

**МЕСТНЫЕ АНЕСТЕТИКИ ГЛАЗАМИ ХИМИКА-ОРГАНИКА**

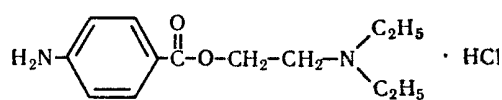
**Цель исследования:** расширение знаний о химической структуре анестетиков и их влиянии на организм человека.

**Материалы и методы:** проведен анализ современной литературы, содержащей сведения о химической структуре анестезирующих веществ в современной стоматологии.

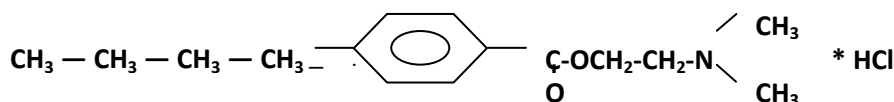
**Результаты:** анестетик — это соединение, которое уменьшает или полностью устраняет чувствительность, воздействуя либо на весь организм человека в целом (общий анестетик), либо на его отдельную область (местный анестетик). Открытие анестезии произошло в конце 19 века. Как ни удивительно, но первым анестетиком стал кокаин. Его применяли для инфильтрационной анестезии, вначале в 10-20 %-ном растворе, а затем, ввиду высокой токсичности и частых побочных эффектов вплоть до летальных исходов, в форме 0,5-1 % раствора. До середины 19 века в качестве анестетика в основном использовался хлороформ, Уильям Мортон (американский стоматолог и хирург) впервые ввёл в практику применение диэтилового эфира. Действие местных анестетиков заключается в подавлении возбудимости рецепторов; блокирование проведения нервного импульса. Требования к местным анестетикам предъявляются следующие: не раздражать ткани, не расширять сосуды, медленно всасываться, стойкость к стерилизации, обладание достаточной силой, длительность воздействия, малая токсичность. Классифицируются местные анестетики по:

- химической структуре: — Сложные эфиры (Кокаин, Новокаин, Анестезин); — Амиды (Лидокаин, Артикаин он же Ультракаин, Мепивакаин);
- по поколениям: I — кокаин в 1860 г., II — новокаин в 1905 г., III — лидокаин в 1943 г., IV — мепивакаин в 1957г., V — артикаин в 1972 г.

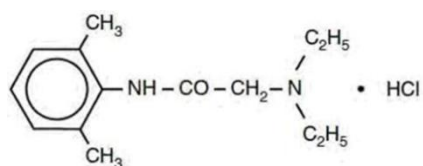
В анестетиках класса эфиров связи нестойки, местные анестетики группы сложных эфиров быстро гидролизуются эстеразами тканей и плазмы. Полностью гидролизуются эстеразами ( $T_{1/2}$  прокаина — 0,7 мин), в неизменённом виде с мочой выводится около 2 % введённого прокаина.



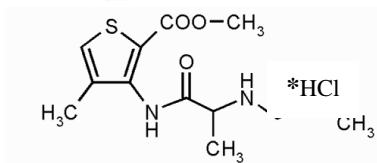
Прокаин



Дикаин. Анестетики класса амидов метаболизируются микросомальными ферментами печени: исключение-артикаин, наличие в его структуре эфирной связи обуславливает дополнительную инактивацию неспецифическими эстеразами тканей и плазмы крови. Период полувыведения ( $T_{1/2}$ ) 90–160 мин: исключение-артикаин,  $T_{1/2}$  составляет около 20 мин. При снижении печёночного кровотока и нарушении функции печени биотрансформация замедляется, а при значительной патологии почек их экскреция уменьшается,  $T_{1/2}$  увеличивается и сопровождается повышением их потенциальной токсичности.



Лидокаин



Артикаин



Ароматическая и аминогруппы ответственны за прохождение через ткани, оболочки и мембраны. Промежуточная часть классифицируют местные анестетики на аминоэфирные или эфирные(-COO-): прокаин, тетракаин и др., и аминокамидные или амидные(-NHCO-): лидокаин, артикаин и др. По химической структуре местные анестетики — слабые основания, плохо растворимые в воде, и поэтому их используют в виде водорастворимых солей соляной кислоты, имеющих рН 4,5–6,5. Скорость наступления и эффективность обезболивания зависят от концентрации анестетика и степени гидролиза его соли. Степень гидролиза зависит от рН применяемого раствора и константы диссоциации анестетика (рКа). Повышение рКа местного анестетика или снижение рН тканей затрудняет гидролиз соли, меньше образуется неионизированного анестетика, что снижает активность препарата и замедляет развитие эффекта.

Активность гидролиза зависит от рН применяемого раствора и константы диссоциации анестетика(рКа). Чем выше концентрация местного анестетика и ближе значения его рКа и рН тканей, тем активнее происходит его диффузия, препарат действует быстрее и сильнее. Транспорт через мембрану нервного волокна липофильного анестетика-основания осуществляется путём простой диффузии по градиенту концентрации. Липофильность препарата влияет на активность и токсичность, т.е. гидрофобная часть анестетика. Чем выше жирорастворимость препарата, тем легче он проникает через мембрану нервного окончания или волокна и создаёт более высокую концентрацию на рецепторе, что повышает его анестезирующую активность. На сегодняшний день, современными анестетиками в стоматологии являются препараты V поколения, производные Артикаина: Ультракаин, Убистезин, Септанест. Самым сильным анестетиком в стоматологии является Ультракаин и Ропивакаин. И не смотря на то, что Мепивакаин уступает по своим анестезирующим свойствам, его не перестают использовать в повседневной работе стоматолога.

**Выводы:** знание химической структуры вещества позволяет прогнозировать его химические свойства и возможное влияние на организм человека.

#### Литература

1. Петрикас А. Ж. Обезболивание в эндодонтии. Учебное пособие-М.:ООО «Медицинское информационное агенство», 2009. — 212 с.:ил.
2. Беликов В. Г. Фармацевтическая химия В.2 ч: Учебное пособие/ В. Г. Беликов — 2-е изд.-М.:МЕДпресс-информ, 2008 — 616 с.: ил.
3. Вайсблат С. Н. Местное обезболивание при операциях на лице, челюстях и зубах. — К;1962 — 413 с.
4. Зорян Е. В., Анисимов Е. Н. Местные анестетики в практике стоматолога //Медико-фармацевтический вестник. — 1996. — № 11-12. — 39 с.

5. Шугайлов И. А., Зорян Е. В., Анисимов Е. Н. Препараты и инструменты для местной анестезии в стоматологии: методические рекомендации». — М.,1997. — 39 с.