

## Lokální anestetika

### Poznámky ke cvičením z Farmakologie II

MUDr. Karel Šlais, Ph.D.

Tento studijní materiál slouží výhradně pro výuku praktických cvičení předmětu Farmakologie II studentů VL a ZL lékařské fakulty MU. Představuje stručné podklady pro přípravu k probírané látce a osnovu pro záznam vlastních poznámek ve výuce. Vysvětlující doplnění, aktuální údaje a prohloubení obsahu jsou předmětem jednotlivých cvičení.

---

---

---

---

---

---

---

---

## Lokální anestezie

Jsou to látky vyvolávající místní znecitlivění reverzibilní bloádou vedení vzruchů senzitivními neurony.

Vnímavost nervových vláken k LA:

vegetativní > senzitivní > motorická

u senzitivních vláken nejdříve mizí vnímání tepla, pak bolesti, nakonec dotyku a hlubokého čítí

---

---

---

---

---

---

---

---

## Mechanismus účinku LA

LA po průniku do nervového vlákna blokují Na<sup>+</sup> kanály a tím zamezují vzniku a vedení akčního potenciálu

Další účinky:

- vazodilatační (blokáda vláken sympatiku)
- antiarytmický účinek (ovlivnění sodíkových kanálů v strukturách schopných aktivace v srdci)

---

---

---

---

---

---

---

---

## Chemická struktura LA

LA jsou amfifilní látky:

- lipofilní aromatická skupina
- hydrofilní dusíkatý zbytek (ionizovatelný)  
vzájemně propojeno **esterovou** nebo **amidovou** vazbou  
(rozdělení na esterová a amidová lokální anestetika)

Výjimka – benzocain nemá ionizovatelnou skupinu

LA jsou slabé báze,  $pK_a = 8-9$ , účinnost LA závislá na pH tkáně – poměr ionizované/neionizované formy

Vyšší účinnost v alkaličtější tkáni – větší procento molekul je neionizovaných a může proniknout do neuronu

Nižší účinnost v kyselější (např. zánětlivé) tkáni – ionizované molekuly LA nepronikají do neuronu

---

---

---

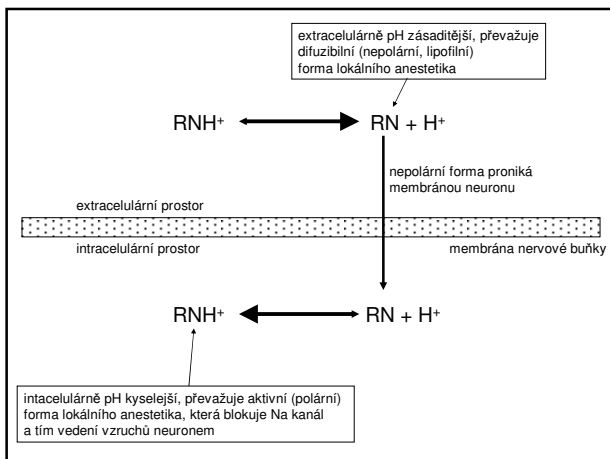
---

---

---

---

---



---

---

---

---

---

---

---

---

## Farmakokinetika lokálních anestetik

- Absorpce závisí na koncentraci v místě vpichu, dávce, fyz.-chem. vlastnostech LA a na prokrvení
- Distribuce - v celém organismu, depozice v tukové tkáni, amidy silná vazba na plazmatické bílkoviny
- Metabolizace plazmatickými esterázami - rychleji - (esterová LA) nebo v játrech za účasti CYP450 - pomaleji (amidová LA)
- Eliminace metabolitů ledvinami

---

---

---

---

---

---

---

---

## Vazokonstrikční přísady

- pro snížení toxicity
- kompenzace vazodilatačního působení
- prodloužení a zvýšení účinku LA

ale opatrně u akrálních částí těla – riziko ischemické nekrózy!

adrenalin (nejčastěji v konc. 1:200 000), příp. noradrenalin nebo nafazolin

---

---

---

---

---

---

---

---

## Způsoby aplikace LA

### Povrchová anestezie

ve formě roztoku, gelu, masti  
sliznice, rohovka, jícen, dýchací cesty, ...

### Infiltrační anestezie

subkutánní, intradermální, intramuskulární  
blokáda jemných vláken v místě zákroku – nízké koncentrace LA i vazokonstrikční přísady

---

---

---

---

---

---

---

---

## Způsoby aplikace LA

### Svodná anestezie

epidurální anestezie – zvláštní případ svodné anestezie  
(regionální anestezie – označení pro blok nervových kmenů, včetně epidurální anestezie)

### Subarachnoideální anestezie

(intratékální, míšní, spinální, lumbální anestezie)  
aplikace LA do páteřního kanálu, vždy bez vazokonstrikční přísady!

### Intravenózní regionální anestezie (Bierova)

---

---

---

---

---

---

---

---

## Esterová lokální anestetika

### **kokain**

- první známé LA (lékařské použití od 1884)
- přírodní látka, izolována z listů jihoamerického keře *Erythroxylon coca*
- také centrálně euforizující látka s vysokým rizikem vyvolání závislosti
- pro povrchovou anestezii (dnes výjimečně k lokální anestezii ušního bubínku při paracentéze – Bonainův roztok, preskripce IPL na „recept s modrým pruhem“)

---

---

---

---

---

---

---

---

## Esterová lokální anestetika

### **prokain**

- nejstarší syntetické LA (poprvé syntetizován 1905)
- pomalý nástup, krátký účinek
- pro infiltrační a svodnou anestezii (špatně prostupuje kůží)

### **tetrakain**

- rychlý nástup účinku
- vysoce toxický - pouze pro povrchovou anestezii ústní dutiny a hltanu (kombinace s chlorhexidinem)

### **benzokain**

- pouze pro povrchovou anestezii ústní dutiny a hltanu (v kombinaci s antiseptiky)

---

---

---

---

---

---

---

---

## Amidová LA

### **trimekain**

- univerzální, pro všechny typy lokální anestezie
- používán i jako antiarytmikum

### **lidokain**

- univerzální lokální anestetikum, k povrchové, infiltrační i svodné anestezii
- používán i jako antiarytmikum

U trimekainu i lidokainu nutno snížit dávky na polovinu u pacientů léčených beta-sympatolytiky, inhibitory Ca<sup>2+</sup> kanálů a u epileptiků!

---

---

---

---

---

---

---

---

## Amidová LA

### mepivacain

- ve stomatologii, zejména u pacientů nesnášejících vazokonstriční přísady

### bupivacain

- všechny druhy lokální anestezie
- vysoce kardiotoxický

### levobupivacain

- obdobné vlastnosti jako bupivacain

### prilocain

- jen povrchová anestezie

---

---

---

---

---

---

---

---

## Amidová LA

### ropivacain

- všechny druhy anestezie kromě subarachnoid.

### cinchokain

- vysoce toxický, pouze pro povrchovou anestezii

### artikain

- rychlý nástup, dlouhý účinek
- využití zejména ve stomatologii

---

---

---

---

---

---

---

---

## Dělení dle intenzity účinku

### SLABÁ

prokain, benzokain

### STŘEDNĚ SILNÁ

trimekain, lidokain

### SILNÁ

tetrakain, bupivacain, artikain, ropivacain

---

---

---

---

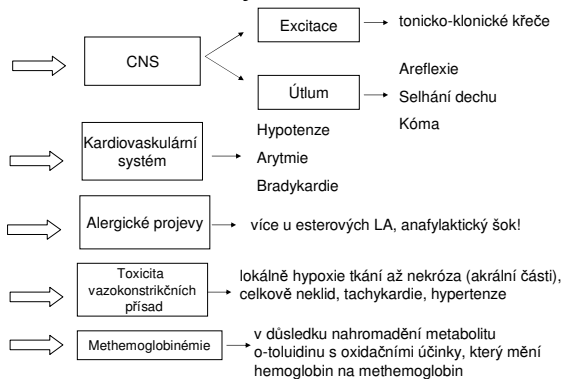
---

---

---

---

## Toxické účinky lokálních anestetik




---

---

---

---

---

---

---

---

## Intoxikace LA

### Alergická a anafylaktická reakce

#### Klinické projevy:

- svědění
- kopřivka
- nezánnětlivé otoky
- anafylaktický šok - neklid, úzkost, dušnost, často i zvracení
- vznik Quinckeho edému – nezánnětlivý, rychle se rozvíjející otok v obličejí, postihující oblast rtů, očí, tváří a mnohdy je postižena i oblast hrtanu – dušení pacienta!

#### Terapie:

- 1 mg adrenalinu v 10 ml fyziologického roztoku i.v.
- kyslík a infuze 5% glukosy s noradrenalinem
- hydrocortizon i.v.
- antihistaminika
- při selhávajícím dýchání zajistit volné dýchací cesty a zahájení umělé plicní ventilace

---

---

---

---

---

---

---

---

## Intoxikace LA

### Systémová toxická reakce

#### Klinické projevy: (nejčastěji do 15 min po aplikaci anestetika):

- zblednutí pacienta, neklid, mravenčení v rukou, mrazení nebo horko, nevolnost, závratě, studený pot
- zrychlené dýchání
- třes, záškuby drobných svalů, tonicko-klonické křeče
- tachykardie, v první fázi zvýšený krevní tlak
- v další fázi bezvědomí, pokles krevního tlaku, zpomalení srdeční akce
- v konečné fázi zástava dechu a krevního oběhu

#### Terapie:

- uložení do vodorovné polohy, u dechové nedostatečnosti kyslík
- při křečích thiopental nebo diazepam i.v.
- při kritickém poklesu krevního tlaku pomalu noradrenalin i.v.
- při zástavě dechu a oběhu resuscitace

---

---

---

---

---

---

---

---