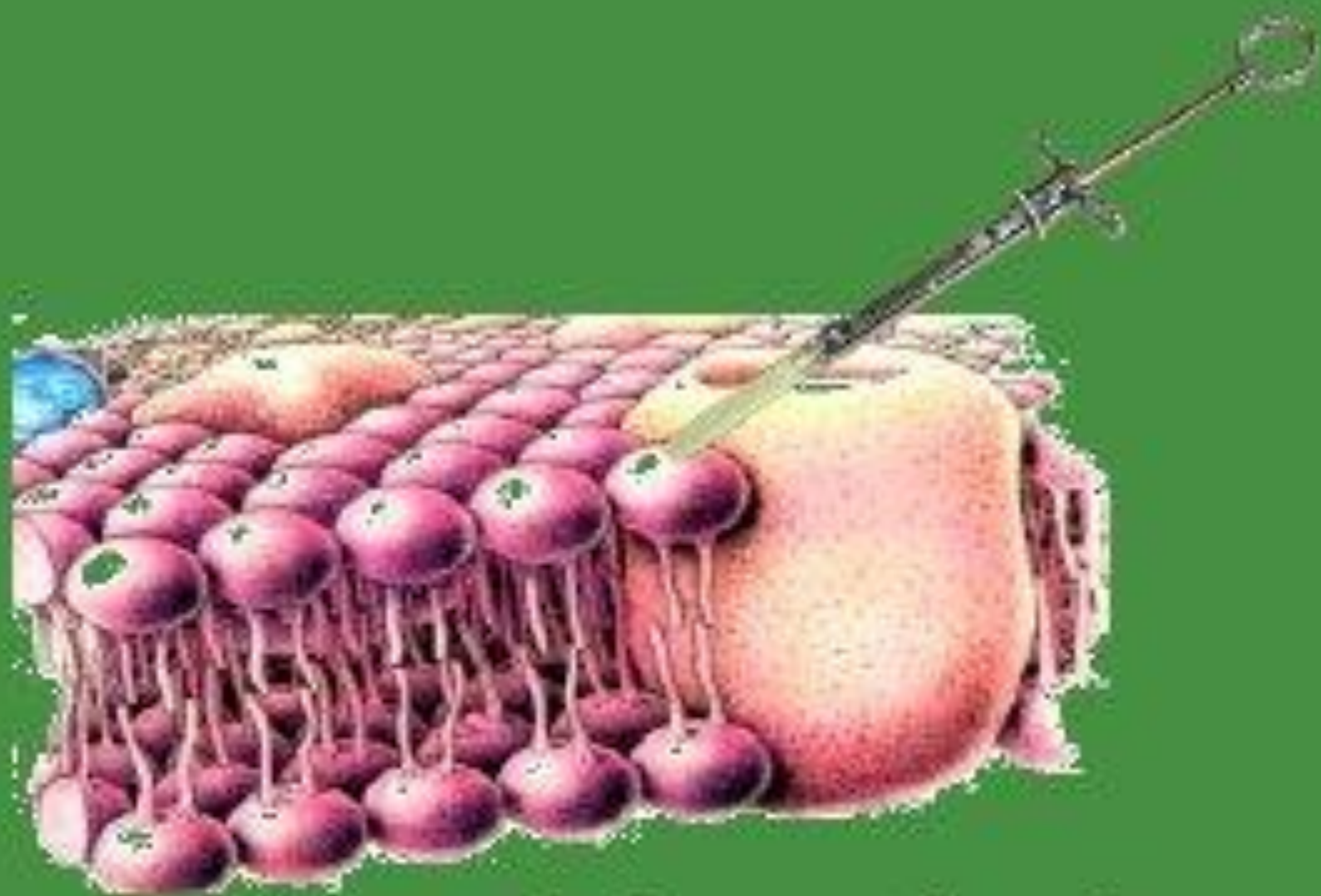


# المخدرات الموضعية

## Local Anesthetics

الدكتور: محمد عوض



# Local Anesthetics

# Common Uses of Local Anaesthetics:



Excision



Dermatology



Dentistry



Spinal Anaesthesia

## DEFINITION

- Drugs which:
  - produce a *REVERSIBLE* loss of sensation ... in a localized part of the body.....
  - when applied directly onto nerve tissues or mucous membranes
  - It abolish sensation in limited area of the body without producing unconsciousness.

-التخدير العام يسبب فقدان الوعي

-التخدير الموضعي يسبب فقدان الإحساس في منطقة معينة

من الجسم بدون غياب الوعي

-هناك تخدير منطقة معينة من الجسم أو بالأعصاب عن طريق

إغلاق قناة الصوديوم



## Properties Desirable in a Local Anesthetic

---

- Non-irritating
- Do not cause permanent damage to nerve structure
- Systemic toxicity should be low
- Effective:
  - Injected
  - Applied locally
- Onset of action as short as possible.
- DOA long enough to allow time for counter plated surgery

الخصائص :

- غير مخرش

- لا يحقن بالعصب مباشرة إنما حول العصب ثم يمتص الدواء

- تأثيره الجهازى قليل

- منها امتصاصها بطيء ومنها سريع


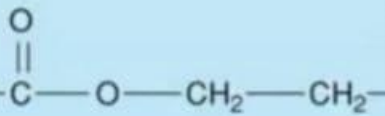
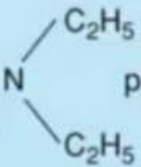

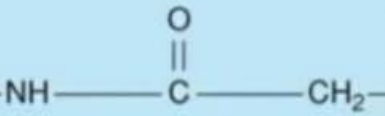
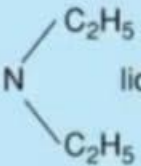
- هي الأدوية الوحيدة التي اذا بدأ امتصاصها انتهى تأثيرها

( جميع الأدوية اذا بدأ الامتصاص بدأ التأثير )

- فعالة عند الحقن

- البداية سريعة ومدة التأثير ( طويلة أو قصيرة )

# Classification According to Chemistry

aromatic part	intermediate chain	amino group
lipophilic		hydrophilic
		 procaine
		 lidocaine



# التركيب الكيميائي :

ندرس التركيب لأهميته: لدينا شقين

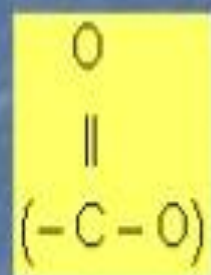
١- شق هيدروفيليك

٢- شق ليوفيليك

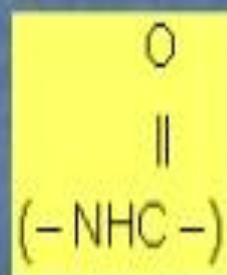
٣- الرابط بين الهيدروفيليك والليوفيليك يحدد نوع المخدر

الموضعي ( استر أو أميد )

**Ester**



**Amides**

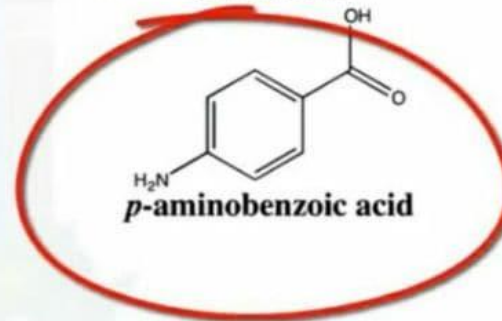
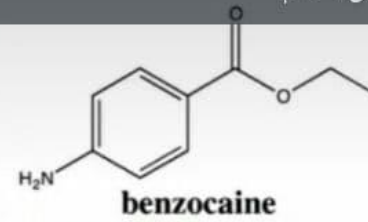


## Classification According to Chemistry أنت

أمس ١٠:٣ م

- **Esters**

- Cocaine
- Procaine
- Tetracaine
- Benzocaine



## Autonomic Nervous System (A.N.S)

---

### 2- indirect acting drugs

#### **Mechanism of action of indirect acting drugs:**

stimulate the release of catecholamine from sympathetic nerve

#### **Examples of indirect acting drugs:**

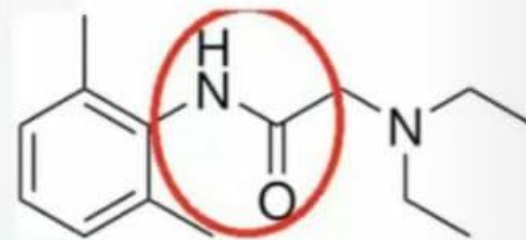
- 1- Ephedrine
- 3- pseudoephedrine.
- 2- Amphetamine
- 4- Cocaine

## Classification According to Chemistry

---

- **Amides**

- Lignocaine /Lidocaine or xylocaine
- Bupivacaine
- Levobupivacaine
- Mepivacaine
- Prilocaine
- Etidocaine
- Ropivacaine



## Classification According to Duration of action

### Short Duration of Action

Procaine

### Medium Duration of Action

Cocaine, Lidocaine,  
Mepivacaine, Prilocaine

### Long Duration of Action

Tetracaine, Bupivacaine,  
Etidocaine, Ropivacaine

Esters	Max Dose (mg/kg)	Duration (h)
Chlorprocaine	12	0.5 - 1
Procaine	12	0.5 - 1
Cocaine	3	0.5 - 1
Tetracaine	3	1.5 - 6

Amides	Max Dose (mg/kg)	Duration (h)
Lidocaine	4.5/(7 with epi)	0.75 - 1.5
Mepivacaine	4.5/(7 with epi)	1 - 2
Prilocaine	8	0.5 - 1
Bupivacaine	3	1.5 - 8
Ropivacaine	3	1.5 - 8



## Metabolism

---

- Cross sensitivity (allergy with ESTER LINKAGE)
  - – Occurs with drugs in the same chemical class
  - – Esters are metabolized to common metabolite PABA
  - – Allergy rarely occurs with amide linkage class
- **Biotransformation/duration of action**
  - – ESTERS are rapidly metabolized in the plasma by a cholinesterase
  - – AMIDES are more slowly destroyed by liver microsomal P450 enzymes.

## سمية المخدرات الموضعية :

- جميع التأثيرات السمية الجهازية بعد حقن المخدرات الموضعية نادرة جدا إلا اذا كان هناك قصة تحسسية للدواء .
- المرضى اللذين يتحسسون على الأُميد ليس بالضرورة أن يكونوا متحسسين على الإِستر

## الاستر:

يستقلب عند وصوله للدورة الدموية بواسطة خميرة Pseudo cholin Esterase  
بعض الحالات عندهم نقص Pseudo cholin Esterase لا يعطى استر  
ينتج عن نهاية استقلاب الاستر ( بارا أمينو بنزويك أسيد ) PABA  
وهو مستقلب سام يسبب حساسية في الجسم

## الاميد:

يستقلب بالكبد

# Answer

## – Ester-linked

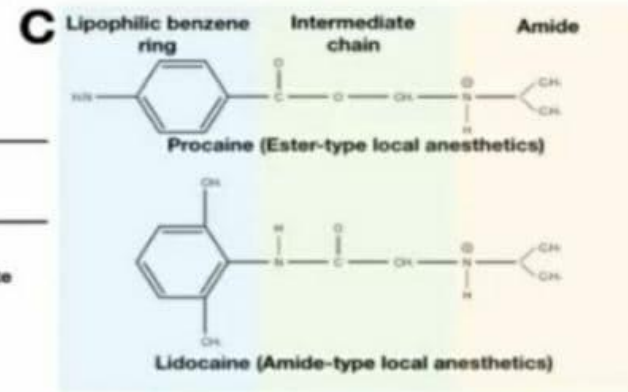
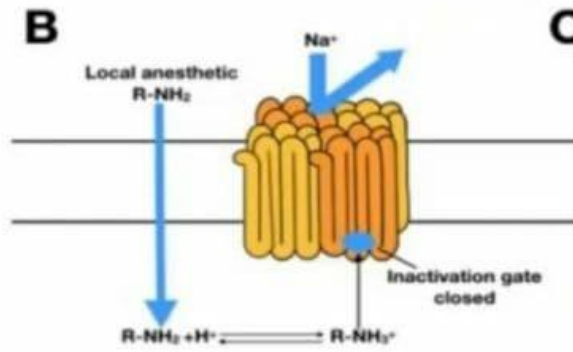
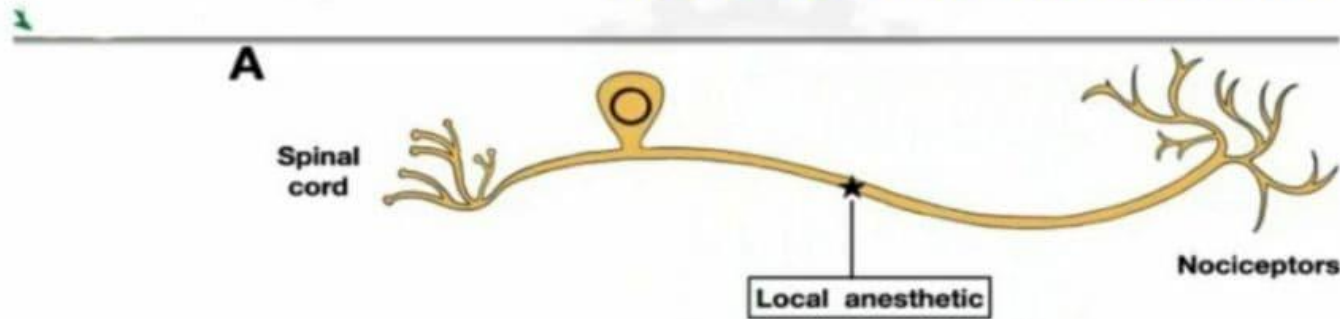
- Short acting
- Metabolized in the plasma and tissue fluids
- Excreted in urine

## – Amide-linked

- Longer acting
- Metabolized by liver enzymes
- Excreted in urine

**REMEMBER: All are weak Bases!**

# Mechanism of action



## آلية العمل :

- لا يتم الحقن في العصب مباشرة
- جميع المخدرات الموضعية هي أساس ضعيف
- المخدرات الموضعية تكون خارج الخلية ليوفيليك حتى يتسنى لها الدخول من خلال غشاء الخلية
- المخدر الموضعي خارج الخلية لا يتأين
- بعد دخوله الى الخلية يصبح أسيديك عندها يتأين ويصبح هيدروفيليك بسبب اكتساب شحنة داخل الخلية ثم يرتبط بالقناة ويغلق قناة الصوديوم ويؤدي لالغاء الإحساس



# Cocaine

- Medical use limited to **surface or topical anesthesia**
- Avoid epinephrine because cocaine already has vasoconstrictor properties. (EXCEPTION!!!)
- A toxic action on heart may induce rapid and lethal cardiac failure.
- A marked pyrexia is associated with cocaine overdose.

## Benzocaine

- Available in many preps for relief of pain and irritation  
for surface anesthesia (topical) only ...  
ointments, sprays, etc.
- Used to produce anesthesia of mucous membranes
- Methemoglobinemia (cyanosis)



## الكوكائين:

هو مخدر استر

يستخدم بشكل سطحي فقط ( عين - أنف )

لا يضاف له أدرينالين لأن له تأثير مقبض للأوعية

يسبب ارتفاع حرارة الجسم

## البنزوكائين :

هو مخدر استر

يستخدم بشكل سطحي على شكل مرهم للأغشية المخاطية

وله مساوئ : تحويل الهيموغلوبين الى ميتهموغلوبين (ميتهموغلوبينيا)

# Lidocaine

- (Xylocaine) Most widely used LA
  - Effective by **all routes**.
  - Faster onset, more intense, longer lasting, than procaine.
  - Good alternative for those allergic to ester type
  - More potent than procaine but about equal toxicity
  - **More sedative** than others



## الليدوكائين :

- هو مخدر موضعي أُميد
- الأكثر استخداما ( مرهم – بخاخ – حقن )
- سريع البدء
- يسبب تخدير عميق
- أطول من البروكائين
- أقوى من البروكائين لكن متساوي معه بالسمية
- يسبب تأثيرات جهازية

## Bupivacaine

---

- No topical effectiveness
- Slower onset and one of the longer duration agents
- Unique property of *sensory and motor dissociation* can provide sensory analgesia with minimal motor block
  - has been popular drug for analgesia during labor
- **More cardiotoxic than other LA**



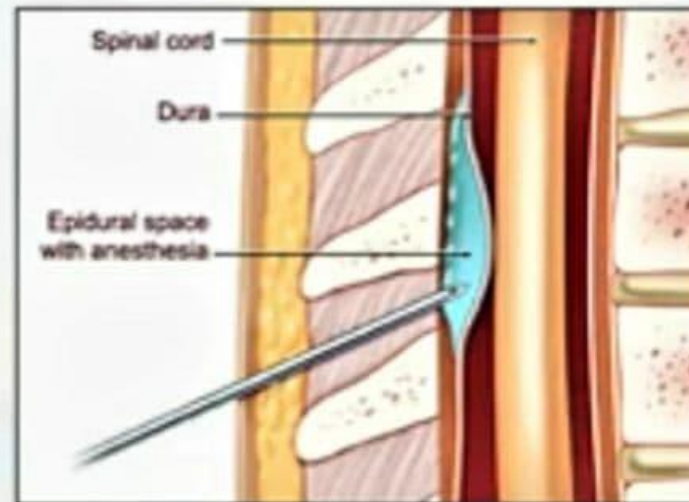
## البيوفياكائين:

- وهو مخدر موضعي أُميد
- تأثيره طويل لذلك يستخدم في التخدير القطني
- لا يستخدم موضعيا
- البدء بطيء
- تأثيره على الأعصاب الحسية أكثر من الأعصاب الحركية
- الأكثر سمية جهازيا

## Clinical Applications

### Epidural and caudal anesthesia

- Injection into epidural space usually at lumbar or sacral levels or near dura matter where nearly most nerves pass closely. Lower part of the body. Pelvic region
- For painless child birth.



# العوامل التي تؤثر على عمل المخدرات الموضعية :

**PH:** فعالية الدواء تتأثر باضطراباته داخل وخارج الخلية

**Lipophilic:** كلما زاد الولوج بالدهم زادت قوة المخدر الموضعي  
كلما قل الولوج بالدهم كان بدء الفعالية أسرع

**الارتباط بالبروتينات :** كلما زاد الارتباط بالبروتينات زادت مدة التأثير  
كلما زادت فعالية توسع الأوعية نقصت فترة التأثير

ما هي الأوامر الحسية التي يتم تثبيطها بالمخدرات الموضعية ؟

- الألم
- حس البرودة
- حس الدفء
- حس اللمس
- حس الضغط العميق

تأثير المخدرات الموضعية على الأجهزة :

\* تأثيرها على الجهاز العصبي :

- للمخدرات الموضعية تأثير همودي على الجملة العصبية المركزية لذلك ترفع العتبة للنوبات الصرعية بتخفيف الحساسية للنيورونات القشرية .
- الجرعات العالية للمخدرات الموضعية يمكن أن تسبب نوبات اختلاج

## العلامات المنذرة للاختلاج بعد اعطاء المخدرات الموضعية:

- نمل باللسان والمنطقة حول الفم ويعتبر هذا العرض أول انذار لحدوث الاختلاج
- هناك علامات وأعراض عصبية أخرى
- ( الرجفان - بطئ الكلام - تقلصات عضلية - اضطراب الرؤية - دوخة - نعاس - عدم توجه - اهتزاز )

## \* التأثيرات على جهاز القلب والدوران:

- القلب : تسبب المخدرات الموضعية:

-- بطئ ازالة الاستقطاب

-- تقليل استثارة القلب

-- تقليل قوة الانقباض

- الأوعية : تسبب المخدرات الموضعية :

-- إرخاء لعضلات الأوعية الملساء مما يسبب هبوط ضغط

\* يستخدم الليدوكائين في اضطرابات النظم والتسرع القلبي



# الاستخدامات السريرية للمخدرات الموضعية :

**Local Infiltration** : (جلد – تحت جلد ) للعمليات الصغيرة مع امكانية اضافة اينفريين

**Topical Block** : ( أغشية مخاطية – طرق تنفسية – العين – الفم – الأنف ) مع عدم إمكانية اضافة

الاينفريين

**Surface Anesthesia** : ( جلد – أغشية مخاطية ) لعلاج الألم الحارق

## **:Nerve Block**

يحقن حول العصب المتعلق بمنطقة العمل الجراحي مع الانتباه الى أن التركيز يجب أن يكون أعلى في هذه الحالات

## **:Epidural Anesthesia**

يحقن في المسافة خارج الجافية ويكون التركيز منخفض في حالات تسكين الألم والتركيز أعلى في حالات العمل الجراحي

**Spinal Anestthesia** : يحقن المخدر الموضعي داخل السائل الدماغى الشوكى وفى هذه الحالات يكون  
المخدر الموضعى على أحد ثلاثة أشكال : (Hyperbaric – Isobaric – Hypobaric)

**Intra Venous Anesthesia** : الحقن يكون بالوريد للطرف العلوى والسفلى بعد تفريغ الدم وربط

تورنيكيت

## إضافة المقبضات الوعائية للمخدرات الموضعية :

من ميزات هذه الإضافة :

- انخفاض معدل الامتصاص
- كمية أكبر من المخدر تصل إلى غشاء العصب
- يزداد عمق التخدير
- تزداد فترة تأثير المخدر

التركيز المثالي أثناء الجراحة ١١.٠٠٠.٠٠٠

التركيز المثالي في العيادات ١١.٠٠٠.٠٠٠ أو ١١.٠٠٠.٠٠٠

## Local anesthetics - vasoconstrictors

Vasoconstrictors should not be used in the following locations

- Fingers
- Toes
- Nose
- Ear lobes
- Penis

ما هي الأماكن في الجسم التي لا يجوز حقن فيها مقبضات وعائية مع المخدر  
الموضعي :

- اصابع اليد
- اصابع القدم
- الأنف من الأمام
- شحمة الأذن
- القضيب





























