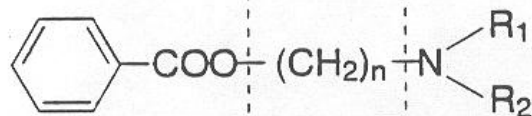


ANESTETICI LOCALI

Polo lipofilo

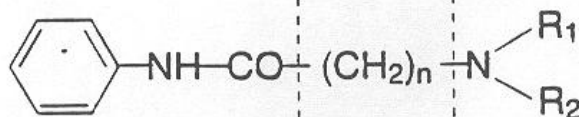
Catena intermedia

Polo idrofilo



ESTERE

Benzocaina, Procaina, Tetracaina, Cloroprocaina



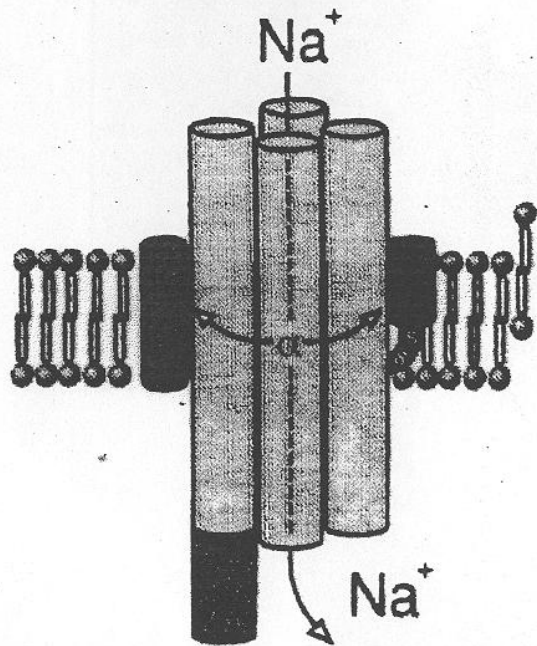
AMIDE

Dibucaina, Lidocaina, Prilocaina, Mepivacaina, Bupivacaina.
Etidocaina

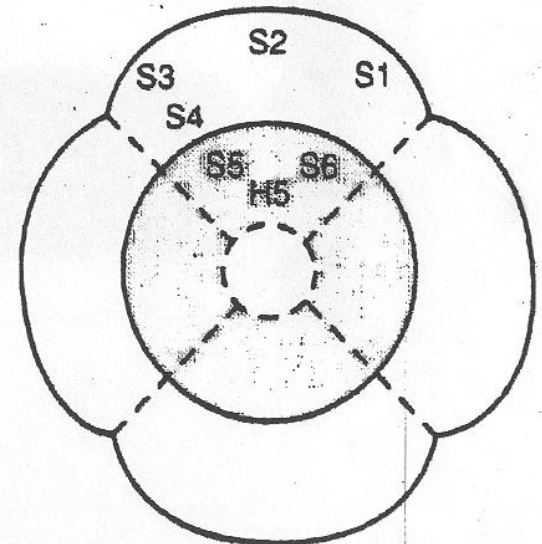
Fig. 2.1. Struttura generale degli anestetici locali.

B)

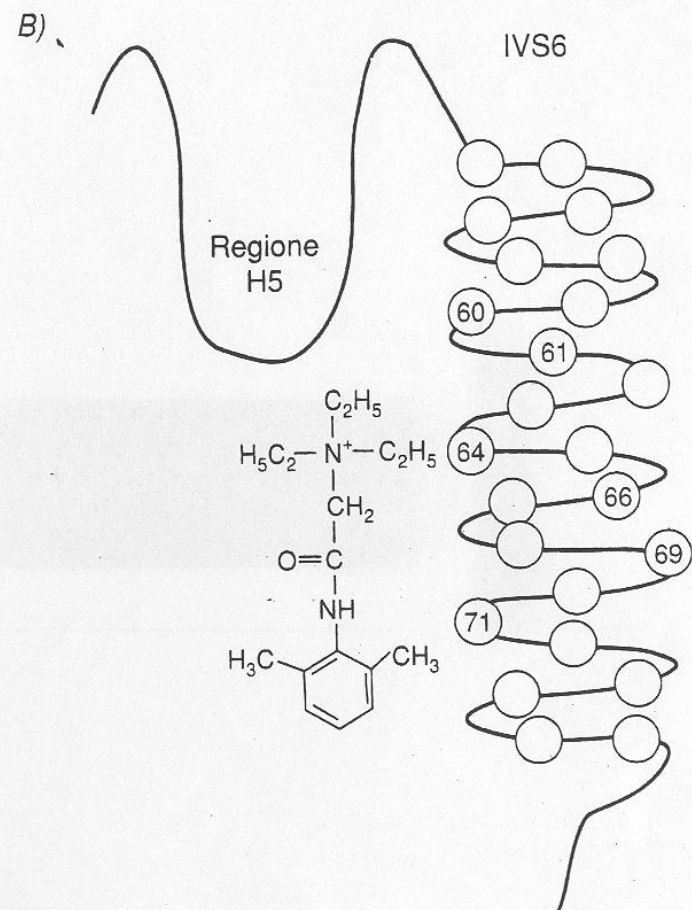
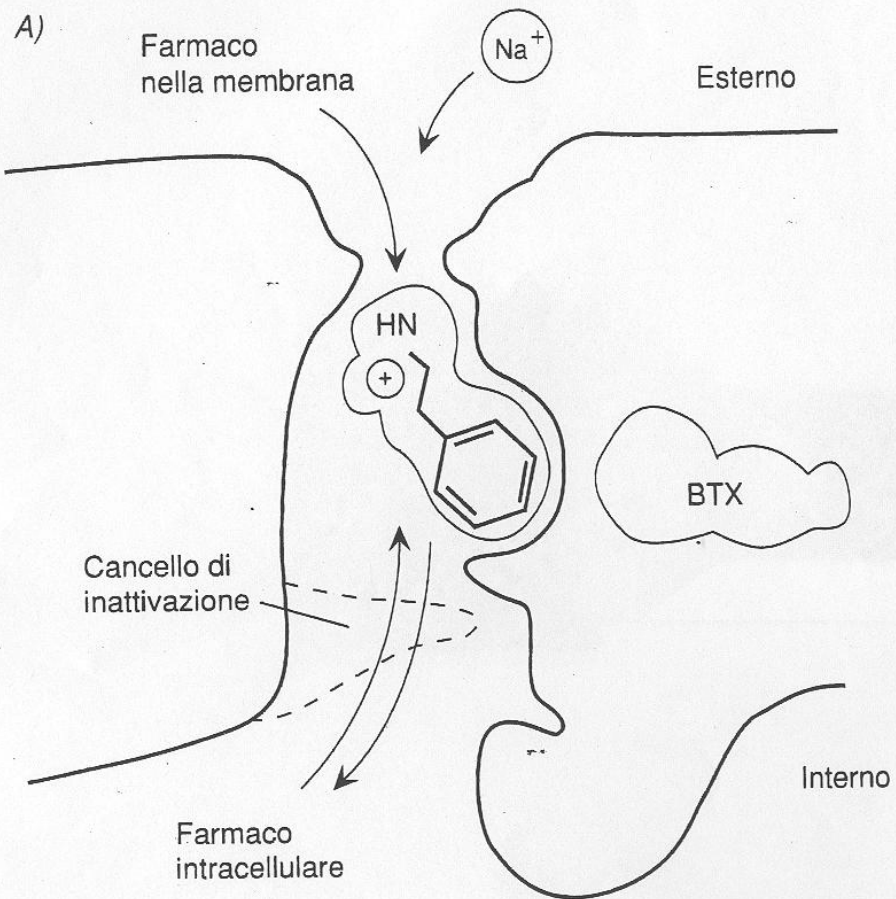
B_1



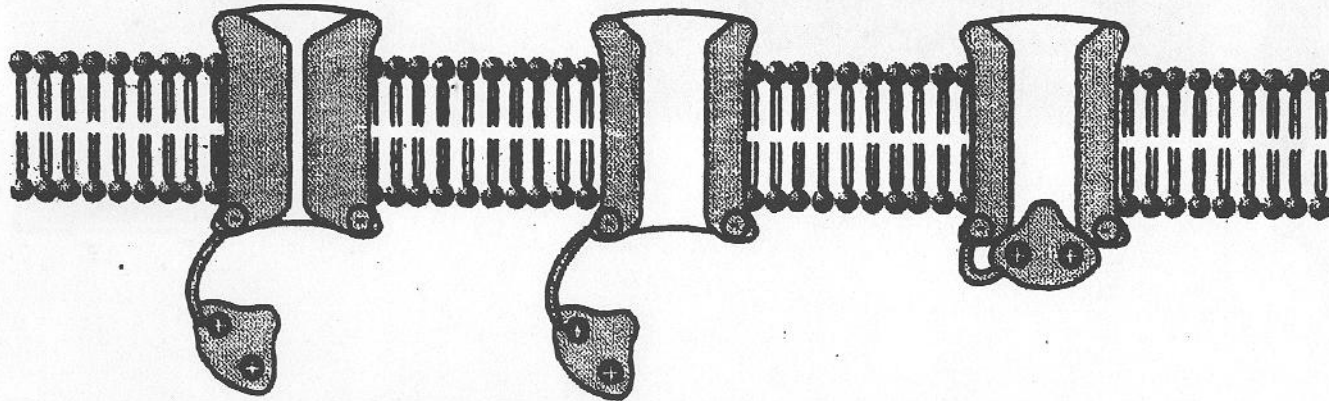
B_2



Canali Na^+ , Ca^{2+} , K^+



Meccanismo Inattivazione



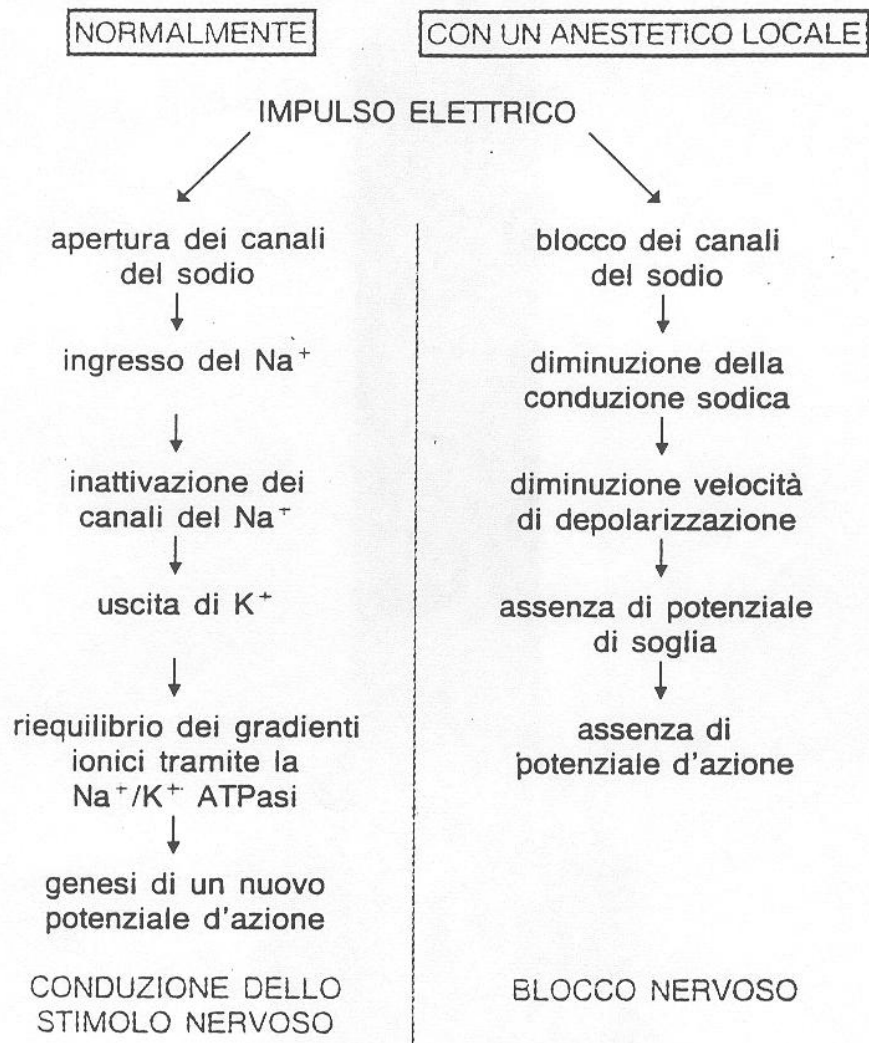


Fig. 2.2. Meccanismo d'azione degli anestetici locali (da Mather e Cousins, modificata).

Tab. 2.2. Progressione del blocco nervoso (da Mather e Cousins, modificata).

Fibra nervosa	A α	A β	A γ	A δ	B	C
Funzione	Motoria	Tattile pressorìa	Propriocettiva	Dolore termica	Vaso costrizione	Dolore termica
Mielina	+++	++	+++	+	—	
Diametro μ M	12-20	5-12	5-10	1-4	1-3	0,5-1
Progressione blocco						
Segni clinici	↓ Funz. motoria	↓ Tatto	↓ Propriocezione	↓ Sensib. termica	Ipertermia locale	

Legenda:

——→ La progressione del blocco sensitivo-motorio è in stretta relazione al diametro ed alla mielinizzazione delle fibre nervose. Si discostano da questa regola le fibre A δ e C, che presentano una soglia di affinità per gli anestetici locali molto simile.

-----→ La progressione degli eventi clinici durante l'instaurazione del blocco anestetico prevede, dopo un'iniziale incremento della temperatura cutanea distrettuale, la graduale riduzione della sensibilità termica e di quella dolorifica, seguite dalla perdita della propriocezione, del tatto e della funzione motoria.

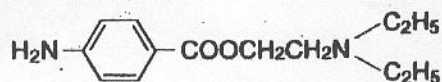
EFFETTI COLLATERALI

- **Sistema nervoso**
- **Sistema cardiovascolare**
- **Apparato respiratorio**
- **Apparato gastroenterico**
- **Apparato muscolo-scheletrico**
- **Reazioni da ipersensibilità**

Sistema Nervoso

- Convulsioni
- Tremori alle estremità
- Fascicolazioni muscolari
- Gonfiore della lingua e delle labbra
- senso di ebbrezza
- vertigine
- sonnolenza
- visione obnubilata
- difficoltà di accomodazione

PROCAINA



**Coefficiente
di ripartizione:**
0,6

pKa
8,9

**% di fissazione
proteica:**
5,8

**Liposolubilità
a pH 7,4:**
debole

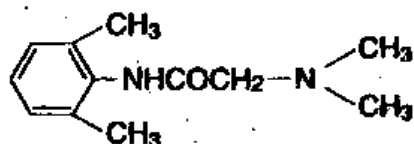
Uso clinico: attualmente topico di scarsa efficacia (0,25-1%) - in passato per infiltrazione locale, epidurale e subaracnoidea (1-2%)

Metabolismo: colinesterasi plasmatiche

Scheda tecnica

		Con vasocostrittore (A)
Latenza	10-20 min	
Durata	30 min	90 min
Soglia tossica	19,2 mg/kg	
Dose unica massima	500 mg	600 mg

LIDOCAINA



Coefficiente
di ripartizione:
2,9

pKa
7,9

% di fissazione
proteica:
64,3

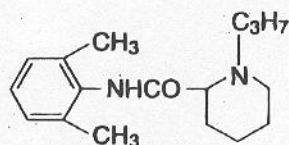
Liposolubilità
a pH 7,4:
media

Uso clinico: topico 4-5-10% - infiltrazione o e.v. 0,5-1% - epidurale/caudale 1-2% - subaracnoidea 2-5%.

Metabolismo: epatico

Scheda tecnica			Uso clinico
		Con vasocostrittore (A)	Per anestesia periferica
Latenza	3-5 min		
Durata	60 min	120 min	
Soglia tossica	5-6 µg/ml		
Dose unica massima	300 mg	500 mg	4-7 mg/kg

ROPIVACAINA (nuova molecola recentemente commercializzata in Italia)



**Coefficiente
di ripartizione:**
6

pKa
8,1

**% di fissazione
proteica:**
85-94%

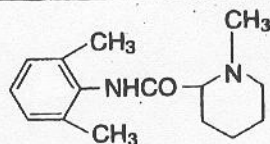
**Liposolubilità
a pH 7,4:**
media

Uso clinico: infiltrazione 0,5-0,75% - blocco periferico 0,5-0,75% - epidurale/caudale 0,75-1% - 0,25-0,5% in ostetricia e terapia del dolore - subaracnoidea 0,5% o iperbarica 0,1%

Metabolismo: epatico rapido

Scheda tecnica			Uso clinico
		Con vasocostrittore (A)	Per anestesia periferica
		non usata	
Latenza	8-12 min		
Durata	360-480 min		
Soglia tossica	2,2 µg/ml		
Dose unica massima	175 mg		2,5 mg/kg

MEPIVACAINA



**Coefficiente
di ripartizione:**
0,8

pKa
7,6

**% di fissazione
proteica:**
77,5

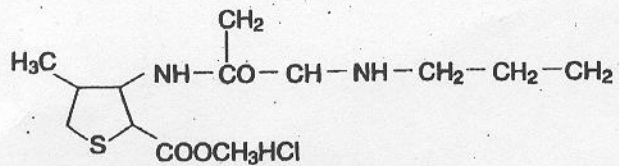
**Liposolubilità
a pH 7,4:**
medio-alta

Uso clinico: infiltrazione o e.v. 1% - blocco periferico 1-2% - epidurale/caudale 1-2%

Metabolismo: epatico

Scheda tecnica			Uso clinico
		Con vasocostrittore (A)	Per anestesia periferica
Latenza	10-15 min		
Durata	90 min	180 min	
Soglia tossica	5-6 µg/ml		
Dose unica massima	400 mg	500 mg	5-7 mg/kg

ARTICAINA



**Coefficiente
di ripartizione:**
17

pKa
7,8

**% di fissazione
proteica:
95%**

**Liposolubilità
a pH 7,4:
alta**

Uso clinico: infiltrazione (4%) - blocco tronculare odontoiatrico (4%)

Metabolismo: colinesterasi sieriche, eliminazione metaboliti per via renale

Scheda tecnica

		Con vasocostrittore (A)
Latenza	2-3 min	
Durata	45-75 min	
Dose unica massima	300 mg	500 mg

Tabella 40.2 Metodi di somministrazione, impieghi ed effetti indesiderati degli anestetici locali (AL).

Metodo	Usi	Farmaci	Note ed effetti indesiderati
Anestesia di superficie	Naso, bocca, tronco bronchiale (In genere sotto forma di spray), cornea, tratto urinario Non efficace per la pelle*	Lidocaina, tetracaina, dibucaina, benzocaina	Rischio di tossicità sistemica quando sono coinvolte alte concentrazioni e superfici ampie
Anestesia per infiltrazione	Iniezione diretta intratissutale per raggiungere i rami e le terminazioni nervose Utilizzato in interventi chirurgici minori	La maggior parte	L' adrenalina o la felipressina vengono spesso aggiunte come vasocostrittori (non nella anestesia delle dita dei piedi o delle mani, dato che possono causare ischemia tissutale) Adatti soltanto per piccole aree; altrimenti si corrono rischi di tossicità sistemica
Anestesia endovenosa regionale	L'AL viene iniettato per via endovenosa distalmente a un laccio stretto per arrestare il flusso ematico; rimane attivo fino a che la circolazione non viene riattivata Utilizzato in interventi chirurgici minori su arti	Principalmente lidocaina, prilocaina	Rischio di tossicità sistemica se il laccio viene rilasciato troppo presto. Il rischio è basso se il laccio viene rilasciato dopo 20 minuti
Anestesia tronculare	L'AL viene iniettato vicino a rami nervosi (ad es. plesso brachiale, nervi intercostali o dentali) per produrre una perdita della sensibilità periferica Utilizzata in chirurgia, odontoiatria, analgesia	La maggior parte	L'anestesia per infiltrazione richiede una dose minore di AL. È importante un accurato posizionamento dell'ago La velocità di inizio dell'anestesia può essere lenta La durata dell'anestesia può essere prolungata dall'aggiunta di un vasocostrittore
Anestesia spinale	L'AL viene iniettato nello spazio subaracnoideo (contenente CSF) per agire sulle radici spinali e sul midollo spinale Utilizzato per la chirurgia addominale, pelvica o degli arti inferiori, principalmente nel caso in cui non possa essere utilizzata l'anestesia generale	Principalmente lido- caina, tetracaina	I rischi principali comprendono bradicardia, ipotensione (dovuta al blocco del simpatico), depressione respiratoria (dovuta agli effetti sul nervo frenico o sul centro della respirazione). Vengono evitati minimizzando la diffusione al cranio La ritenzione urinaria postoperatoria (blocco dell'efflusso autonomo pelvico) è abbastanza frequente
Anestesia epidurale †	L'AL viene iniettato nello spazio epidurale, bloccando le radici spinali Utilizzato per l'anestesia spinale; anche per il parto indolore	Principalmente lido- caina, bupivacaina	Effetti indesiderati simili a quelli della anestesia spinale, ma meno probabili, perché la diffusione longitudinale di AL è ridotta È frequente la ritenzione urinaria postoperatoria