

講義資料は自己の学習のみに使用するもので、  
家族を含む第三者に譲渡や配布することは、  
禁止されています

# 神経系

中枢神経系 Central nervous system (CNS)

脳 Brain

脊髄 Spinal cord

**末梢神経系** Peripheral nervous system

体性神経系 Somatic nervous system---運動、知覚を司る

運動神経 Motor nerve(遠心性神経 Efferent nerve)

知覚神経 Sensory nerve(求心性神経 Afferent nerve)

自律神経系 Autonomic nervous system---不随意に内臓を制御

自律神経 Autonomic nerve(遠心性神経)

交感神経 Sympathetic nerve

副交感神経 Parasympathetic nerve

内臓知覚神経 Viscerosensory nerve(求心性神経)

参考: 遠心性: 中枢→末梢  
求心性: 末梢→中枢

# 局所麻酔薬 Local anesthetics

局所の神経に作用して刺激伝導を可逆的に遮断し、知覚を  
選択的に麻痺させる薬

(局所適用によって適用部位周辺の神経伝導を抑制する。)

エステル型 — 血中のエステラーゼで分解

コカイン Cocaine (天然物)

**プロカイン Procaine**

テトラカイン Tetracaine

アミノ安息香酸エチル Ethyl aminobenzoate

ベンゾカイン benzocaine

アミド型 — 肝臓の薬物代謝酵素で分解

**リドカイン Lidocaine**

ジブカイン Dibucaine

ブピバカイン Bupivacaine

# 薬理作用

## ・局所麻酔作用

- ・中枢作用——大量が吸収されると、  
中枢興奮、不穏、振戦、間代性痙攣
- ・循環器系への作用——吸収されると、  
心臓抑制、血管拡張→血圧低下  
===吸収させない。血中には入れない  
(心臓抑制→抗不整脈薬として応用。Lidocaine)

## 薬理作用の発現

- ・**細い**神経線維のほうが太い線維より作用を受けやすい。
- ・**無髓線維**で作用を受けやすい。
- ・知覚神経では痛覚、温度感覚、触角、深部感覚の順に麻痺
- ・運動神経には影響少ない(分別遮断)
- ・**活動中の神経**で作用を受けやすい
- ・体液のpHが**アルカリ性**で作用を受けやすい

# 作用メカニズム

## Na<sup>+</sup> channelの遮断:

Na<sup>+</sup> channelの開口部に細胞内側から入りこみ、channelに結合してNa<sup>+</sup>の透過を阻害し、活動電位の振幅と伝導速度を低下させる。

## Use-dependent block (UDB、使用依存性ブロック)

Na<sup>+</sup> channelの遮断は刺激の頻度に依存する。

頻回脱分極が繰り返されると遮断が強まる。

←Na<sup>+</sup> channelが開口するたびに薬物が結合する。

非イオン型(非解離型)で細胞内に単純拡散、イオン型(解離型)で効果を発現

\* 炎症組織では効果が弱い←炎症組織では酸性に傾き、イオン型が増加

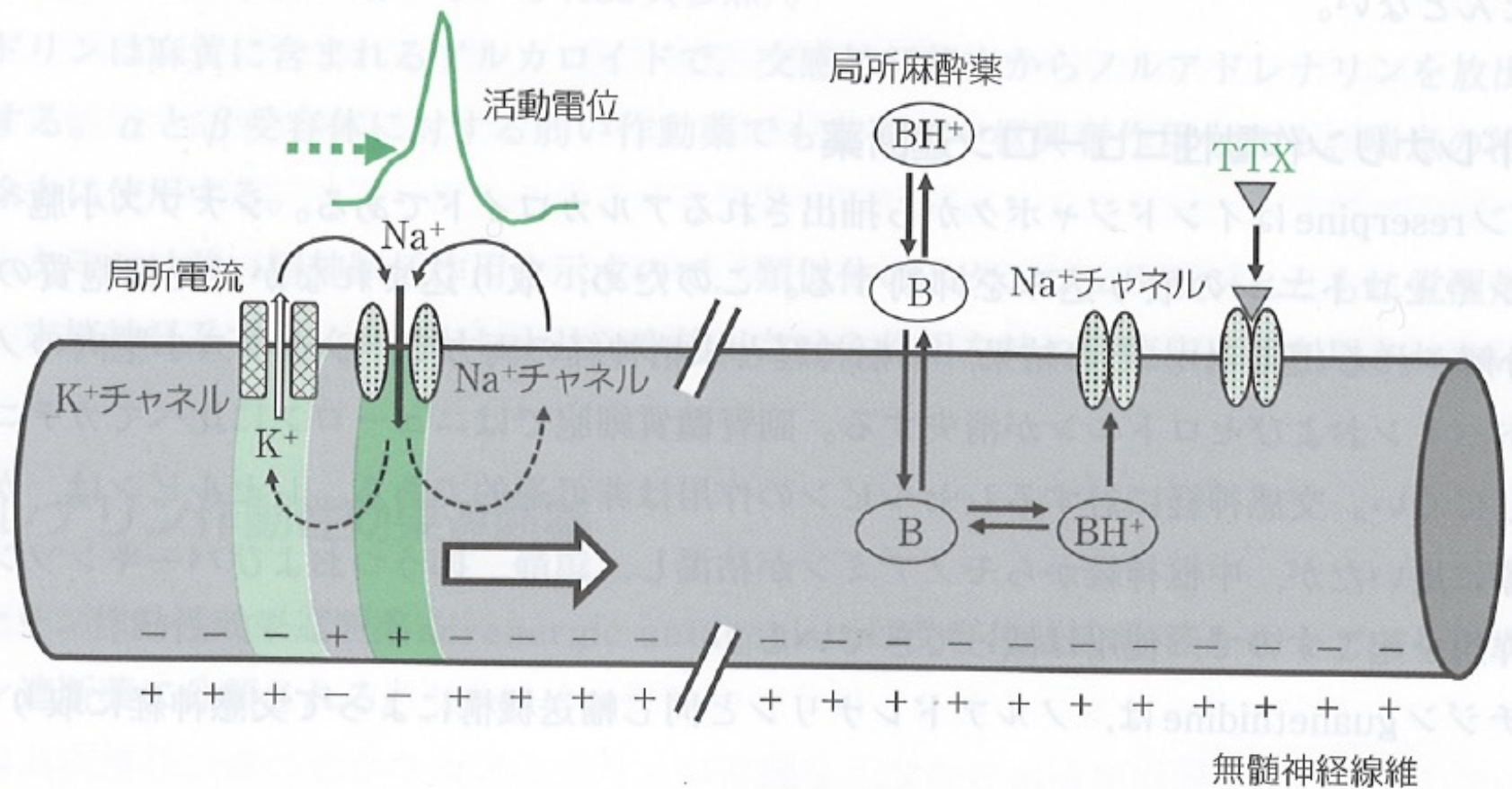


図5-17 活動電位の伝導と局所麻酔薬の作用機序

獣医薬理学第二版(近代出版)

局所麻酔薬は細胞内から、テトロドトキシン(TTX)は細胞外から  $\text{Na}^+$  チャンネルに作用して、阻害する。このことで、局所電流および活動電位が発生せず、神経の伝導が抑制される。

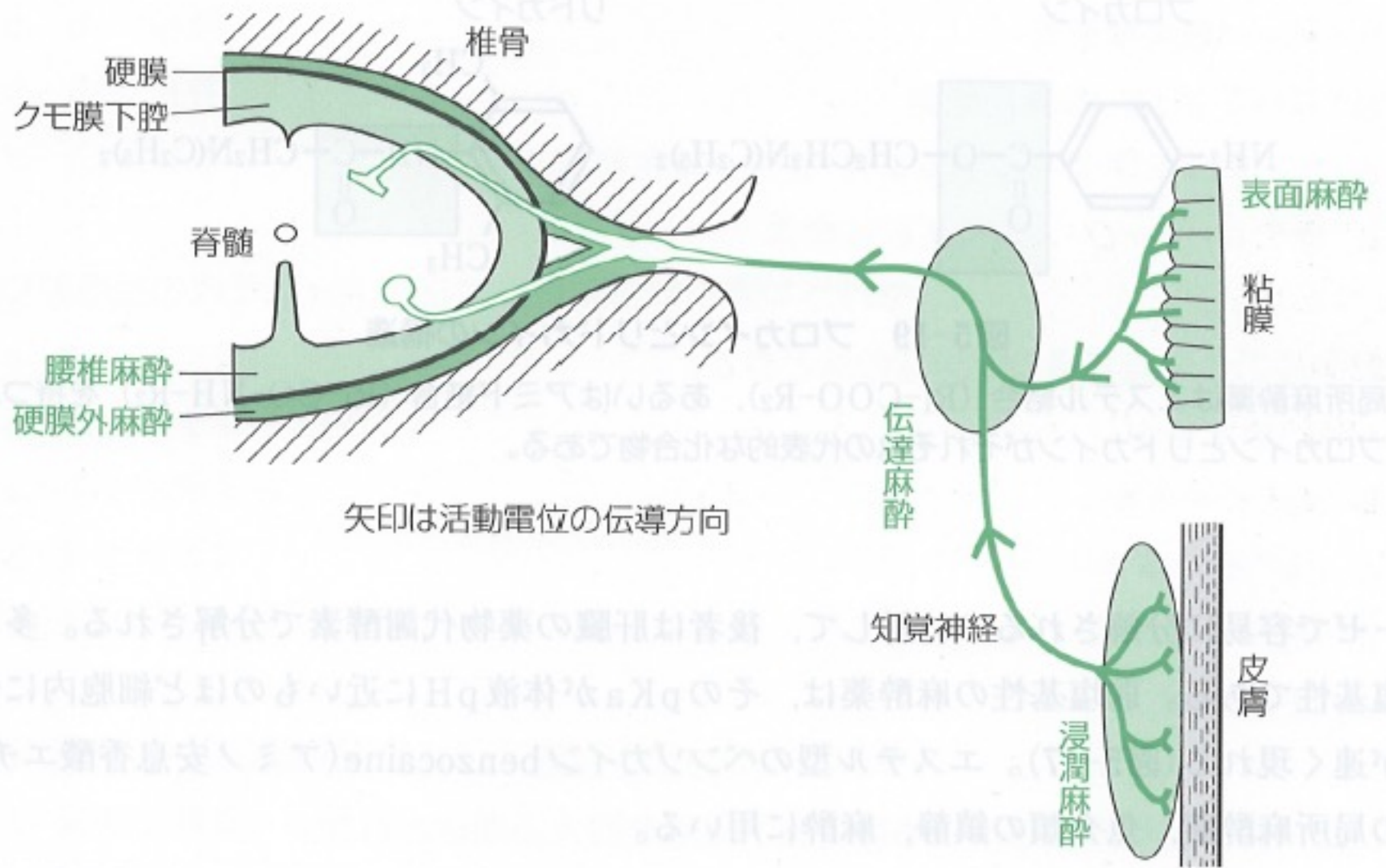


図5-18 局所麻酔薬の適用方法

獣医薬理学第二版(近代出版)

## 局所麻酔の方法

# 局所麻酔薬の適用方法

**表面麻酔** Surface anesthesia

粘膜、角膜、創面に塗布

**浸潤麻酔** Infiltration anesthesia

注射で局所(皮下)に浸潤させ、知覚神経末端を麻痺

**伝達麻酔** Nerve block anesthesia

神経幹の周囲に注射し、その末梢側を麻痺

馬の四肢の手術、手の指の手術

**脊髄(椎)麻酔** Spinal anesthesia

くも膜下腔に注射し、脊髄神経根を遮断

ヒトでは用いるが、家畜では危険

**硬膜外麻酔** Epidural anesthesia

脊髄神経根を遮断

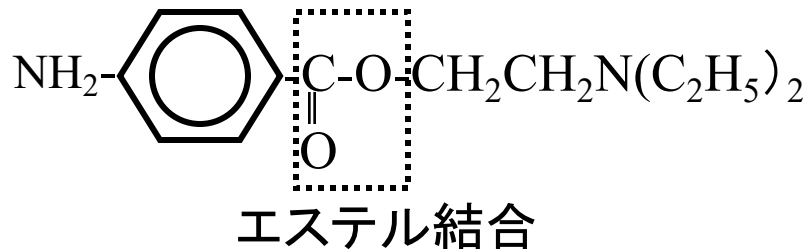
牛の乳房、陰茎、後く、股間の麻酔に



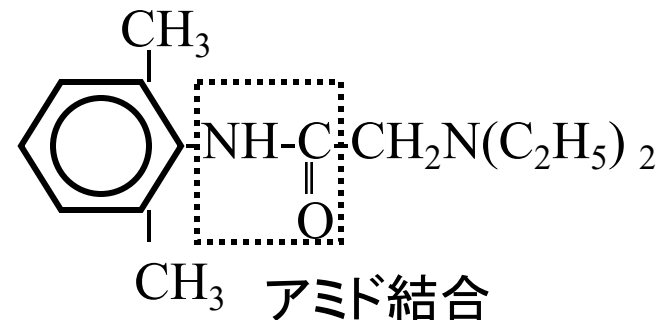
## 重要: Procaine と Lidocaine の比較

	Procaine	Lidocaine
型	Ester型	Amide型
分解	血中のエステラーゼ	肝臓の薬物代謝酵素
局所麻酔作用	発現遅く、持続短い	即効、持続
pKa	8.9 (の弱塩基)	7.8 (の弱塩基)
生理的pHで 分子型は	少ない	多い

プロカイン



リドカイン



# 覚えておきたい薬物相互作用

1. **アドレナリン**との併用で作用が持続——血管収縮で局所に長く留まる。
2. Procaineはサルファ薬の効力を低下させる  
Procaineは代謝されると、**パラアミノ安息香酸**になる。

サルファ薬の作用点(X)

**パラアミノ安息香酸**——X→葉酸  
(基質) (細菌の発育に必須)

# 各論1

## コカイン Cocaine

コカの葉のアルカロイド

局所麻酔作用、交感神経様作用(**Uptake 1**の抑制)、  
中枢興奮作用

**麻薬**に指定され、現在、殆ど使用されない。

## Ester型

### プロカイン Procaine

局所麻酔作用

浸潤麻酔、脊髄麻酔に用いる。

組織浸透性は弱く、**作用発現は遅い**(2-5分)。

**作用持続時間は短い**(エステラーゼで分解)。

副作用: 中枢興奮作用(振戦、痙攣、呼吸麻痺)

心抑制作用(興奮性低下、伝導遅延、収縮抑制)

## 各論2

### Ester型

#### テトラカイン Tetracaine

プロカインに似た局所麻酔薬。

表面麻酔、脊髄麻酔に用いる。

プロカインより麻酔効力が強く、作用時間が長い  
(1～1.5時間)。腰椎麻酔では3時間。

角膜の表面麻酔にも使用。

副作用：心抑制作用（興奮性低下、伝導遅延、収縮抑制）

#### アミノ安息香酸エチル Ethyl aminobenzoate

表面麻酔に用いる。

作用発現は遅い。作用持続時間は長い。

使用は少ない。

#### ベンゾカイン Benzocaine

ウシ、ウマの局所麻酔薬、魚介類の鎮静、麻酔に用いる

# 各論3

Amide型

**リドカイン** Lidocaine

局所麻酔作用

表面麻酔、浸潤麻酔、伝導麻酔、脊髄麻酔に用いる。

効力はプロカインの2倍。

組織浸透性は強く、作用発現も速い。作用持続時間は中程度（アドレナリンを併用すれば2時間）。

抗不整脈作用

（クラスIb不整脈薬、心室での活動電位持続時間を短縮、心室性不整脈を抑える。緊急時に使用するが静注を停止すると速やかに作用は消失する。）

副作用：中枢興奮作用。心抑制作用。

# 各論4

## Amide型

### ジブカイン Dibucaine

#### 局所麻酔作用

浸潤麻酔、脊髄麻酔、腰椎麻酔に用いる。

作用発現は速い。持続時間は長い(コカインの2倍、プロカインの9倍)。

作用強度はコカインの12倍、プロカインの48倍。

### ブピバカイン Bupivacaine