

جامعة المنارة

كلية: الصيدلة

قسم:

اسم المقرر: عملي علم الأدوية 2

رقم الجلسة (7)

عنوان الجلسة

المخدرات الموضعية Local Anesthetics



الدراسي

الفصل
العام الدراسي

جدول المحتويات

Contents

| العنوان | رقم الصفحة |
|--------------------------------------|------------|
| تعريف بالأدوية المخدرة الموضعية | 3 |
| آلية العمل | 3 |
| الآثار الجانبية الناتجة عن استخدامها | 4 |
| أنواعها وتركيبها الكيميائي | 5 |
| طرق التخدير الموضعي | 6 |
| حالات عامة | 6 |
| الأدوية المسموحة للحامل | 7 |

الغاية من الجلسة:

التعرف على آلية عمل المخدرات الموضعية وأهم الأدوية المتداولة لهذا الاستخدام.

مقدمة:

- يعمل المخدر الموضعي على تخدير الجزء الذي يتم وضعه عليه، حيث يقوم بقطع الاتصال بين منطقة من الجسم والدماغ وذلك بمنع الأعصاب (صلة الوصل) من إيصال إحساس الألم من المنطقة المصابة إلى الدماغ.

استخدامه الصيدلاني

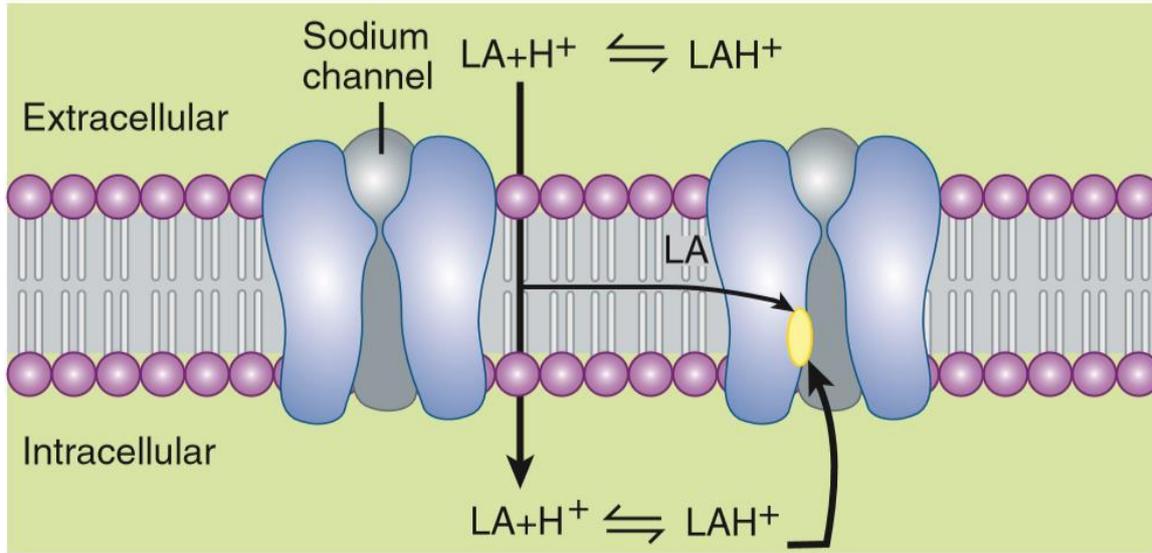
- يستخدم بشكل عام المخدر الموضعي:
- إيقاف الحكّة والألم في بعض الإصابات الجلدية، مثل الحروق الطفيفة، وحروق الشمس، والأكزيما، ولدغات الحشرات.
- تخدير منطقة من الجسم لفترة قصيرة للمساعدة في تخفيف الألم، مثل حقن الإبر، وتنظير المثانة أو القولون، والتنظير السيني، وقبل إزالة الشعر بالليزر

تعريف بالأدوية المخدرة الموضعية:

هي مركبات دوائية تُضعف الإحساس في مناطق محددة من الجسم دون إن تسبب فقدان في الوعي.

آلية العمل:

- تحصر النقل العصبي للتنبيه من المحيط إلى الجملة العصبية المركزية (CNS) ويحدث ذلك من خلال حصرها لقنوات الصوديوم الفولتاجية في الأغشية الخلوية وبالتالي يقل تدفق الصوديوم (اللازم لبدء كمون عمل جديد) إلى داخل الخلايا.
- تخترق المخدرات الموضعية الأغشية الخلوية بالشكل غير المتشرد وتتحول في الداخل إلى الشكل المتشرد الذي سيرتبط مع قنوات الصوديوم ويحصرها، لذلك يساهم pH الوسط و pKa المادة في فعاليتها.
- مثلاً في مواقع الخمج (الالتهاب) تنخفض قيم الـ pH للنسيج وهذا يتداخل مع فعالية هذه المخدرات (تقل إمكانية عبورها للأغشية الخلوية لأن الوسط الحمضي سيزيح التوازن باتجاه الشكل المبرتن).
- أيضاً تسبب معظم المخدرات توسع وعائي محيطي (باستثناء الكوكائين)، وهذا قد يسبب الانتشار السريع للمخدر الموضعي من مكان الحقن إلى الدوران الجهازية مما يقلل من فعاليتها الموضعية ويزيد من سميّتها، لذلك فهي تُشارك مع مقبضات للأوعية الدموية مثل الابينفرين الذي يقلل من ذلك.



الآثار الجانبية الناتجة عن استخدامها:

1. قد تسبب تفاعلات تحسسية موضعية
2. من أهم التأثيرات السمية الناجمة عن الامتصاص الجهازى لها هي السمية العصبية والتي تتجلى بتثبيط مركزي في البداية ثم يحدث إثارة شديدة ثم بالجرعات الأعلى يحدث تثبيط شديد للـ CNS قد يسبب حدوث تثبيط تنفسي
3. قد تسبب سمية قلبية تتجلى بتثبيط للقلوصية وتباطؤ عدد ضربات القلب (هنا تعالج السمية بإعطاء O2 وتمسيد القلب أو إعطاء الأدرينالين وريدياً).
4. ورم دموي: يمكن أن يتسرب الدم ويتراكم ليشكل ورمًا دمويًا عندما تثقب الإبرة أحد الأوعية الدموية. يمكن أن يسبب الورم الدموي ألمًا وتورمًا في الوجه وضررًا.
5. الحقن داخل الأوعية الدموية: يمكن أن يؤدي حقن المخدر الموضعي داخل الأوعية إلى خفقان القلب، واضطرابات بصرية وصداغ ودوار. يجب مراقبة المريض وطمأننته بأن الأعراض يجب أن تكون عابرة وتنتهي ذاتياً.
6. كسر الإبرة: يعد كسر الإبرة من المضاعفات النادرة للتخدير الموضعي بالإبر الحديثة. السبب الأكثر شيوعاً للكسر هو الحركة المفاجئة.
7. ميتيموغلوبينية الدم: تجاوز الجرعة القصوى من مخدرات الإستر أو البريلوكاين يمكن أن يؤدي إلى ميتيموغلوبينية الدم. تحدث حالة ميتيموغلوبين الدم عندما نتيجة أكسدة جزيئات الحديد في الهيموغلوبين من الحديد الحديدية Fe^{+2} إلى أيون الحديدك Fe^{+3} ، مما يؤدي إلى تكوين ميتيموغلوبين وهو شكل مختل من الهيموغلوبين غير قادر على حمل الأكسجين وتفريغته إلى الأنسجة المحيطة. يتمتع الميتيموغلوبين بقابلية عالية للأكسجين، مما يمنع الأكسجين من الانفصال وحرمان الأنسجة والأعضاء من الأكسجين. وهذا يمكن أن يؤدي إلى نقص الأكسجة في الدم، مع أعراض مثل ضيق في التنفس وزرقة.

إنها حالة طبية طارئة ويجب إعطاء الأكسجين والاتصال بخدمات الطوارئ. يتم علاج هذه الحالة باستخدام أزرق الميثيلين في الوريد.

8. إصابة الأعصاب وتغير الإحساس: قد تنجم إصابة العصب عن الإصابة المباشرة بالإبرة، أو تلف إمدادات الدم داخل العصب مما يؤدي إلى ورم دموي يضغط على العصب

9. الفشل في تحقيق التخدير: تشمل أسباب فشل التخدير: الاختلافات التشريحية، والتقنية غير الكافية، وقلق المريض، والعدوى المحلية أو الالتهاب (الوسط لالتهاب هو وسط حمضي يمنع المخدر الموضعي من الوصول إلى نقطة التأثير).

أنواعها وتركيبها الكيميائي:

أول مخدر تم استخدامه هو الكوكائين ولكن قل استعماله بسبب سوء استخدامه.

تختلف في بدء تأثيرها ومدة التأثير وثباتيتها وسميتها.

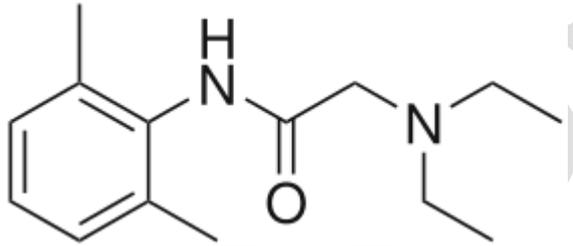
التركيب الكيميائي:

المخدرات الموضعية تتألف من مجموعة محبة للدسم ترتبط مع سلسلة كربونية مرتبطة مع مجموعة محبة للماء برابطة استرية أو أميدية.

(المركبات الحاوية على روابط استرية تكون أقل ثباتاً من الأميدية)

المركبات الحاوية رابطة أميدية:

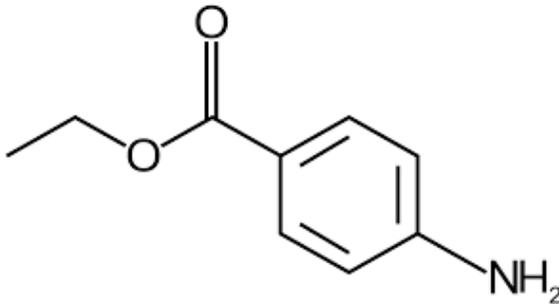
Lidocaine – Bupivacaine – Mepivacaine - Prilocaine



Lidocaine

المركبات الحاوية رابطة استرية:

Cocaine - Tetracaine – Procaine - Benzocaine



Benzocaine

طرق التخدير الموضعي:

- 1- التخدير الموضعي أو السطحي: يطبق المخدر على الأغشية المخاطية.
- 2- التخدير الارتشاحي: يحقن المخدر في عدة مواقع من منطقة محددة من النسيج المحدد (الجلد).
- 3- التخدير فوق الجافية: يتم الحقن فوق الجافية وتستعمل في عمليات جراحية محددة (حوض، بطن، أطراف وصدري) وتستعمل بكثرة في الولادات القيصرية.
- 4- التخدير الشوكي: يتم بواسطة إبرة طويلة في الفراغ تحت العنكبوتي ويسحب جزء من السائل الدماغي الشوكي ويحقن نفس الحجم من المخدر.
- ملاحظة: في الحقن فوق الجافية يمكن حقن حجوم أكبر، لكن بدء التأثير يكون أسرع مع التخدير الشوكي (5 دقائق مقابل 15 – 30 دقيقة مع فوق الجافية)
- 5- طرق أخرى: الحقن بجانب العصب المستهدف كالتالي تستعمل من قبل أطباء الاسنان (تخدير العصب السفلي).
- من العوامل المحددة لفعالية المخدرات الموضعية: قابلية الانحلال في الدم و pKa المادة و pH الوسط والارتباط ببروتينات البلازما، كذلك تملك المخدرات الموضعية التي ترتبط بشدة مع البروتينات الشحمية النسيجية للأغشية العصبية تأثيراً مطولاً (ليفوبوفيكائين وتراكائين وروبيفاكائين).

حالات عامة:

القصور الكبدي:

- ينبغي النظر في جرعات مخدرة منخفضة للمرضى الذين يعانون من اختلال كبدي أو كلوي، حيث أن انخفاض وظائف الكبد أو الكلى يمكن أن يؤثر على استقلاب عوامل التخدير. يتم استقلاب الليدوكائين والمبيفاكائين بالكامل تقريباً في الكبد، مع إخراج نسبة صغيرة دون تغيير في البول. يتم استقلاب البريلوكائين عن طريق الكلى والرتين والكبد.

أمراض القلب والأوعية:

- عادة ما يضاف الأدرينالين إلى عوامل التخدير الموضعي حيث أنه مقبض وعائي يؤمن حصر تأثير المخدر موضعياً ومنعه من الوصول إلى الدوران الجهازى قدر الامكان.
- يوصى بالحد للمرضى الذين يعانون من أمراض القلب والأوعية الدموية حيث يُنصح بجرعة قصوى من الأدرينالين تبلغ 0.04 ملغ للمرضى الذين يعانون من أمراض القلب والأوعية الدموية، مقارنة بـ 0.2 ملغ للبالغين الأصحاء.
- إن استخدام جرعة منخفضة من الأدرينالين لا يؤثر بشكل كبير على ضغط الدم أو معدل ضربات القلب. يمكن أن تترافق التأثيرات الضارة مع الحقن داخل الأوعية، أو الحقن في منطقة شديدة الأوعية الدموية، أو تجاوز الجرعة الموصى بها.
- علاوة على ذلك، لا ينصح بالحقن داخل الأربطة وداخل العظم بمخدرات تحتوي على الأدرينالين للمرضى الذين يعانون من أمراض القلب والأوعية الدموية حيث أن الدواء يدخل الدورة الدموية بسرعة باستخدام هذه التقنيات.

المرضى المسنين

- الحذر ضروري عند إعطاء التخدير الموضعي لكبار السن، ويجب أخذ جرعات أقل في الاعتبار بسبب انخفاض وظائف الكلى والكبد.
- تعد أمراض القلب والأوعية الدموية أكثر شيوعًا أيضًا لدى كبار السن، ويجب مراعاة الحد من استخدام الأدرينالين.

في الحمل:

- يمكن أن يكون الليدوكائين آمنًا نسبيًا، ولا يوجد دليل واضح على أن التخدير الموضعي يزيد من خطر حدوث مضاعفات للأم أو الجنين. ومع ذلك، فإن أي تخدير موضعي يتم إعطاؤه يمكنه عبور المشيمة ودخول الجنين. ولذلك، يجب على الطبيب أن يزن فوائد ومخاطر التخدير الموضعي، مع الأخذ في الاعتبار صحة الأم والجنين، وأحدث الأدلة المتعلقة بالتخدير الموضعي، وخطر تأخير العلاج.

الأدوية المسموحة للحامل

- المكملات الغذائية
- أدوية الأمراض المزمنة: مثل الربو، السكري، ضغط الدم، وغيره
- مسكنات الألم: الباراسيتامول / مضادات الالتهاب اللاستيرويدي النوعية لCOX2 مثل سيليكوكسيب
- أدوية الغثيان والقيء: فيتامين ب6 / اوندانسترون آمنة
- المضادات الحيوية: عائلة البنيسلين والسيفالوسبورين والأزيتروميسين تعد آمنة خلال الحمل.
- استخدام المواد الأفيونية أثناء الحمل لتخفيف الألم (مثل: المورفين) قد يسبب ادمان عند الأم والجنين، استخدامها أثناء المخاض تضعف التنفس، لا يسبب عيوب خلقية.
- الكحول ممنوع بسبب عيوب خلقية
- اللقاحات أثناء الحمل: تجنب اللقاحات التي تحتوي على فيروسات حية (لقاح الحصبة الألمانية)
- تعد اللقاحات المحصنة والموسمية (مثل: لقاحات الأنفلونزا) آمنة خلال الحمل