

Nepřímá parasymphatomimetika

Obecné vlastnosti

- Nepřímá působící parasymphatomimetika jsou látky, které inhibují ACHE (nepůsobí na receptor, ale na ACHE – acetylcholinesterázu).
- Rozlišujeme:
 1. krátkodobé inhibitory ACHE (reverzibilní);
 2. dlouhodobé inhibitory ACHE (ireverzibilní).

Účinky a využití

- V důsledku inhibice ACHE dochází k nahromadění ACH.
- Využívá se při pooperační atonii, k vyvolání miózy a snížení nitroočního tlaku, ke zvýšení stimulace na nervosvalové ploténce (při léčbě Myasthenia gravis).

Nežádoucí účinky

- Z nadměrné stimulace CNS acetylcholinem může docházet ke zmatenosti, ataxii, křečím a eventuálně ke kómatu.
- Z nadměrné stimulace *M* receptoru v sympatických gangliích může dojít k paradoxnímu zvýšení krevního tlaku, tachykardii.

Krátkodobé inhibitory acetylcholinesterázy

Účinkují jak na *N* receptor (nikotinový), tak na *M* receptor (muskarinový).

Terapeutické použití

1. Myasthenia gravis.
2. Antidotum pro kompetitivní periferní myorelaxancia.
3. Pooperační atonie GIT a močového měchýře.
4. Miotikum a antiglaukomatikum.

Používané látky

Fysostigmin

- Přirozený alkaloid.
- Prochází hematoencefalickou bariérou.
- Antidotum při otravách parasymphatolytiky (např. atropin).
- Používá se v očním lékařství – mióza, snižuje nitrooční tlak.

Neostigmin

- Neprochází hematoencefalickou bariérou.
- Využití při myasthenia gravis (zvýšuje ACH na nervosvalové ploténce).
- Antidotum blokátorů ploténky (myorelaxancia).

Edrofonium

- Velmi rychlý nástup účinku.
- Využívá se k diagnóze myasthenia gravis (stav se po podání zlepší, pacient byl poddávkován a je třeba zvýšit dávku).

Dlouhodobé inhibitory acetylcholinesterázy

Používají se k léčbě demence při Alzheimerově nemoci.

 *Podrobnější informace naleznete na stránce Alzheimerova choroba/Inhibitory cholinesteráz.*

Další mají toxikologický význam – **organofosfáty**.

Intoxikace organofosfáty

- Probíhá rychle.

- Trvale fosforylují ACHE.
- Projevuje se jako nauzea, křeče, zvracení, zvýšená salivace, bradykardie, slzení, anorexie, slabost kosterních svalů, snížené dýchání až smrt (zástava dechu či zhroucení oběhu).

Terapie intoxikace organofosfáty

- Zamezení vstřebávání.
- Řízené dýchání, protikřečová léčba.
- Podání atropinu (blok *M* receptorů).
- Preventivně krátkodobé inhibitory (Neostigmin).
- Reaktivace cholinesterázy – **oximy**.

Oximy

Jsou schopné navázat organofosfát, který má všechny postranní struktury, a odtrhnout ho od ACHE. Jakmile je ztratí, dojde ke kovalentní vazbě s ACHE, vazba je ireverzibilní. Musí se oximy podat včas (např. trimedoxim, pralidoxim).

Odkazy

Související články

- Parasympatomimetika
- Přímá parasympatomimetika
- Sympatomimetika
- Sympatolytika

Zdroj

- HYNIE, Sixtus. *Farmakologie v kostce*. 2. vydání. Praha : Triton, 2001. ISBN 80-7254-181-1.