

TRIMEKAINOVÝ GEL 1 %

SLOŽENÍ

Trimecaini hydrochloridum 1,0 g, Carbethopendecinii bromidum 0,2 g, Methylcellulosum 4,0, Aqua purificata ad 100,0 g.

LOKÁLNĚ ANESTETICKÁ SLOŽKA

Trimecaini hydrochloridum (mesocaini).

Vlastnosti

Bezbarvé jehličkové krystalky, teplota tání 137–139 °C je velmi dobře rozpustný ve vodě, dobře v ethanolu, nerozpustný v organických rozpouštědlech. Je mírně hygroskopický a měl by se uchovávat v lahvích vzduchotěsně uzavřených. V roztoku vody je mimořádně stabilní. Lze jej sterilizovat v autoklávu.

Trimecaini hydrochloridum (Mesocain) se řadí mezi amidová lokální anestetika, je to látka originálně vytvořená v bývalém Československu. (Pozn. odborné redakce: kombinované přípravky s obsahovou látkou trimekainem v roli lokálního anestetika se v rámci Evropy používaly v Rakousku, Německu, Rusku a v ČR.) Je vhodný pro všechny druhy lokální anestezie v různých koncentracích. V injekční formě se podává v koncentraci 0,5–2 %. Pro zevní použití se používá v koncentracích 1–4 % jako roztok ve vodě nebo gelu.

U amidových lokálních anestetik je výskyt alergických reakcí nižší než u esterových lokálních anestetik. Anestetický účinek nastupuje do 15 minut po podání a trvá 60–90 minut.

Mechanismus účinku lokálních anestetik spočívá v blokádě prostupu sodných a draselných iontů přes membránu nervové buňky. Tím je blokován vznik a postup akčního potenciálu.

Zpracování v organismu

Trimekain je metabolizován v játrech a vylučuje se ledvinami z 10 % nezměněn, z 90 % ve formě metabolitů. Biologický poločas v organismu je přibližně 90 minut. Léčivá látka prochází hematoencefalickou a placentární bariérou. Kyselé pH tkáně při zánětu snižuje jeho účinnost, alkalemie jeho působení mírně umocňuje.

ANTISEPTICKÁ SLOŽKA

Carbetopendecinii bromidum (septonex).

Vlastnosti

Bílá jemně krystalická látka, teplota tání 154 °C, velmi dobře rozpustný ve vodě a ethanolu. Vodné roztoky jsou stálé i za varu.

Carbetopendecinii bromidum patří do skupiny kvartérních amoniových solí. Působí dobře na gram-pozitivní vegetativní formy bakterií a při delších expozicích inaktivuje některé viry. Nepůsobí na mykobakteria a spóry bakterií.

Mgr. Petr Mlýňář,
PharmDr. Dobroslav Šrámek,

Nemocniční lékárna,
FN Královské Vinohrady, Praha

Od poloviny prosince minulého roku se v praxi lékárny setkáváme s výpadkem přípravku Mesocain gel 20 g/200 mg (obsahové látky:

Trimecaini hydrochloridum, Carbethopendecinii bromidum, používaným v indikaci lokální anestezie sliznice močové trubice při katetrizaci, a to z důvodu mikrobiální kontaminace a nevyhovující viskozity.

Jelikož tento přípravek hraje významnou úlohu v oblasti místní anestezie, uvádíme pro vás magistraliter přípravu tohoto gelu.

GEL

Při přípravě je potřeba vždy vzít u úvahu vlastnosti léčivých i pomocných látek. V tomto konkrétním případě lze očekávat interakci mezi trimecaini hydrochloridum a karbopolovým gelem (neutralizovaná polyalkylová kyselina) za vzniku nových sloučenin, ovlivnění viskozity gelu, ovlivnění stability. Jako gelotvorný základ je vhodný některý z derivátů celulózy, například methylcelulóza, která je běžně dostupná a má všechny platné atesty.

Dalším rozhodovacím momentem před vlastní přípravou je, jakou zvolit konzistenci gelu a na jaké místo se daný gel bude používat. Pro použití v urologii se hodí tento gel ve 4% koncentraci při zdánlivé viskozitě 2% roztoku 369 mPa.s, tuto koncentraci lze samozřejmě modifikovat podle požadavků pracoviště, kde se bude používat, nebo podle uvedené zdánlivé viskozity konkrétně dodané methylcelulózy. Vzhledem k tomu, že se tento gel používá do močové trubice, nehrozí zde vysychání, a proto není nutné přidávat do něj například glycerol, který by vysychání zabraňoval.

Gelotvorná látka

Methylcellulosum – částečně O-methylovaná celulóza.

Vlastnosti

Bílý, nažloutle bílý nebo šedobílý prášek nebo granule. Ve vysušeném stavu je hygroskopická, prakticky nerozpustná v horké vodě, v acetonu, v ethanolu, v éteru a v toluenu. Rozpouští se ve studené vodě za vzniku koloidního roztoku.

PŘÍPRAVA GELU

Nejdříve rozpustíme v čištěné vodě zvlášť ve 20 gmech mesocain a zvlášť ve 20 gmech septonex. Při vlastní přípravě methylcelulózy gelu lze výhodně využít závislosti rozpustnosti na teplotě, proto zahřejeme přibližně 40 gramů vody k varu. Do této vroucí vody přidáme methylcelulózu a dokonale suspendujeme. (Při přípravě gelů je vždy výhodné dokonale suspendovat vysušenou gelotvornou látku tak, aby se jednotlivé částice neshlukovaly a neslepovaly do větších celků. Jejich další rozpouštění je potom časově prodlužovalo celkovou přípravu.) Když je methylcelulóza dokonale suspendována, doplníme 20 gramů studené vody a dobře promícháme.

Přidáme rozpuštěný mesocain a septonex, dovážíme do potřebného množství čištěnou vodou a znovu zhomogenizujeme.

Adjustace do konečného obalu již závisí na požadavku konkrétního oddělení a možnostech lékárny, kde se gel připravuje.

Stabilita gelu: 1 měsíc při balení v tubě

Uchování gelu: při teplotě 2–8 °C

ZÁVĚR

Pokud budete potřebovat tento gel sterilní, je lépe než methylcelulózu, která se při sterilizaci v autoklávu za vysoké teploty vysráží, použít jiný neionogenní derivát modifikované celulózy, v tomto případě nedoporučujeme přidávat antiseptickou přísadu.

Pokud již nemáte k dispozici v lékárně septonex a nemůžete jej sehnat, lze jako antiseptickou přísadu použít chorhrxidn diglukonát solutio 0,263g ve 100g.

Poznámka odborné redakce:

Trimekain je látka s velice omezeným geografickým použitím. Přípravky s obsahem trimekainu jsou kromě ČR registrovány v Rakousku, Německu a Rusku. I v těchto zemích ale neexistuje monokomponentní přípravek pouze s obsahem trimekainu. Většinou se jedná o vícekomponentní přípravky, kde trimekain je doprovodnou anesteticky působící látkou. V současnosti jsou reálně dostupné pouze následující kombinované přípravky:

Levosin

(Nizpharm, Rus.):
infekce kůže – chloramphenicol – sulfadimethoxine, methyluracil; trimecaine;

Simetrid

(Nizpharm, Rus.):
anorektální poruchy – flucinolone acetonide, bismuth subgallate, menthol. trimecaine.

