


Barbituráty

Barbituráty jsou silně lipofilní deriváty **kyseliny barbiturové**. Dobře se vstřebávají ze střeva, lze je podat *per os*. Nástup a délka účinku závisí na poměru rozpustnosti v tukových rozpouštědlech a ve vodě. Vážou se na albumin, ale účinná je volná složka. Degradace probíhá v játrech, exkrece v ledvinách. Degradace probíhá disulfurací jaterními enzymy na oxybarbiturát středně dlouhého účinku. Eliminace mnoha barbiturátů je pomalá (např. thiopental  má poločas 11,5 hodiny), takže opakované podání může vést ke kumulaci. Barbituráty nemají specifického antagonistu.

Účinek

Barbituráty působí na komplex GABA-Cl. Ovlivňují funkci chloridového kanálu i bez přítomnosti GABA. Způsobují poruchy REM spánku.

Užití

V nízkých dávkách využití jako sedativa, ve vyšších dávkách mají hypnotický účinek. Mohou se používat jako antiepileptika pro svůj antikonvulzivní účinek. Užívaly se k léčbě nespavosti. Barbituráty, které obsahují ve své molekule síru, se využívají k úvodu do anestezie.

Kontraindikace

- hypersenzitivita na léčivo
- porfyrie
- těžká jaterní a ledvinná poškození^[1]

Nežádoucí účinky

- barbituráty jsou inductory mitochondriálních enzymů – ovlivňují metabolismus jiných léků (většinou urychlení metabolismu)
- tlumí dýchací centrum – musí se aplikovat pomalu, jinak dochází k apnoické pauze
- zmatenost
- poruchy vědomí
- závislost a silné abstinenční příznaky (spazmy, poruchy srdečního rytmu)

Používané látky

Thiopental

- i.v. podání
- při úvodu do anestezie (část předchozí dávky v těle zůstává, při podání další dávky a nebo u ambulantních výkonů musí pacient 1–2 hodiny po aplikaci počkat, než se vyplaví veškerý thiopental)

Fenobarbital

- dlouhodobý účinek
- hypnotický účinek
- antiepileptikum – inhibuje excitace prostřednictvím glutamátového receptoru (brání vzniku patologického dráždění)
- silně indukuje mikrosomální enzymy v játrech
- teratogenní účinek

Další:

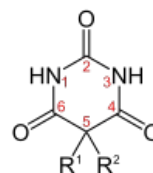
- Hexobarbital
- Cyklobarbital

Otravy

V případě otravy je nutné provést dialýzu a alkalizaci moči.

- při kyselém pH (neionizovaná forma) – barbituráty se z těla neodstraní, přefiltrují se přes filtrační membránu, ale zpětně se vstřebají
- při zásaditém pH (po podání bikarbonátu) – barbituráty se odstraní z krve i z mozku (přes HEB)

Jako antidotum se může užít *strychnin*



Základní
struktura
barbiturátů

Odkazy

Související články

- Hypnotika
- Sedativa
- Antiepileptika

Použitá literatura

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

Reference

1. SPC O LIEKU THIOPENTAL VALEANT,. *SPC - thiopental* [online]. [cit. 2017-01-12]. <<https://www.sukl.cz/modules/medication/detail.php?code=0216673&tab=texts>>.