

DE LA COCAÏNA ALS SEUS DERIVATS SINTÈTICS (II)

La Cocaïna

La seva excel·lent capacitat com anestèsic local -no exempta d'efectes secundaris greus, com l'habitució que n'és un dels més seriosos- es veu potenciada en associar-la a un vasoconstrictor com l'adrenalina.

De les especialitats que conserva la **Medicateca** amb la cocaïna com a principal component, se n'han triat tres:

Locosthetic:

Composició: clorhidrat de **cocaïna**; clorhidrat d'adrenalina.

Presentació: flascó multidosi de vidre. Caputxó de cautxú perforable.

Ús: injectable per a l'analgèsia dental i prevenció de les hemorràgies post extractives.

Colirio Collado:

Composició: solució d'adrenalina; clorhidrat de **cocaïna**.

Presentació: flascó comptagotes.

Ús: tota classe de cures i intervencions oftalmològiques

Una especialitat digna de ser comentada tant per la complexitat de la composició com, sobretot, per la seva original i acurada presentació és:

Estuche Oftálmico Cusi para la operación de la catarata:

Composició: Èmbol groc: eufalmina-**cocaïna**

Èmbol roig: sulfat d'atropina

Èmbol blau: salicilat d'eserina

Èmbol blanc: sulfametán (sulfapirimidina)

Presentació: Capsa contenint quatre petits tubs-xeringa de vidre, d'una sola aplicació, cadascun ple d'una pomada diferent



Anestèsics locals de síntesi

L'ús generalitzat de la cocaïna com anestèsic local posà en evidència la considerable variació de la susceptibilitat individual a la droga i la capacitat de la cocaïna d'induir greus manifestacions de toxicitat aguda.

Un cop coneguda l'estructura química de la molècula de cocaïna, s'inicià la recerca de substituents sintètics que, lliures dels seus efectes no desitjats, conservessin intacta la capacitat anestèsica. **Filehne** (1887) i **Einhorn** i **Heinz**, (1892), demostraren la capacitat de produir anestèsia local del grup benzoílic que es troba present a la cocaïna i en altres alcaloides. Tanmateix, fou la combinació de l'àcid benzoic amb els aminoalcohols la que proporcionà estructures moleculars amb propietats anestèsiques més intenses.

Dins del grup dels aminoalcohols, demostraren ser interessants els derivats de la sèrie de l'**Ortoform**. Poc solubles en aigua i solubles en lípids, per tant, poc absorbibles per a ser tòxics, aquest tipus d'aminoalcohols, inapropiats per a ser emprats en forma d'injectables, demostraren la seva utilitat com anestèsics d'ús tòpic. Un dels derivats més conegut d'aquesta sèrie és la **Benzocaïna** o **Anestesina** (ester etílic de l'àcid 4 aminobenzoic) obtinguda per **Dunbar** (1902). Aplicats en forma de polvoritzacions o en altres formes galèniques (comprimits, supositoris, unguents), aquests anestèsics foren emprats en el tractament d'hemorroides, dolors dentals, faringitis, etc.



Col·lecció del MFC
[www.bib.ub.edu / pharmakoteka](http://www.bib.ub.edu/pharmakoteka)

La **Benzocaïna** substituï definitivament la cocaïna quan aquesta fou inclosa en la llista de substàncies estupefaents. Una bona mostra la trobem en:

Pastillas Bonald cloro-boro sódicas con benzocaïna

Pomada Anti-hemorroidal Nicolich:

Composició: adrenalina, clorhidrat d'efedrina, àcid tànic, **benzocaïna**, òxid de zinc, mentol.

Encara avui es poden trobar a les farmàcies especialitats amb benzocaïna (**Dentispray**, **Nani predental**...)

Tanmateix, foren els esters derivats dels alcohols aminoterciàries els que proporcionaren un dels millors substituents de la cocaïna. L'any 1899, **Einhorn** sintetitzà la **Procaïna** (p-aminobenzoïldietilamino etanol) que, patentada amb el nom de **Novocaïna**, fou introduïda en clínica l'any 1905 per **H. Braun**. La **Procaïna**, d'acció anestèsica més fugaç i menys tòxica que la cocaïna i amb interessants propietats analgèsiques, ha esdevingut, fins aquest moment, un dels anestèsics locals més utilitzats en terapèutica.

Sulfosalil:

Composició: iodurs, hiposulfits, salicilat sòdic, **novocaïna**

Presentació: via intramuscular, mescla de dues ampul·les

Ús: antireumàtic.

Novocaina Suprarrenina:

Composició: **novocaina**, suprarrenina o adrenalina, sulfat potàssic, clorur sòdic.

Presentació i ús: injectables per a l'anestèsia dental.

Linere:

Composició: mentol, **novocaina**, càmfora, essència de trementina, cloroform, salicilat de metil.

Presentació: liniment.

Ús: reumatisme, contractures.



Col·lecció de la FCF. Novocaina Suprarrenina
www.bib.ub.edu/pharmakoteka

Altres usos de la *Procaïna*

Administrada en forma de sals poc solubles, la **procaïna** es combinà amb penicil·lina G o altres antibiòtics per tal de formar dipòsits cristal·lins que retardin l'absorció del fàrmac.

Probablement, pels seus efectes analgèsics i antiarítmics, a la dècada dels seixanta, s'atribuïren a la **procaïna** propietats per combatre l'envelliment en potenciar l'activitat física, mental i sexual dels ancians (*Sèrum de la joventut* de la **Dra. Aslan**).

Rolacilina:

Composició: Penicil·lina G **procaïna**, penicil·lina sòdica, i hidroestreptomina.

Presentació: vial i ampul·la de dissolvent.

Clorhidrato de Procaïna: Presentació: preparat oficial en ampul·les injectables. Per recordar que la **Procaïna** s'anomenava també **Novocaina**, el farmacèutic va escriure a mà aquest sinònim sobre la capsula.

A la mateixa sèrie pertany l'**Estovaina** (dimetilaminobenzoil pentanol), sintetitzada per **Fourneau** (1904). Aquest científic la batejà amb el seu propi cognom (*fourneau* vol dir forn en francès) expressat en el mot anglès *stove* d'arrel grega.

Anestesol Seny:

Composició: **estovaina**, cocaïna, adrenalina i blau de metilè.

Presentació: ampul·les.

Ús: anestèsic especial per a odontologia.

La **Lidocaina** o **Xilocaina**, (2-(dietilamina)-N-(2,6 dimetil fenil) acetamida) és un anestèsic local àmpliament usat tant per aplicació tòpica com injectable. Amb toxicitat similar a la **Novocaina**, produeix una insensibilització de major durada i és efectiu sense necessitat de vasoconstrictor. La **Lidocaina** és aconsellada per a administrar a aquells individus hipersensibles a l'adrenalina i a la **Procaïna**.

Disolvente Tetralen:

Composició: solució de ***Lidocaina***, com anestèsic local per evitar el dolor de la injecció.

Presentació: ampul·la de dissolvent per a l'especialitat antibiòtica ***Tetralen***.



Col·lecció del MFC. Pharmakoteka
www.bib.ub.edu/pharmakoteka

Si bé en general, els derivats sintètics tenien una activitat anestèsica menor que la cocaïna, també eren menys tòxics, més barats d'obtenir, químicament més estables i formaven solucions fàcils d'esterilitzar.



Iris Figuerola i Pujol (Museu de la Farmàcia Catalana)
Manuel Subirà i Rocamora (Fun. Concòrdia Farmacèutica)

Barcelona, febrer de 2006