрез; при этом анестетик блокирует нервные волокна, а также окончания чувствительных нервов;
3. проводниковая или регионарная анестезия – анестетик вводят по ходу нерва; при этом происходит блокада нервного волокна, а также окончания чувствительных нервов. Разновидностью проводниковой анестезии является спинномозговая анестезия, при которой анестетик вводят субарахноидально, и эпидуральная (перидуральная) анестезия - анестетик вводят в пространство над твердой оболочкой спинного мозга. При проводниковой и эпидуральной анестезии анестетик воздействует на передние и задние корешки спинного мозга.

Классификация по виду анестезии

1. Средства для терминальной анестезии:

- Дикаин
- Анестезин



2. Средства преимущественно для инфильтрационной анестезии:

- Новокаин
- Тримекаин



3. Средства для всех видов анестезии:

- Лидокаин (Ксикаин)
- Ультракаин ДС



Классификация по химическому составу

Комбинированные препараты, содержащие Адреналин и Норадреналин («Ультракаин ДС»);

а) эфиры ароматических кислот: Тетракаин (Дикаин), Бензокаин (Анестезин), Прокаин (Новокаин);

б) амиды ароматических аминов: Ксикаин (Лидокаин), Мезокаин (Тримекаин), Ультракаин (Артикаин), Маркаин (Бупивакаин).



Анестезин (Anaesthesinum) син. Бензокаин (Benzocainum)

Анестезин - одно из самых первых синтетических соединений, применяемых в качестве местноанестезирующих средств. Несмотря на более чем 100-летнее существование (синтезирован в 1890 г; применяется с конца 90-х годов), его до сих пор относительно широко используют самостоятельно и в сочетании с другими лекарственными средствами.

Анестезин является активным поверхностным местноанестезирующим средством. В связи с трудной растворимостью в воде препарат не применяют парентерально и для обезболивания при хирургических операциях. Однако его широко используют в виде мазей, присыпок и других лекарственных форм при крапивнице, заболеваниях кожи, сопровождающихся зудом, а также для обезболивания раневой и язвенной поверхности. Применяют 5 - 10 % мази или присыпки и готовые лекарственные препараты ("Меновазин", "Ампровизоль" и др.)



Анестезин (Anaesthesinum) син. Бензокаин (Benzocainum)

Показания. При *заболеваниях прямой кишки* (трещины, зуд, геморрой) назначают свечи, содержащие 0,05 - 0,1 г анестезина. Для анестезии слизистых оболочек применяют 5 - 20 % масляные растворы. Внутрь принимают в порошках, таблетках и слизистых микстурах для обезболивания слизистых оболочек при спазмах и болях в желудке, повышенной чувствительности пищевода и т.д.

Применение Анестезина: 0,3 г 3 - 4 раза в день; для детей: до 1 года - 0,02 - 0,04 г, 2 - 5 лет - 0,05 - 0,1 г, 6 - 12 лет - 0,12 - 0,25 г. Высшие дозы для взрослых внутрь: разовая 0,5 г, суточная 1,5 г.

Формы выпуска: порошок; таблетки по 0,3 г; 5 % мазь. Входит в состав комбинированных таблеток и свечей (см. "Анестезол"). Недавно предложен новый аэрозольный препарат "Ампровизоль", содержащий анестезин.

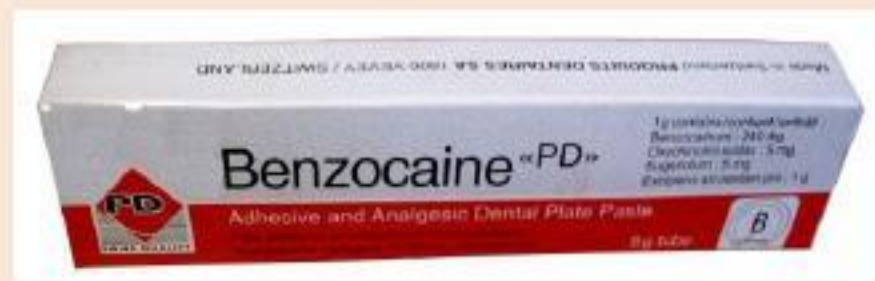


Rp.: Tab. Anaesthesini 0,3 N. 10
D.S. По 1 таблетке 3 раза в день

Rp.: Supp. "Anaesthesol" N 10
D.S. По 1 супп. Ректально 2 раза в
день

Rp.: Tab. Benzocaini 0,3 N. 10
D.S. По 1 таблетке 3 раза в день

Rp.: Ung. Benzocaini 5 % - 20,0
D.S. Наружное



■ ДИКАИН (Dicainum)

Синоним: Тетракаин и др.

Фармакологическое действие. Сильное местноанестезирующее средство, значительно превосходящее по активности новокаин, однако обладающее **высокой токсичностью** (в 2 раза токсичнее кокаина и в 10 раз — новокаина).

Показания к применению. Спинномозговая и поверхностная анестезия.

Способ применения и дозы. В офтальмологической практике при измерении внутриглазного давления используется в виде 0,1% -ного раствора (по одной капле 2 раза с интервалом в 1—2 минуты).

Побочное действие. Контактный дерматит, жжение и боль в месте аппликации. При инъекционном введении — возбуждение или депрессия.

Форма выпуска. Порошок, 0,3% -ный раствор (глазные капли) во флаконах по 5 и 10 мл. пленки глазные с дикаином в пеналах (№ 30).



Новокаин (Novocainum)

Син. Прокаин (Procaini hydrochloridum)

Фармакологические свойства. Имеет умеренную анестезирующую активность и большую широту терапевтического действия. Являясь слабым основанием, **блокирует Na⁺- каналы.**

Показания. *Все виды анестезии, кроме поверхностной* (Инфильтрационная, проводниковая, эпидуральная и спинномозговая анестезия; вагосимпатическая и паранефральная блокада; болевой синдром при язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки, геморрой, тошнота.)

Продолжительность при инфильтрационной анестезии 30-60 мин, обладает низкой токсичностью, плохо проникает через слизистые оболочки, поэтому для терминальной анестезии практически не используют.

Не суживает сосуды, поэтому его нередко сочетают с адреномиметиками. При всасывании новокаина из места введения он оказывает гипотензивное действие, результат угнетающего действия на ЦНС и симпатические ганглии, а также кратковременные антиаритмическим действием. Малотоксичен. Вызывает незначительное снижение АД.



Новокаин (Novocainum)
Прокаин (Procaini hydrochloridum)

Побочное действие:

головокружение, гипотония, иногда
аллергические реакции.

Форма выпуска. порошок, ампулы по 5 и 10 мл 0, 25% и
0, 5 % раствора; суппозитории по 0, 1.

Входит в состав препарата “Меновазин” (комбинированный
препарат, содержащий анестезина 1 г., новокаина 1 г, ментола
2,5 г и спирта этилового до 100 мл.).



Rp.: Procaini hydrochloridi 0,5
Aq. Dest. Ad 200 ml
M.D.S. По 1 ст.ложке 3 раза в сутки

Rp.: Sol. Novocaini 2 % 2 ml
D. t. d. N. 6 in ampull.
S. Для проводниковой анестезии.

Rp.: Sol. Novocaini 0,5 % 20 ml
D. t. d. N. 6 in ampull.
S. Для инфильтрационной анестезии.

Rp.: Novocaini 0,1
D. t. d. N. 10 in supp.
S. По 1 свече в прямую ки



Лидокаин (Lidocainum), ксикаин, ксилокаин

Универсальный местный анестетик. Используют для всех видов анестезии. Лидокаин действует более длительно, чем новокаин.

Оказывает при в/в введении антиаритмическое действие.

Является самым сильным МА средством, применяемым для поверхностной анестезии (1-5%) инфильтрационной (0,25-0,5%), проводниковой (0,5-2%) растворы. Он в 4 раза превосходит новокаин по активности и лишь немного токсичнее его.

Форма выпуска. ампулы по 10 мл 1 % и 2 % раствора, аэрозоль во флаконах по 65 г (3, 8 г лидокаина).

Rp.: Sol. Lidocaini hydrochloridi 2 % - 2 ml

D. t. d. N. 10 in ampull.

S. Для инфильтрационной анестезии
для проводниковой анестезии
(1 % раствор, 25-50 мл).



Ультракаин ДС (Ultracain)

оказывает быстрое и сильное анестезирующее действие. Применяют для поверхностной, инфильтрационной и проводниковой анестезии.

Противопоказания: пароксизмальная тахикардия, мерцательная аритмия, глаукома, аллергия.

Побочные действия

Аллергические реакции: покраснение кожи, зуд, конъюнктивит, ринит, отек Квинке, крапивница, затруднение дыхания вплоть до анафилактического шока.

Способ применения и дозы

Путь введения зависит от вида проводимой анестезии. Дозу устанавливают индивидуально с учетом тяжести и продолжительности оперативного вмешательства. Разовая максимальная доза — 5–6 мг/кг массы тела.

Форма выпуска. ампулы по 10 мл - 2 %, 2 мл - 5 %



Спасибо за внимание