

# LOKALNI ANESTETICI

# VRSTE LOKALNE ANESTEZIJE

**Tablica 43.2.** Načini administracije, uporaba i nepoželjni učinci lokalnih anestetika (LA)

| Način administracije                     | Uporaba   | Lijekovi  | Napomene i nepoželjni učinci  |
|--|---|---|---|
| <b>površinska anestezija</b>             | nos, usta, bronhalno stablo (obično u obliku spreja), rožnica, mokraćni sustav nema učinka na kožu <sup>a</sup>   | lidokain, tetrakain (ametokain) dibukain, benzokain | postoji opasnost od sistemske toksičnosti pri primjeni visokih koncentracija i obuhvaćenosti velikih područja   |
| <b>infiltracijska anestezija</b>         | direktna injekcija u tkiva da bi se dosegli živčani ogranci i završeci rabi se pri manjim kirurškim zahvatima   | većina  | <b>epinefrin (adrenalin) ili felipresin</b><br>često se dodaju kao vazokonstriktori (ali ne za prste ili palce zbog straha od razvoja ishemičnog oštećenja tkiva)<br>pogodno samo za manja područja; u suprotnom ozbiljna opasnost od sistemske toksičnosti                                     |
| <b>intravenska regionalna anestezija</b> | LA injicirani intravenski distalno od prekida cirkulacije učinkoviti su do ponovne uspostave cirkulacije rabe se za kirurške zahvate na ekstremitetima  | uglavnom lidokain, prilokain                        | postoji opasnost od sistemske toksičnosti ako se manšeta prerano otpusti; opasnost je mala ako se manšeta ostavi napuhana najmanje 20 minuta  |
| <b>blok anestezija</b>                   | LA se injicira blizu živčanih debla (npr. brahijalni pleksus, interkostalni ili dentalni živci) da bi se izazvao periferni gubitak osjeta rabi se u kirurgiji, stomatologiji, analgeziji  | većina  | potrebno je manje LA nego za infiltracijsku anesteziju<br>važna je precizna lokacija igle<br>početak anestezije može biti spor<br>trajanje anestezije se može produžiti dodavanjem vazokonstriktora   |
| <b>spinalna anestezija</b>               | LA se injiciraju u subarahnoidni prostor (sadrži CSF) zbog djelovanja na spinalne korjenove ili kralješničnu moždinu ponekad se dodaje glukoza, a da se ograniči širenje LA, bolesnika se nagne rabi se u kirurgiji abdomena, zdjelice ili nogu uglavnom kad se ne može primijeniti opća anestezija | uglavnom lidokain                                   | glavne opasnosti su bradikardija i hipotenzija (zbog simpatičke blokade), depresija respiracije (zbog djelovanja na frenički živac ili respiratorni centar); izbjegava se minimaliziranjem kranijalnog širenja česta je postoperativna retencija mokraće (blokada autonomnog pelvičnog protoka) |
| <b>epiduralna anestezija<sup>b</sup></b> | LA se injiciraju u epiduralni prostor, blokirajući spinalne korjenove rabi se kao i spinalna anestezija, također za bezbolni porođaj  | uglavnom lidokain, bupivakain                       | nepoželjni učinci slični onima pri spinalnoj anesteziji, ali manje vjerojatni zbog ograničenja longitudinalnog širenja LA česta je postoperativna retencija mokraće   |

<sup>a</sup>Površinska anestezija ne djeluje dobro na koži, iako je razvijena nekristalična mješavina lidokaina i prilokaina (**euteklična mješavina lokalnih anestetika ili EMLA**) za primjenu na koži, koja izazove potpunu anesteziju za približno jedan sat.

<sup>b</sup>Intratekalna ili epiduralna primjena LA u kombinaciji s opijatima (vidi pogl. 40.) izaziva mnogo učinkovitiju analgeziju nego opijati sami. Potrebna je samo mala koncentracija LA, nedovoljna da izazove znatniji gubitak osjeta ili druge nuspojave. Mehanizam tog sinergizma je nepoznat, ali se postupak pokazao korisnim u liječenju boli.

# LOKALNI ANESTETICI

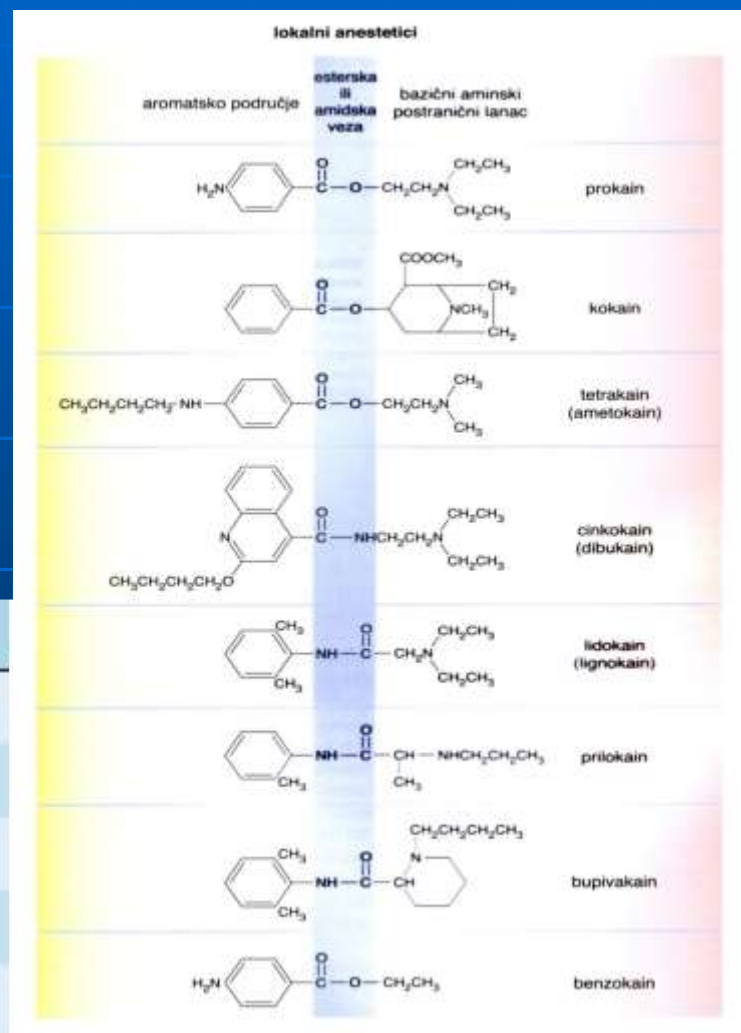
## ■ Esterska grupa:

- kokain, benzokain – esteri benzojeve kiseline
- prokain, tetrakain – esteri parabenzojeve kiseline

## ■ Amidaska grupa:

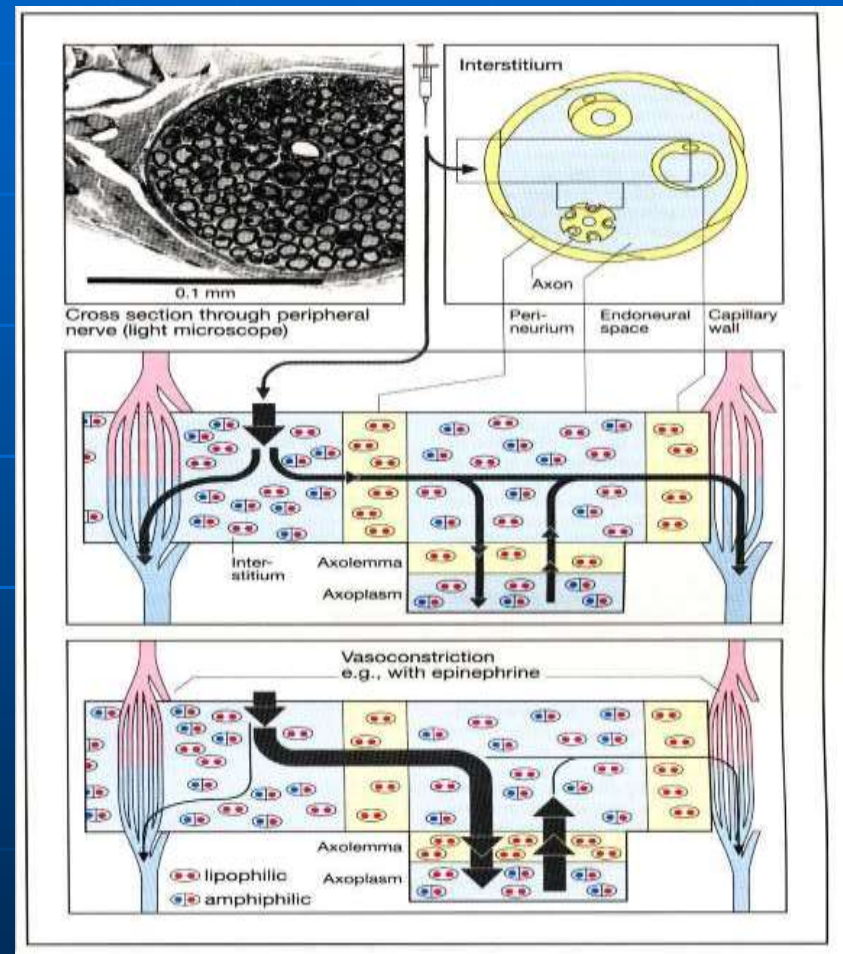
- ksilokain, bupivakain, etidokain

| Tvar       | Poluvijek raspodjele (min) | T <sub>1/2</sub> eliminacije (h) | V <sub>03</sub> (L) | CL (L/min) |
|------------|----------------------------|----------------------------------|---------------------|------------|
| bupivakain | 28                         | 3,5                              | 72                  | 0,47       |
| lidokain   | 10                         | 1,6                              | 91                  | 0,95       |
| mepivakain | 7                          | 1,9                              | 84                  | 0,78       |
| prilokain  | 5                          | 1,5                              | 261                 | 2,84       |
| ropivakain | 23                         | 4,2                              | 47                  | 0,44       |



# LOKALNI ANESTETICI

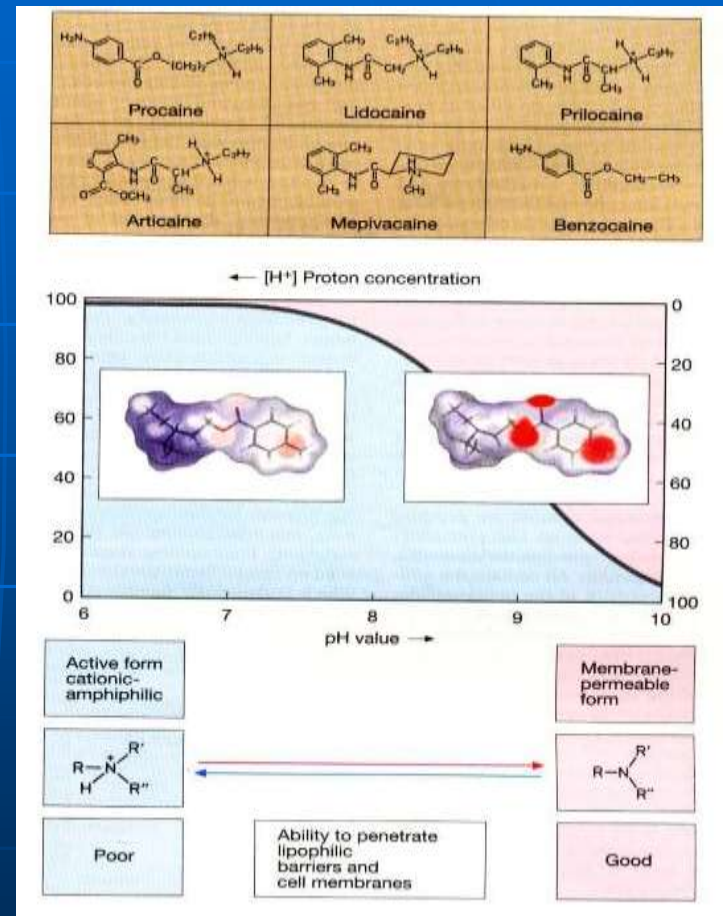
- kokain je prvi lokalni anestetik
- teško prodiru kroz kožu, a prodiru kroz sluznicu
- kombinacija s adrenalinom





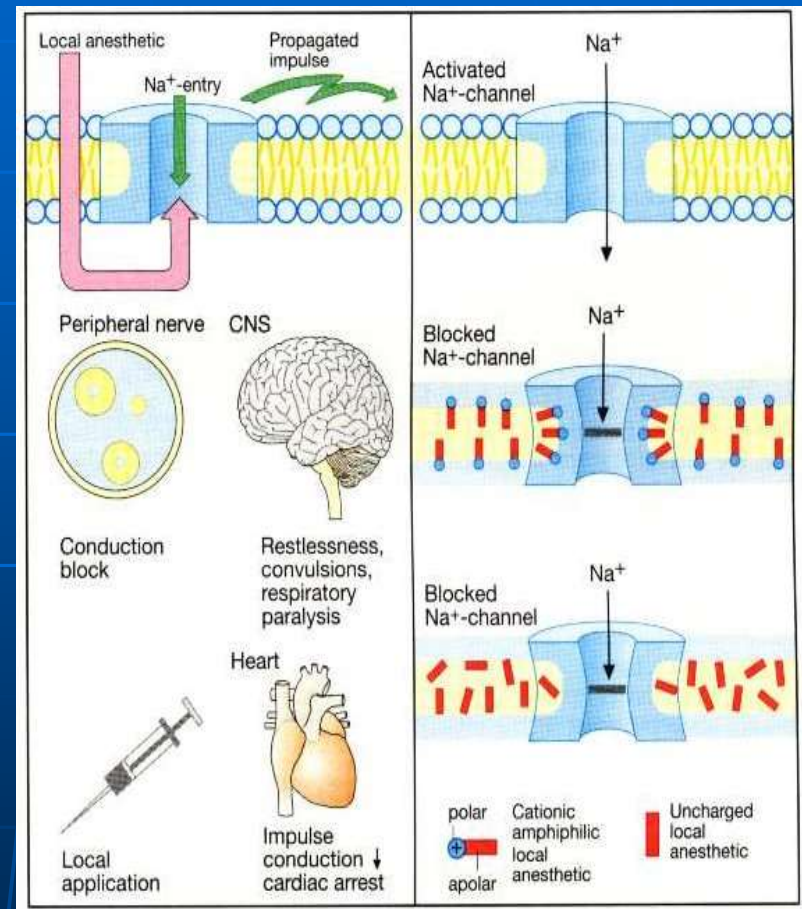
# LOKALNI ANESTETICI

- slabe baze, uglavnom ionizirane
- kod upala pri nižem pH slabije djeluju
- metaboliziraju se u plazmi pseudokolinesterazom (esteri) i mikrosomalnim enzimima u jetri (amidi)
- esteri se brže razgrađuju od amida



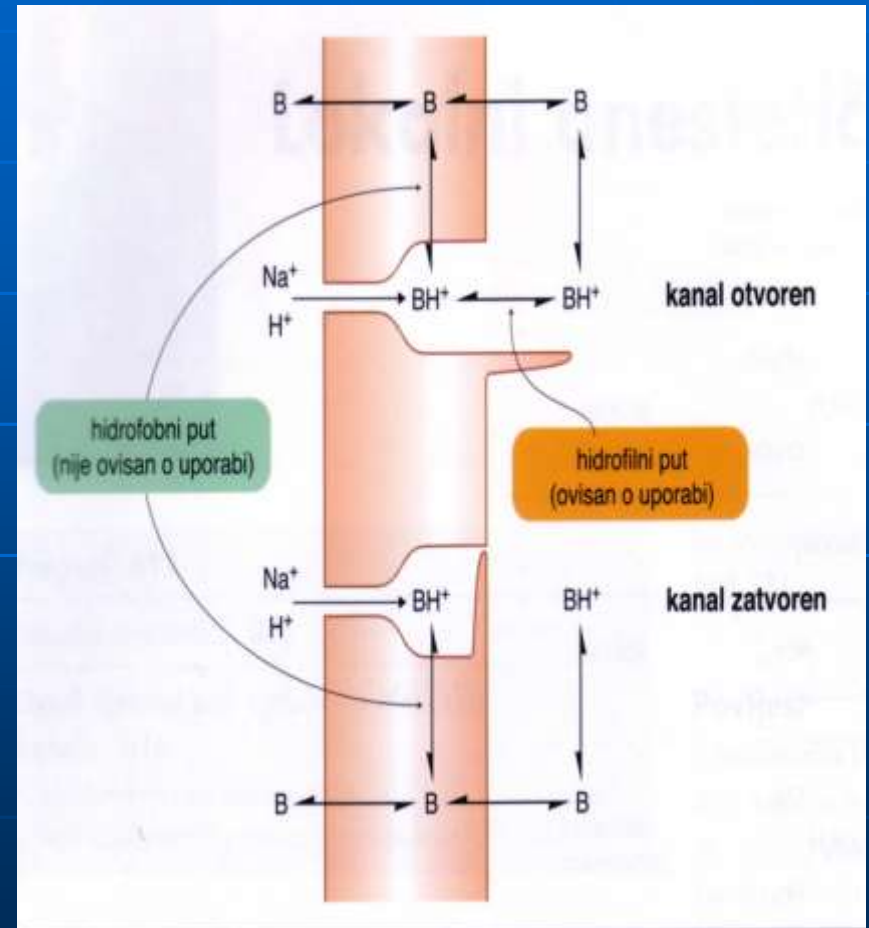
# LOKALNI ANESTETICI

- mehanizam djelovanja:
- sprečavaju prolazak Na iona kroz membranu i onemogućavaju nastajanje akcijskog potencijala (stabilizacija membrane)
- Djeluju na NK i nikotinske receptore



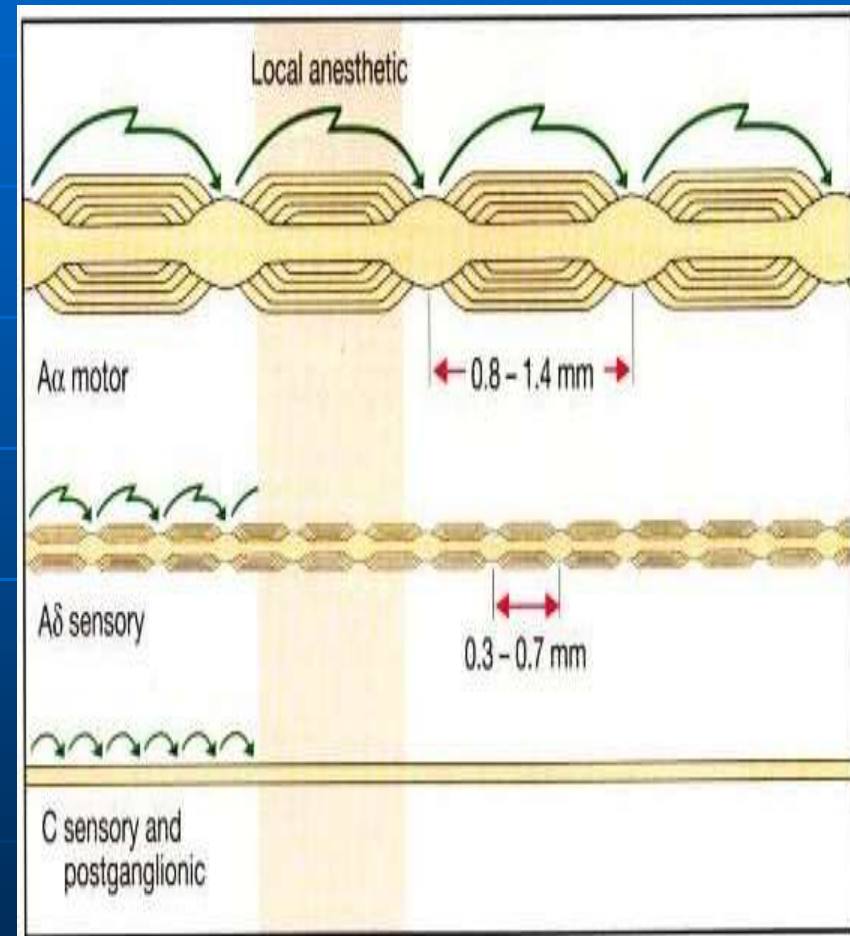
# LOKALNI ANESTETICI

- vežu se za kanale u inaktivnom stanju – unutarnja strana
- kvartarni se vežu za Na kanale s unutarnje strane – kanal se prije učinka mora otvoriti
- tercijarni – ulazi bez otvaranja kanala



# LOKALNI ANESTETICI

- reverzibilno prekidaju prijenos podražaja u perifernim živcima na mjestu primjene (kao i antiepileptici, antiaritmici)
- paraliziraju senzoričke, a dijelom i motorne putove
- prvo zahvaćaju osjet boli, pa topline i hladnoće, pa osjet dodira i na kraju duboki osjet
- bolje blokiraju manje živce





# LOKALNI ANESTETICI

- Kokain – za površinsku anesteziju sluznica
- Prokain – kratko djeluje, vazodilatator, metabolit PABA (ne uz sulfonamide!)
- Lidokain (Xylocain) – najčešće korišten, duže djeluje i manje toksičan
- Benzokain (Anestezin) – liposolubiln, dugotrajna anestezija
- Tetrakain – toksičan, pad tlaka, samo kao kapi za oči
- Cinkokain – najpotentniji i najtoksičniji

# LOKALNI ANESTETICI

- NUSPOJAVE
- reduciraju podražljivost, provodljivost i kontraktilnost srca, vazodilatacija, pad tlaka, kokain porast srčane aktivnosti
- djelovanje na SŽS (stimulacija pa depresija, konvulzije-depresija), respiratorna depresija
- neurotoksičnost
- alergijske reakcije (nema križne preosjetljivosti između dviju skupina)
- oprez pri primjeni – iv, ia
- adrenalinske nuspojave
- Methemoglobinemija - prilokain
- Interakcija s H<sub>2</sub>, alfa blokatorima, sulfonamidima i verapamilom

# LOKALNI ANESTETICI

**Tablica 43.1.** Osobitosti lokalnih anestetika

| Lijek                 | Početak djelovanja | Trajanje djelovanja | Prodiranje u tkiva | Poluvijek u plazmi | Glavni nepoželjni učinci   | Napomene   |
|-----------------------|--------------------|---------------------|--------------------|--------------------|--|--|
| kokain                | srednje brz        | srednje             | dobro              | ~1                 | kardiovaskularni učinci i učinci na SZS zbog blokade unosa amina   | rijetko u uporabi, samo u spreju za gornje dijelove dišnih putova  |
| prokain               | srednje brz        | kratko              | slabo              | <1                 | SŽS: umor, drhtanje, napetost, povremene konvulzije praćene depresijom respiracije<br>KVS: bradikardija i smanjeni udarni volumen, vazodilatacija, što može dovesti do kardiovaskularnog kolapsa | prvi sintetski spoj više se ne radi  |
| lidokain (lignokain)  | brz                | srednje brz         | dobro              | ~2                 | kao prokain, ali su učinci na SZS manje izraženi   | široka uporaba za lokalnu anesteziju; također se radi intravenski za liječenje ventrikularnih aritmija (pogl. 17.)<br>mepivakain je sličan   |
| tetrakain (ametokain) | vrlo spor          | dugo                | umjereno           | ~1                 | kao lidokain   | upotrebljava se uglavnom za spinalnu i kornealnu anesteziju  |
| bupivakain            | spor               | dugo                | umjereno           | ~2                 | kao lidokain, ali je više kardiotsičan   | u širokoj uporabi zbog dugog djelovanja<br>ropivakain je sličan, ali manje kardiotsičan<br>levobupivakain, odnedavna u uporabi, manje je kardiotsičan i u manjoj mjeri izaziva depresiju SZS-a od racemata |
| prilokain             | srednje brz        | srednje brz         | umjereno           | ~2                 | nema vazodilatacijskog djelovanja<br>može izazvati methemoglobinemiju  | u širokoj uporabi, ne upotrebljava se kao analgetik u porodništvu zbog opasnosti od neonatalne methemoglobinemije  |

# OSTALI BLOKATORI NATRIJSKIH KANALA

- TETRODOTOKSIN - iz riba – trovanje hranom – paraliza i smrt
- SAKSITOKSIN – morske školjke
- Djeluju s vanjske strane Na kanala