

# 第十三章 局部麻醉药

内蒙古医科大学  
许丽萍



# 第一节 概述

- **概念：**局部麻醉药（**local anesthetics**）简称局麻药，是一类以适当的浓度局部应用于神经末梢或神经干周围，能暂时、完全和可逆地阻断神经冲动的产生和传导的药物。
- **特点：**意识清醒，但局部痛觉及其他感觉暂时消失
- **发展：**最早的局麻药是可卡因（**cocaine**），现临床最多用普鲁卡因（**procaine**，1905年）和利多卡因（**lidocaine**，1948年）

# 一、构效关系

- 常用的局麻药由芳香族环、中间链和胺基团三部分组成。
- 根据中间链结构的不同，局麻药可分为两类  
**酯类：**普鲁卡因、丁卡因（tetracaine）等，  
**酰胺类：**利多卡因、布比卡因（bupivacaine）、罗哌卡因（ropivacaine）和依替卡因（etidocaine）等
- 芳香族环具有亲脂性，有利于药物与Na<sup>+</sup>通道受体的结合与分离，与药物发生作用直接相关

## 二、局麻作用及作用机制



### ■ 局麻药的作用

局麻一般规律是：

- 1. 神经纤维末梢、神经节及中枢神经系统的突触部位对局麻药最为敏感；
- 2. 细神经纤维比粗神经纤维更易被阻断；
- 3. 无髓鞘神经纤维（交感、副交感神经节后纤维）较有髓鞘神经纤维（感觉和运动神经纤维）更易阻断；
- 4. 对混合神经产生作用时，首先痛觉消失，继之依次为冷觉、温觉、触觉、压觉消失，最后是运动功能消失。



# 局麻作用机制

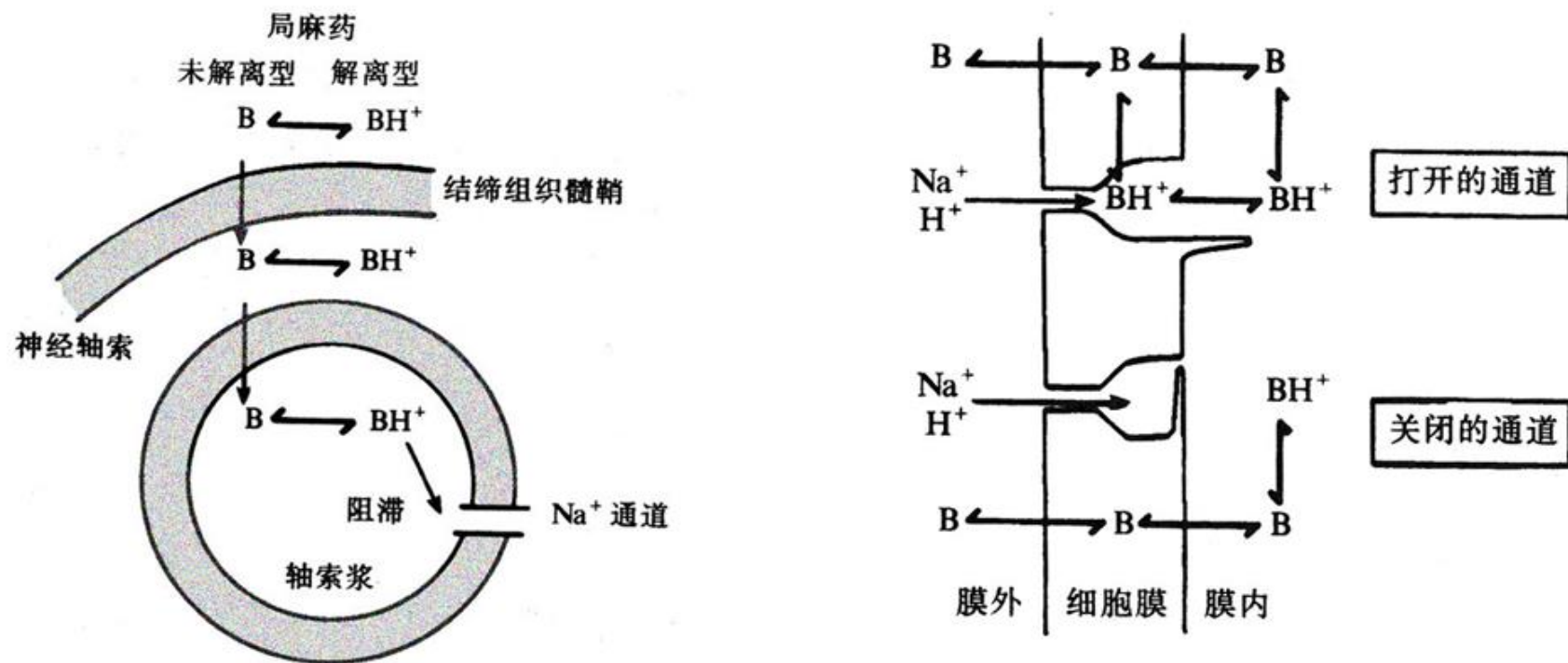


图 13-1 局麻药的作用机制示意图

左图：局麻药的跨膜转运——其非解离型（ $B$ ）通过结缔组织及神经轴索进入神经轴索浆

右图：局麻药的作用机制——其解离型（ $BH^+$ ）与细胞膜  $Na^+$  内表面的相应区域结合而阻滞通道

### 三、体内过程



- 局麻药吸收的速度可受多种因素的影响；
- 剂量大、药液浓度高、用药部位血管丰富及未加用血管收缩药则吸收快，反之则慢；
- 酰胺类在肝代谢降解。肝病患者利多卡因的 $t_{1/2}$ 可从1.8h延至6h，因此，肝病患者应避免大量使用酰胺类；
- 局麻药随尿排出的量受尿液pH的影响，尿液偏酸性时，局麻药排出较多。



## 四、不良反应

- 局麻药从给药部位吸收或误入血管后可引起全身作用，吸收药量过大可引起不良反应。主要表现为：

### （一）中枢神经系统

- 小剂量吸收后可引起镇静、镇痛、头昏等；

- 较大剂量的中毒表现是先兴奋，表现为眩晕、兴奋不安、震颤和焦虑，甚至发生神志错乱和阵挛性惊厥。中枢过度兴奋可转为抑制，可因呼吸衰竭而死亡；

- 普鲁卡因易影响中枢神经系统，因此常被利多卡因取代。

## （二）心血管系统

- 局麻药对心肌细胞膜具有膜稳定作用，吸收后可降低心肌兴奋性；
- 多数局麻药剂量过高可使小动脉扩张，血压下降。特别是药物误入血管内时更易发生，甚至会导致休克；
- 为了预防局麻药的吸收引起的不良反应，可在局麻药液中加少量肾上腺素（1:200000），使局部血管收缩，减少吸收，延长麻醉作用时间。

## （三）变态反应

- 较为少见，酯类比酰胺类变态反应发生率高。



## 第二节 几种常用局麻药

### 普鲁卡因 (procaine)

- 又名奴佛卡因 (novocaine)，属短效酯类局麻药；
- 亲脂性低，对黏膜的穿透力弱，一般不用于表面麻醉；
- 可用于浸润麻醉、传导麻醉、蛛网膜下腔麻醉和硬膜外麻醉。

### 利多卡因 (lidocaine)

- 又名塞罗卡因 (xylocaine)，属酰胺类，是目前应用最多的局麻药
- 具有起效快，作用强而持久、穿透力强及安全范围较大的特点；
- 利多卡因利多卡因可用于各种形式的局部麻醉，有“全能麻醉药”之称；
- 但因其扩散性强，麻醉平面难掌握，蛛网膜下腔麻醉慎用。



## 丁卡因 (tetracaine)

- 又名地卡因 (dicaine)，属酯类局麻药，化学结构与普鲁卡因相似；
- 其麻醉强度比普鲁卡因强10倍，毒性大10~12倍；
- 本品对黏膜的穿透力强，常用于表面麻醉；
- 因毒性大，一般不用于浸润麻醉。

## 布比卡因 (bupivacaine)

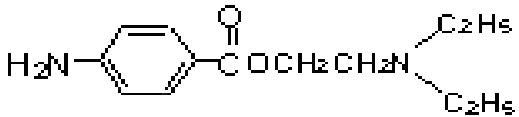
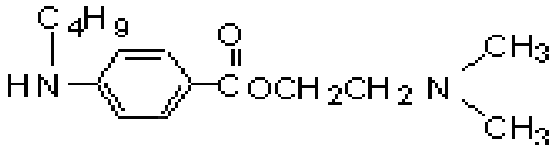
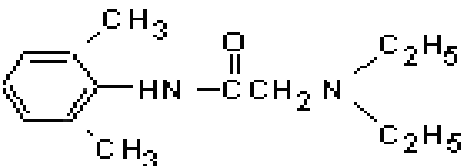
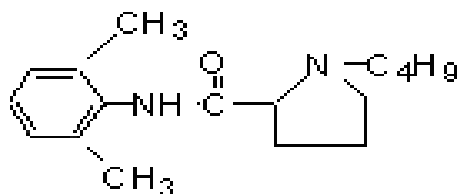
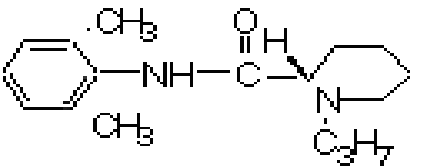
- 又名麻卡因 (marcaine)，属酰胺类，化学结构与利多卡因相似；
- 本品主要用于浸润麻醉、传导麻醉和硬膜外麻醉。

## 罗哌卡因 (ropivacaine)

- 罗哌卡因化学结构似布比卡因，为新型长效酰胺类。



表 13-1 几种常用局麻药比较表

药物	化学结构	pKa	相对强度	作用持续	一次剂	穿透力
	亲脂基团 中间链 亲水基团		及毒性	时间 (h)	量 (mg)	
(比值)						
酯类						
Procaine		8.90	1	1	1000	弱
Tetracaine		8.45	10	2~3	100	强
酰胺类						
Lidocaine		7.90	2	1~1.5	500	强
Bupivacaine		8.20	6.5	5~10	150	弱
Ropivacaine		8.10	5	5~8	200	弱

# 第三节 局部麻醉方法

常见的局部麻醉方法有以下几种：

- **表面麻醉 (surface anesthesia)** 是将穿透性强的局麻药根据需要涂于黏膜表面，使黏膜下神经末梢麻醉。
- **浸润麻醉 (infiltration anesthesia)** 是将局麻药溶液注入皮下或手术野附近的组织，使局部神经末梢麻醉。
- **传导麻醉 (conduction anesthesia)** 是将局麻药注射到外周神经干附近，阻断神经冲动传导，使该神经所分布的区域麻醉。

- **蛛网膜下腔麻醉 (subarachnoidal anesthesia)** 又称脊髓麻醉或腰麻 (spinal anesthesia)，是将麻醉药注入腰椎蛛网膜下腔，麻醉该部位的脊神经根。

适用于腹部和下肢手术。

为了控制药物扩散，通常将药物配成高比重或低比重溶液。

■ **硬膜外麻醉 (epidural anesthesia)** 是将药液注入硬膜外腔，麻醉药沿着神经鞘扩散，穿过椎间孔阻断神经根。

硬膜外腔不与颅腔相通，不会麻痹呼吸中枢。但硬膜外麻醉用药量较腰麻大5~10倍。