

nu. K dispozici jsou pak ještě lidokain, mepivakain a bupivakain. Již mimo klinický význam je prokain.

Artikain

Artikain představuje jediné LA, které obsahuje thiofenový kruh se zabudovanou molekulou síry a ten je také zodpovědný za vysokou liposolibilitu umožňující rychlý nástup účinku. Jeho chemickou strukturu navíc charakterizuje přítomnost amidové i esterové vazby. Tato skutečnost má veliký význam pro jeho metabolismus, který nastává již v krevním oběhu štěpením esterové vazby plazmatickou pseudocholinesterázou, teprve potom pokračuje v játrech konverzí na inaktivní metabolit kyselinu artikainovou. I díky tomu je jeho index toxicity nižší než u prokainu – svého času označovaného jako zlatý standard s indexem 1 pro srovnávání toxicity s ostatními LA – a udává se v rozmezí 0,6–0,8 (3). Pro vysokou vazbu na plazmatické bílkoviny – asi 95 % – je také dostatečně dlouhý jeho klinický lokálně-anestetický účinek. Artikain a jeho metabolity jsou vylučovány ledvinami, pouze 5–10 % artikainu je vyloučeno v nezměněné formě (4).

V klinické praxi je artikain používán ve 4% koncentraci, která se v minulosti stala i terčem kritiky a spekulací ohledně jeho potenciální neurotoxicity způsobující nechirurgicky vzniklé parestie v oblasti nervus lingualis a nervus alveolaris inferior. Bylo však opakovaně dokázáno, že k podobným úvahám není důvod (5, 6).

Na rozdíl od zámoří je v Evropě platné rozdílné dávkování artikainu u dětí (5 mg/kg) a u dospělých (7 mg/kg).

Lidokain

Představuje historicky první LA amidového (acetanilidového) typu a od konce 40. let minulého století se stal nejrozšířenějším přípravkem používaným nejenom k místnímu znecitlivění, ale i jako antiarytmikum v kardiologii. V současné době je pro zubní praxi v ČR dostupný pouze ve 2% koncentraci bez přísady adrenalinu a používá se ojediněle. Patří mezi nejbezpečnější léčiva indiko-

vaná u gravidních pacientek a u dětí mladších 4 let. Vykazuje rovněž jenom výjimečně alergické reakce.

Nejvýznamnější pozici ve stomatologii zastává lidokain jako povrchově účinné LA, a to jak ve formě spreje (zpravidla baze o koncentraci kolem 10 %), tak i ve formě gelů – v zahraničí dostupných ve formě komerčních přípravků, u nás připravitelů magistraliter jako IPLP.

Lidokainu chemicky i klinicky charakteristikami velmi blízkým léčivem je pak československá originalita trimekain. V zubní praxi se v injekční podobě podobně jako prokain již nevyužívá, podobně jako lidokain se dá použít na přípravu gelu ke znecitlivění sliznice (tab. 1) (7).

Mepivakain

Mepivakain je LA acetanilidové řady, které se ve stomatologii nejvíce využívá pro svůj rychlý nástup účinku a dobrý průnik měkkými i tvrdými tkáněmi. Vyznačuje se vlastním velmi slabým vazokonstrikčním efektem, který není způsoben ovlivněním α_1 receptorů a umožňuje tak jeho použití i bez přísady adrenalinu. Roztok 3% mepivakainu bez dalších přísad je jednou z volby u pacientů s alergickou anamnézou na LA. Zanedbatelné ovlivnění kardiovaskulárního a respiračního systému při terapeutických dávkách předurčuje jeho použití při ošetřování pacientů se zdravotními riziky (8). V ČR je dosud registrován, ale dočasně nedostupný.

Bupivakain

O bupivakainu se všeobecně ví, že bývá označován za anestetikum volby u polyvalentních alergií. Jeho běžné užívání v dentální praxi je však velice omezené. Nekomfortní balení ve velkých ampulích, pomalý nástup účinku i vyšší cena limituje jeho zařazení do každodenní praxe. Je charakterizován relativně vysokou toxicitou (vůči prokainu je to 8) a svým prolongovaným účinkem může být především u dětí a jiných obtížně spolupracujících klientů příčinou mutilace z přikusování měkkých tkání. Jednou z jeho indikací je prodloužení pooperační anestezie/analgezie po náročnějších chirurgických výkonech v ústní dutině (7).

Toxické účinky

Systémové toxické účinky lokálních anestetik, někdy v literatuře označované jako LAST (local anesthetic systemic toxicity), se při zachování všech pravidel pro jejich bezpečné použití vyskytují jen ojediněle. Vyšší obezřetnost

je nutná u malých dětí, kde je potřeba rozsáhlejší sanace chrupu v několika kvadrantech, kterou navíc provádí méně zkušený lékař a použije některé z potenciálně toxičtějších LA – např. mepivakain. Přetěžujícím faktorem může být pak i nespolupracující pacient, který brečí, zatíná břišní svaly a vytváří přetlak krve v obličejové – jinde i bez toho dobře prokrvené – oblasti. Rychlá a pod tlakem provedená aplikace LA v maxilární oblasti může tak vést k rychlé penetraci léčiva přes relativně tenkou hranici mezi splachnokraniem a neurokraniem do CNS. Primárně depresorický efekt LA na CNS se nejprve projeví útlumem inhibičních okruhů, kdy převaha motorické aktivity může vést ke křečovým projevům. Pokud k nim dojde, jejich trvání několik desítek sekund (nejčastěji kolem 30 s až max. 90 s), kdy ke zklidnění dojde především díky redistribuci krve. Jde o nejčastěji se vyskytující projev toxické reakce z relativního předávkování, která ve svém důsledku nebývá život ohrožující. K absolutnímu předávkování, které může mít i fatální důsledky, dochází vzácně, a to výlučně při nedodržení doporučeného dávkování přípravku a jeho výraznému překročení. Proto především v pedostomatologické praxi se důrazně doporučuje vypočítat si maximální množství LA pro ošetření podle hmotnosti dětského klienta (9).

Přísady dentálních lokálních anestetik

Přípravky LA pro stomatologické účely jsou specifické tím, že se používají v silně prokrvených oblastech, a proto je jednou z nejčastějších přísad vazokonstrikční látka. Pro její stabilizaci je nutný přídavek dalšího činidla, které zabraňuje jejímu rozkladu – tzv. stabilizátor. V menší míře se pak uplatňují či uplatňovaly ještě další přísady.

Vasokonstriktory

Schopnost vazokonstrikce po podání LA zajišťuje nejenom jeho dostatečnou anestetickou účinnost v místě deponování, ale i omezení jeho vstřebávání do systémové cirkulace. Dentální LA jsou totiž jednou z mála skupin léčiv, u kterých není snaha dosahovat cílených plazmatických koncentrací. Tím se zabraňuje i možným toxickým účinkům. Vasokonstriktor pak i zpřehledňuje operační pole.

Nejčastěji používanou látkou je adrenalin. Přidává se k LA zpravidla ve dvou koncentracích – nepoužívanější je ředění 1 : 200 000,

Tab. 1. Magistraliter receptura k přípravě 2 % lokálně anestetického hydrogelu s obsahem trimekainu

Rp.	
Trimecaini hydrochlor.	2,0
Hypromellosi (z. v. 17350)	1,8
Glyceroli 85%	8,0
Aq. conserv.	ad 100,0
M. f. gel.	