

## Přehled officinálních a některých dalších lokálních anestetik s uvedením účinnosti

Č.	Látka	CAS <sup>1</sup>	LD <sub>50</sub> <sup>2</sup> myš [mg/kg]	Rel. povrch. anest. aktivita (na kokain) <sup>3</sup>	Rel. infiltrač- ní anest. aktivita (na prokain ) <sup>4</sup>	Anest. <sup>5</sup> index ( <i>Carassius</i> <i>carassius</i> )	Anest. index <sup>5</sup> ( <i>Carassius</i> <i>auratus</i> )	log P <sup>6</sup>	pK <sub>a</sub>
1	Articaini hydrochloridum (=kartikain)	23964-57-0 (23964-58-1)	37 i.v.		6,3			1,70	7,91
2	Methyl-4-	619-45-4	237 i.p.			0,4	0,47	1,63	2,53

rovněž officinální, jinak jde o běžnější synonymní název.

- CAS Registry Number, registrační číslo, které přiděluje každé nově popsané sloučenině redakce referátového časopisu Chemical Abstracts, vydávaného Americkou chemickou společností. Číslo se skládá ze 3 skupin číslic, oddělených dvěma pomlčkami, a je nezaměnitelným identifikačním znakem každého chemického individua. (CAS čísla se od sebe liší i různé soli jediné organické báze, různé optické izomery téže látky apod.) Podobný význam má např. BRN, Beilstein Registry Number, číslo, které nově popsaným organickým sloučeninám přidělovala redakce kompendia Beilstein's Handbuch der Organischen Chemie a nyní přidělují editoři databáze Beilstein Crossfire. Pokud je v tabulce uveden hydrochlorid lokálního anestetika, patří mu první CAS, další číslo v závorce náleží volné bázi.
- Dávka LD<sub>50</sub> samozřejmě závisí na způsobu podání a na druhu experimentálního zvířete. Vysvětlivky zkratk: i.v. – intravenózní, i.p. – intraperitoneální (tj. injekcí do dutiny břišní). Porovnávat a společně použít k regresní analýze lze pouze dávky stanovené pro stejný způsob podání a stejný živočišný druh.
- Stanovená na rohovce oka králíka.
- Stanovena na morčatech.
- Jedná se o stanovení lokálně-anestetické aktivity na rybách rodu *Carassius*, karas (*Carassius carassius*, karas obecný; *Carassius auratus*, karas stříbrný). Ryby se umístí do vodného roztoku lokálního anestetika o určité koncentraci a sleduje se, za jakou dobu se projeví anestetický účinek: ryby se zklidní, obrátí se na bok, zůstanou nehybné a klesnou ke dnu. Ztráta vnímání se zkontroluje tlakem na ploutev nebo ocas skleněnou tyčinkou. Zaznamenává se čas potřebný k plné anestézii a koncentrace anestetika v roztoku, každý pokus se několikrát provádí s několika rybami a počítá se průměr. Každá látka je otestována v několika koncentracích, výpočtem nebo graficky se pak určí koncentrace látek, které vedou k účinku za stejný čas. Anestetický index je pak získán dělením této koncentrace látky, která je zvolena jako standard (v našich příkladech benzokainu) odpovídající koncentrací dalších testovaných látek (nikoliv naopak – je nutno si uvědomit, že účinnost látky je tím vyšší, čím je účinná koncentrace nižší). Jinak řečeno, anestetický index je roven převrácené hodnotě poměru účinných koncentrací testované látky a standardu, potřebných k vyvolání anestézie za stejnou dobu. Ryby jsou po pokusu omyty destilovanou vodou a ponechány v ní nějakou dobu k regeneraci, lze je pak použít k dalším pokusům.
- Experimentálně stanovený pro volnou bázi v soustavě oklanol – voda.

Č.	Látka	CAS	LD <sub>50</sub> myš [mg/kg]	Rel. povrch. anest. aktivita (na kokain)	Rel. infiltrač- ní anest. aktivita (na prokain)	Anest. index (Carassius carassius)	Anest. index <sup>5</sup> (Carassius auratus)	log P	pK <sub>a</sub>
	aminobenzoát								
3	Benzocainum (=ethyl-4- aminobenzoát)	94-09-7	216 i.p.		6,1	1,0	1	2,15	2,56
4	Propyl-4- aminobenzoát (=risokain)	94-12-2	126 i.p.			2,5	2,37	2,82	2,54
5	2-propyl-4- aminobenzoát	18144-43-9				2,0		2,22	2,66
6	Allyl-4- aminobenzoát	62507-78-2				1,5			
7	Butyl-4- aminobenzoát (=butamben)	94-25-7	67 i.p.		22,1	4,3	4,49	3,31	2,54
8	Sek.butyl-4- aminobenzoát	18144-44-0				2,3			2,65
9	Isobutyl-4- aminobenzoát (=isobutamben)	94-14-4	48 i.p.			3,2		2,71	2,64
10	Terc.butyl-4- aminobenzoát	18144-47-3				2,1			2,74
11	Pentyl-4- aminobenzoát	13110-37-7	67 i.p.			4,6	4,54	3,78	2,54
12	Isopentyl-4- aminobenzát	38120-10-4							
13	Hexyl-4- aminobenzoát	13110-37-7					5,41	4,25	2,54
14	Heptyl-4-	13476-55-6					5,49	4,80	2,54

Č.	Látka	CAS	LD <sub>50</sub> myš [mg/kg]	Rel. povrch. anest. aktivita (na kokain)	Rel. infiltrač- ní anest. aktivita (na prokain)	Anest. index (Carassius carassius)	Anest. index <sup>5</sup> (Carassius auratus)	log P	pK <sub>a</sub>
	aminobenzoát								
15	Bupivacaini hydrochloridum monohydricum	14252-80-3 (21180-92-9)	6,1 i.v. (12,7) 58,7 i.p.		10,1			3,35	8,21
16	Ropivakain	98717-15-8 hydrochlorid 32112-35-7 hydrochlorid monohydrát 84057-95-4 baze	13,5 i.v.					2,90	
17	Mepivacaini hydrochloridum (=karbokain)	1722-62-9 (96-88-8)	35 i.v. (43,3)					1,95	7,92
18	Cinchocaini hydrochloridum (=perkain, dibukain)	61-12-1	3,8 i.v. 29 i.p.	0,75	2,99			2,52	7,26
19	Cocaini hydrochloridum	53-21-4 (50- 36-2)	15 i.v.	1	3,60			2,30	8,61
20	Karbizocaini hydrochloridum	68931-03-3 (76629-87-3)	16 i.v. 63 i.p.	251	416				8,80
21	Lidocaini hydrochloridum monohydricum (Lidocainum)	6108-05-0 (137-58-6 baze; 73-78-9 bezvodý hydrochlorid)	23 i.v. 142 i.p.	0,24	1,4			2,44	8,01
22	Trimecaini hydrochloridum	1027-14-1 (616-68-2)	50 i.v. 172 i.p.	1,0	2,50			3,13	7,9

Č.	Látka	CAS	LD <sub>50</sub> myš [mg/kg]	Rel. povrch. anest. aktivita (na kokain)	Rel. infiltrač- ní anest. aktivita (na prokain)	Anest. index (Carassius carassius)	Anest. index <sup>5</sup> (Carassius auratus)	log P	pK <sub>a</sub>
	(=mesokain)								
23	Oxybuprocaini hydrochloridum (=benoxinát)	5987-82-6 (99-43-4)	6,8 i.v.	44				3,54 o	1,90/8 ,50
24	Prilocaini hydrochloridum (Prilocainum)	1786-81-8 (721-50-6)	55 i.v.		4,5			1,40	7,80
25	Procainamidi hydrochloridum	614-39-1 (51- 06-9)	94,6 i.v. 290 i.p.					0,88	9,20
26	Procaini hydrochloridum	51-05-8 (59-46-1)	52 i.v. 192 i.p.	0,15	1			2,03	8,8
27	Tetracaini hydrochloridum	136-47-0 (94-24-6)	62 i.v. 57 i.p.	15,00	10,00			3,51	2,15/8 ,47
28	Trapencaini (=pentakain) hydrochloridum	38198-35-5 (76629-91-9)	15 i.v. 56 i.p.	135, 1	76,3			3,41	8,60 (9,26)

