

Lokální anestetika (LA)

MÚ: blokáda Na⁺ kanálů – zamezují vzniku a vedení akčního potenciálu

Chemická struktura LA

LA jsou amfifilní látky: lipofilní aromatická skupina + hydrofilní dusíkatý zbytek (ionizovatelný)
propojeny esterovou nebo amidovou vazbou

Klasifikace a detail MÚ:

Estery – kokain, prokain, benzokain, tetrakain

– Průnik pouze do cytoplazmatické membrány (CM) → narušení funkce kanálu

Amidy – lidokain, trimekain, mepivakain, artikain, bupivakain, ropivakain, cinchokain

– Průnik přes CM do cytosolu → narušení funkce kanálu

Fyzikálně-chemické vlastnosti LA

– **Přes membrány proniká nedisociovaná forma (LA)**

– **Vlastní účinek v buňce na Na⁺ kanál má disociovaná forma (LAH⁺)**

– LA jsou slabé báze, jejich účinnost je závislá na pH tkáně = na poměru ionizované/neionizované formy

Fyziologická tkáň: pH = 7,35

LA.HCl 25% LA absorbuje se → v buňce: LA 10% + H⁺ → 90% LAH⁺ působí
75% LAH⁺ neabsorbuje se

= Ve fyziologickém prostředí se absorbuje 25 % z podané dávky, v buňce se na aktivní formu přemění 90% z tohoto množství

Zánětlivá tkáň: pH = 6,4

LA.HCl 4% LA absorbuje se → v buňce: LA 10% + H⁺ → 90% LAH⁺ působí
96% LAH⁺ neabsorbuje se

= V zánětlivé se absorbují pouze 4 % z podané dávky, v buňce se na aktivní formu přemění 90% z tohoto množství

Vazokonstriční přísady

– Zástupci: adrenalin, noradrenalin, nafazolin

Zástupci esterových LA

- Kokain
- Prokain
- Tetrakain
- Benzokain

Zástupci amidových LA

- Trimekain
- Lidokain
- Mepivakain
- Bupivakain, levobupivakain
- Prilokain
- Chinchokain

Způsoby aplikace LA

Povrchová anestezie

- nervová zakončení ve sliznici
- roztoky, gely, masti, spreje, čípky
- sliznice, rohovka, jícen, dýchací cesty, močové cesty

Infiltrační anestezie

- infiltrace partií, v nichž bude výkon proveden
- subkutánní, intradermální, intramuskulární
- blokáce sensorických zakončení a drobných nervů
- nízké koncentrace LA i vazokonstriční přísady

Svodná anestezie

- bloky velkých senzitivních nervů a pletení
- epidurální → blokáda kořenů míšních nervů

Subarachnoideální anestezie

- intrathekální (uvnitř mozkových plen), míšní, spinální, lumbální anestezie
- aplikace do páteřního kanálu, vždy bez vazokonstriční přísady