

### ANTICHOLINERGIKA

= látky, které antagonizují účinek Ach

Zahrnují:

**Parasympatolytika (antimuskarinika):** kompetitivní antagonisté Ach na M - receptorech, malý nebo žádný účinek na N - receptory.

\*vyjimka kvarterní amoniové soli, ty mohou blokovat částečně i N

**Periferní myorelaxancia:** blok Nm - receptorů

**Ganglioplegika:** blok Nn - receptorů ve vegetativních gangliích, obsolentní=zastaralé

### Parasympatolytika

#### FARMAKOLOGICKÉ ÚČINKY

-vycházejí z opačných účinků M - receptorů

**oko** - dilatace zorničky, zvýšení nitroočního tlaku, suchost **NÚ:** glaukumatozní záchvat, mydriáza, cykloplegie = ochabnutí svalů řasnatého tělíska

**srdce** - zvýšení FS, ale TK a srdeční výdej nezměněn! **NÚ:** tachykardie, záchvat Anginy pectoris, zhoršení při srdečním selhávání

**DC** - inhibice bronchiální sekrece a **inhibice bronchokonstrikce**

**žlučník** - malý antispasmodický účinek

**žlázy** - snížení sekrece/**NÚ:** sucho v ústech, hypertermie kvůli zástavě pocení

**CNS** - vysoké dávky atropinu vedou k neklidu, dráždivosti, zmatenosti, halucinacím, delirium, deprese oběhového a dýchacího traktu až selhání

**atropinový flush**

#### INDIKACE

**Bronchodilatancia** (astma, CHOPN): účinek se nesnižuje s dlouhodobým užíváním

**Spasmolytika** (léčba inkontinence, spasmy hladkosvalových orgánů, střevní hypermotilita)

**Antiarytmika** (bradykardie): **léky první volby u bradikardií**

**Antiparkinsonika:** pouze doplňková terapie, zejména proti třesu

**Mydriatika:** navození mydriázy před vyšetřením očního pozadí

**Antidota:** při otráveních cholinomimetiky a organofosfáty

**Myastenia gravis:** podání antagonizuje NÚ iAChE plynoucí ze stimulace M -receptorů

#### KONTRAINDIKACE

glaukom, retence moči, BHP, střevní atonie, pozor i u ISCH

### Parasympatolytika (cont)

#### INTERAKCE

antimuskarinový účinek zesilují některá antihistaminina, neuroleptika, antidepresiva, antiparkinsonika

#### Další NÚ:

**GIT** - zácpa

**Močové cesty** - obtížné močení, retence moči zejména u osob s BHP = benigní hyperplazie prostaty

\*M-receptory jsou různě citlivé k blokádě, nejcitlivější je slinná, potní a bronchiální sekrece. Nejméně citlivá je sekrece HCL.

### Léčiva - parasympatolytika

**Atropin** hlavně při bradyaritmích, před celkovou anestezii, při intoxikaci inhibitory AchE, spasmolytikum trávicích a močových cest

**Ipratropium** léčba astma a CHOPN, neselektivní k M, účinek 4-6h

**Tiotropium** léčba astma a CHOPN: selektivita k M1 a M3, účinek 24 (36)h

**N-butylskopolamin** relaxace svaloviny GIT, žlučníku, urogenitálu

**Difenoxylát + Atropin (Reasec)** léčba průjmů

**Biperiden** parkinsonismus

**Trospium** léčba inkontinence

**Solifenacil** léčba inkontinence

**Tropicamid** vyšetření očního pozadí



By **BarboraSlizova**  
(barbora5467)

Published 27th December, 2021.  
Last updated 28th December, 2021.  
Page 1 of 4.

Sponsored by **Readable.com**  
Measure your website readability!  
<https://readable.com>

### CHOLINOMIMETIKA

= látky stimulující všechny Ach receptory

Zahrnují **parasymptomimetika**: jejich aktivace připomíná podráždění parasymptiku (M receptory na efektech parasymptiku + M receptory sympatiku - potní žlázy)

a **Agonisty N - receptorů**: v neuromuskulární ploténce, v CNS, ve vegetativních gangliích

Dělíme je na:

- **přímá**: přímá stimulace Ach receptorů
- **nepřímá**: inhibují acetylcholinesterázu, tím zvýší Ach v synaptické štěrbině (nebo nervosvalových spojích), dojde tak ke stimulaci M nebo N receptorů

### Cholinomimetika přímá

Estery cholinu:	Přírodní alkaloidy
<b>Ach</b> : nevyužívá se klinicky, neselektivní M i N	arecolin
<b>Karbachol</b> : neselektivní	muscarin
	<b>pilocarpin</b> : selektivní k M, oftalmologie

### Nepřímá cholinomimetika

Dělíme na **reversibilní**: váží se podobně jako fyziologický Ach na AchE, ale vzniká karbamát, který je více stabilní a hydrolyzuje se pomaleji. Účinek 2-4h.

**ireversibilní**: př. organofosfáty, navázané na AchE jsou vzniklé fosfáty extrémě stabilní, může dojít k agingu, kdy regenerace enzymu již není možná

**Účinky reversibilních iAChE:**

**oko** - mioza, snížení nitroočního tlaku, blokáce akomodace čočky

**GIT** - zvýšená peristaltika a sekrece

**svaly** - nízké dávky vedou ke zvýšení síly, vysoké až k paralýze

**srdce** - bradykardie a snížení výdeje, vyšší dávky = hypotenze a AV bloky, kompenzačně může dojít ke zvýšení FS

**žlázy** - sekrece bronchiálních, potních a slzných

**CNS** - nízké dávky stimulace, vysoké dávky křeče, koma, zástava dechu

**INDIKACE**

### Nepřímá cholinomimetika (cont)

**Glaukom**

**Alzheimerova nemoc** - léčba mírných až středních forem

**Ukončení účinků kompetitivních blokátorů neuromuskulární ploténky**

**Myastenia Gravis**

**Intoxikace atropinem**

### Periferní myorelaxancia

=látky navozující myorelaxanci přímým účinkem na nervosvalovou ploténku (=synapse v kosterním svalu)

brání účinku Ach ve svalech => snižují tonus kosterního svalstva až do úplného ochabnutí, vědomí zachováno

Dělíme na:

**Nedepolarizující (kompetitivní)**: kompetice s Ach o Nm receptor, protože nejsou agonisti, tak nedojde ani k otevření Na kanálu, buňka zůstává v klidovém membránovém potenciálu

**Depolarizující**: agonistické působení na Nm + jeho blokáda, nejsou štěpeny AchE a působí tedy delší dobu, výsledkem neustále otevřené sodné kanály, buňka se nenavrací do klidu

- oba typy ovlivňují postsynaptické působení Ach na Nm

**Struktura a vlastnosti**

- musí obsahovat dva pozitivní N-atomy oddělené lipofilní strukturou

- velmi dobře rozpustné ve vodě, nevstřebávají se p.o a nepronikají do CNS

### FYZIOLOGICKY

Aktivace nervového zakončení => uvolnění Ach z vezikul do

synaptické štěrbině => uvolněný Ach aktivuje Nm receptory (na

postsynaptické membráně) => stimulace Nm vede k otevření Na+

kanálu = depolarizace svalové buňky = svalové trnutí. Účinek Ach

rychle ukončen AchE přímo v synaptické štěrbině



By **BarboraSlizova**  
(barbora5467)

Published 27th December, 2021.

Last updated 28th December, 2021.

Page 2 of 4.

Sponsored by **Readable.com**

Measure your website readability!

<https://readable.com>

### Nedepolarizující periferní myorelaxancia

#### Benzylisocholinový typ

-odvozené od tubokurarinu, **uvolňují histamin**

mivakurium: 12-18 min, eliminace plazmatickou cholinesterázou

atracurium: 30-60min, eliminace spontánní v plazmě nebo plazmatické esterázy, vhodné u poruch ledvin a jater

**tubokurarin**: neregistrován, 60-120 min, eliminace v ledvinách (\*částečná blokáda autonomních vegetativních ganglií - tachykardiie, hypotenze)

#### Steroidního typ

**-neuvolňují histamin**

**rocuronium**: 50min, eliminace ledvinami, játry

vecuronium: 60min, eliminace játry

pipecuronium: 80-100min, eliminace ledvinami

**pancuronium**: 120-180 min, eliminace ledvinami (blokuje srdeční M receptory - zvýšení FS a TK)

\*prvními ovlivněnými svaly jsou okohybné, poté svaly obličeje, krku, končetin, interkostální a břišní svalstvo a nakonec bránice

\*pro ukončení účinku (hl. rocuronia) použití **Sugammadexu**, nebo podáním inhibitorů acetylcholinesterázy (iAChE)

### Depolarizující periferní myorelaxancia

- jsou to biskvartérní amoniové soli

#### SUXAMETHONIUM

- nástup účinku velice rychlý i.v.

- krátkodobé působení

- depolarizace svalové ploténky nejprve vyvolá záškuby

#### NÚ

bolest svalů, bradykardie, uvolnění K<sup>+</sup>, zvýšení nitrolebního a nitroočního tlaku, maligní hypertermie, prolongovaná paralýza u lidí se sníženou aktivitou pseudocholinesterázy

\*podání iAChE myorelaxancii neodstraní, naopak ji může prodloužit



By **BarboraSlizova**  
(barbora5467)

Published 27th December, 2021.  
Last updated 28th December, 2021.  
Page 3 of 4.

Sponsored by **Readable.com**  
Measure your website readability!  
<https://readable.com>

### léčiva - nepřímá cholinomimetika (iAChE)

<b>Fysostigmin:</b> experimentálně, účinek okolo 2h	jen experimentálně, v oftalmologii (glaukom), antidotum parasimpatolytik (atropin)
<b>Neostigmin:</b> méně NÚ oproti fysostigminu, účinek okolo 2h	HI. indikace: anestezilogie ( <i>ukončení účinku nedepolarizující neuromuskulární blokace</i> ), myastenia gravis

iAChE jen na Alzheimerera: **galantamin, rivastigmin, donepezil**

### IREVERSIBILNÍ

**Intoxikace organofosfáty:** parami zasaženo oko a DC, při ožití GIT, vyvíjí se extrémní pocení, slinění uvolnění stolice a moči, dále paralýza svalů, slabost, zmatenost ztráta reflexů, koma

**Pozdní následky:** degradace svalové ploténky, demyelinizace motoneuronů, těžká obrna, atrofie

### N - agonisté

#### Nikotin

jen toxikologický význam

stimuluje a pak desenzitizuje N receptory

uvoňuje i opioidy, glukokortikoidy a adrenalin

ovlivňuje i dopaminergní dráhy

#### ÚČINKY

**CNS:** malé dávky - stimulace, lepší pozornost, pocit uvonění/vyšší dávky: třes, křeče, paralýza svalů

**GIT:** nauzea, průjem, zvracení \*zrychluje metabolismus

**Srdce:** vazokonstrikce, tachykardie, zvýšení TK

Ze začátku stimuluje slinných a bronchiálních žláz, následuje však jejich inhibice

### N - agonisté (cont)

**VARENICLIN:** parciální agonista jednoho subtypů N-receptorů = léčba závislosti

- N receptor je ligandem otevíraný iontový kanál (spolu s GABA, glycinovým a 5-HT3)

#### Suxamethonium

- periferní depolarizující myorelaxans

- agonista na Nm receptorech (stejně jako fyziologický Ach - otevření Na<sup>+</sup> kanálu = depolarizace, Ach je pak štěpen AchE)

- Rozdílem oproti Ach je to, že suxamethonium není štěpeno AchE, působí delší dobu => neustále otevřené Na kanály



By **BarboraSlizova**  
(barbora5467)

[cheatography.com/barbora5467/](https://cheatography.com/barbora5467/)

Published 27th December, 2021.

Last updated 28th December, 2021.

Page 4 of 4.

Sponsored by **Readable.com**

Measure your website readability!

<https://readable.com>