

# Antiemetika

**Zvracení** je základním mechanismem chránícím organismus před vstřebáním jedů a toxinů požitých ústy. Bývá však vyvoláno i v situacích, kdy je neúčelné a škodlivé, např. v průběhu těhotenství, neobvyklým pohybem, úzkostí, chirurgickým zákrokem nebo chemoterapií. V těchto případech je třeba jej tišit a nejlépe mu předcházet.

**Antiemetika** lze rozlišit podle jejich afinity a vnitřní aktivity vůči výše uvedeným receptorům. Jejich rozmanitých lékových forem lze využít tak, jak požadují individuální podmínky.

## Antiemetika k prevenci kinetóz a vestibulárních poruch

### Skopolamin

Skopolamin je jedním z nejstarších léků používaných v léčbě kinetóz a je srovnatelně účinný s nově zavedenými látkami. Ve formě náplasti se využívá např. k profylaxi tzv. mořské nemoci<sup>[1]</sup>. Nežádoucím účinkem je sedace a sucho v ústech.

### Antihistaminika

Antihistaminika mají významné místo v profylaxi kinetóz i při potlačování již vzniklé kinetózy. **Dimenhydrinát** se využívá i k terapii nevolnosti u těhotných<sup>[1]</sup>. Patří mezi slabší antiemetika. Nelze také opomenout některé závažné nežádoucí účinky (celkový útlum, ortostatická hypotenze vyvolaná u vnímavých jedinců antiadrenergními účinky, neostře vidění způsobené výrazným „atropinovým“ působením na periferní muskarinové receptory), pro které nemůžou být podány řidičům motorových vozidel.

Zvláštní postavení ve skupině má **betahistin**, jehož mechanismus spočívá v antagonismu  $H_3$  receptorů (a také ve stimulaci  $H_1$  receptorů). Jeho podání vede k vazodilataci arteriál vnitřního ucha, příznivě ovlivňuje nauzeu a zvracení centrálního původu. Nepůsobí sedativně.

K léčbě závratí a zvracení vyvolaného vestibulárními poruchami je vhodný také cinnarizin, vazodilatans ze skupiny neselektivních kalciových antagonistů.

## Antiemetika tišící zvracení vyvolané chemoterapií

### Antagonisté dopaminových receptorů $D_2$ (antidopaminový účinek)

Antagonismus  $D_2$  receptorů je spojený s prokinetickým účinkem. Mezi  $D_2$  antagonisty se řadí i neuroleptika, která lze v této indikaci využít. S neuroleptiky je spojený i sedativní a antipsychotický účinek, čehož se využívá v operační premedikaci<sup>[1]</sup>.

**Benzamidy (antidopaminový účinek)** - nejrozšířenějším antiemetikem této skupiny je **metoklopramid**.

**Fenothiaziny (neuroleptika)** - thiethylperazin (Torecan)

**Butyrofenony (neuroleptika)** jsou středně silně působícími antiemetiky.

- haloperidol, droperidol a domperidon,

Nežádoucími účinky neuroleptik jsou krom jiného sucho v ústech, sedace a možný vznik extrapyramidového syndromu - mimovolných pohybů.

### Kortikosteroidy

**Dexametazon a metylprednizolon** užíváme v situaci mírného až středně závažného zvracení. Neindikujeme je v případě silného zvracení způsobeného např. vlivem cisplatiny. Obvykle jsou podávány v kombinaci s antidopaminovými antiemetiky či antagonisty  $5-HT_3$  receptorů (*setrony*). Působí pravděpodobně změnou buněčné permeability.

### Kannabinoly

**Dronabinol a nabilon** užíváme u nemocných se středně silně působící emetogenní chemoterapií. Antiemetikem první volby jsou jen zřídka z důvodu nežádoucích účinků (dysforie, halucinace, sedace, závratě, sucho v ústech a dezorientace). Díky orexigennímu účinku jsou vhodné při nádorové kachexii u nemocných s nedostatečnou odpovědí na jiný typ antiemetik.

### Benzodiazepiny



Metoklopramid

**Lorazepam a alprazolam** používáme u nemocných se současnou úzkostí související s chemoterapií (se základním onemocněním).

## Antagonisté 5-HT<sub>3</sub> receptorů

Jsou druhou nejnovější skupinou antiemetik. Představitelem je **ondansetron**, který účinkem odpovídá vysokodávkovému režimu metoklopramidu (s výhodou - nevede k jeho nežádoucím účinkům). Účinkuje proti zvracení vyvolaným všemi chemoterapeutiky i radioterapií, a to v podobě lékových forem i.v. i per os. Užíváme ho i k prevenci zvracení v souvislosti s chirurgickými výkony. V poslední době se ukázal účinným i k ovlivnění zvracení vyvolaného u nemocných AIDS po podání kotrimoxazolu.

Nevýhodou je vysoká cena, naopak výhodou rychle nastupující účinek vyžadující většinou nízký počet opakovaných podání. Nežádoucí účinky bývají mírné a přechodné, např. bolest hlavy, zácpa (zpomalením střevní pasáže), kožní vyrážky, zvýšení aktivity tranzamináz.

Dalšími novými členy této skupiny jsou **granisetron**, **tropisetron** a **dolasetron**.

## Antagonisté NK<sub>1</sub> receptorů

Antagonisté receptoru pro neurokinin-1 jsou nejnovější antiemetickou léčbou. Využíváme je při častém zvracení během chemoterapie. Zástupcem je **aprepitant**<sup>[2]</sup>.

## Ostatní antiemetika

### Anxiolytika

U psychogenního zvracení a úzkostných stavů spojených s nauzeou lze použít i anxiolytika se sedativním a antiemetickým účinkem, např. **hydroxyzin**.

## Odkazy

### Související články

- Zvracení

## Externí zdroje

Současné možnosti léčby nevolnosti a zvracení (<http://www.remedia.cz/Okruhy-temat/Gastroenterologie/Soucasne-moznosti-lecby-nevolnosti-a-zvraceni/8-12-dt.magarticle.aspx>) Remedia 3/2003 Prof. MUDr. Pavel Klener, DrSc.

## Reference

1. HERDEGEN, Thomas. *Kurzlehrbuch Pharmakologie und Toxikologie : 328 Tabellen*. 2.. vydání. Thieme, 2010. 535 s. s. 163. ISBN 9783131422927.
2. KOUBA, Michal. *Stáž v ÚHKT* [přednáška k předmětu Interna předstátnicová stáž, obor Všeobecné lékařství, 1. lékařská fakulta Univerzita Karlova]. Praha. 21.5.2014.

## Použitá literatura

- MARTÍNKOVÁ, Jiřina, Stanislav MIČUDA a Jolana ČERMÁKOVÁ. *Vybrané kapitoly z klinické farmakologie pro bakalářské studium : Terapie peptického vředu, zvracení, zácpy a průjmu* [online]. ©2001. [cit. 2010-07-16]. <<https://www.lfhk.cuni.cz/farmakol/predn/bak/kapitoly/git-bak.doc/>>.