



K o k a i n

Charakteristika



Pavel Krmenčík
Jaroslav Šejvl

V Ý U K O V Ý T E X T



**Publikace vznikla a byla vydána pod odbornou
záštitou a koordinací:**



Centra adiktologie, PK 1. LF UK v Praze a VFN v Praze

Díky finanční podpoře:

**projektu Příprava a rozvoj denního magisterského studia oboru adiktologie
CZ.2.17/3.1.00/31430**



**Evropský sociální fond
Praha & EU: Investujeme do vaší budoucnosti**

**Tento projekt je financován Evropským sociálním fondem, státním rozpočtem České
republiky a rozpočtem hlavního města Praha.**

Výukový text

Kokain – charakteristika

Autori: Pavel Krmenčík a Jaroslav Šejvl

Centrum adiktologie

Obsah

Způsob použití	3
Absorpce a distribuce	4
Eliminace (metabolismus a exkrece)	5
Farmakodynamika	6
Použitá literatura	9

Způsob použití

Kokain je zneužíván ve dvou formách: kokain hydrochlorid a volná báze kokainu vzniklá zahřáním kokainu s jedlou sodou a vodou známá pod názvem „crack“. Hydrochlorid kokainu je nejčastěji aplikován nazálně (šňupání), intravenózně, perorálně či bukálně (žvýkání, natírání na sliznici úst), naproti tomu báze kokainu se užívá inhalačně (kouření), protože na rozdíl od hydrochloridu je termostabilní (Hynie S., 1995; Vorel F. et al., 1999; Ševela et al., 2002).

Obvyklá účinná dávka kokainu činí 30-200 mg, minimální smrtelná dávka je 1,2 g, ovšem při přecitlivělosti může být i méně než 30 mg. Při vzniku tolerance může být aplikováno až 5 g denně (Vorel F. et al., 1999).

Absorpce a distribuce

Při intravenózní či inhalační aplikaci se nástup účinku dostavuje v řádu sekund a účinek trvá v rozmezí 10-30 min. Naproti tomu počátek působení po nazální či bukální aplikaci nastává do 10 minut a účinek trvá déle než u inhalační a intravenózní aplikace. Kokain proniká těmito sliznicemi dobře, ale zároveň působí vazokonstrikčně, takže tím zároveň zpomaluje další absorpci. V případě orální aplikace nastupuje účinek kokainu do 30 minut, vrcholu dosahuje asi po 60 minutách a poté postupně klesá nejméně 3 hodiny (Vorel F. et al., 1999; Ševela et al., 2002).

Jelikož se během chronického užívání vyvíjí tolerance, nekorelují jednoduchým způsobem aktuální plazmatická hladina kokainu a farmakologická odezva. Stimulační a euforické efekty dosahují vrcholu ještě před dosažením maximálních plazmatických koncentrací, přičemž toto je opět závislé na způsobu a rychlosti aplikace drogy. Psychotropní účinky trvají průměrně 1-2 hodiny po jednorázové dávce, u dávek inhalačních je interval působení kratší (Vorel F. et al., 1999).

Eliminace (metabolismus a exkrece)

Kokain (**benzoylekgoninmethylester**) je v organismu rychle deaktivován hydrolýzou na dva hlavní metabolity. Z 30-50 % je rychle hydrolyzován jaterní a plazmatickou esterázou na **metylester ekgoninu** a asi ze 40 % je neenzymaticky hydrolyzován za vzniku **benzoylekgoninu**. Biologický poločas kokainu je 30-90 minut, přičemž, jak již bylo uvedeno, závisí na způsobu aplikace a velikosti dávky. Poločas benzoylekgoninu je 5-8 hodin a methylesteru ekgoninu 3-6 hodin (Ševela et al., 2002; Vorel F. et al., 1999).

Mimo to vzniká v játrech minoritní metabolit norkokain, který je jako jediný metabolit kokainu aktivní. Při souběžné konzumaci kokainu s alkoholem vzniká rovněž farmakologicky aktivní metabolit **kokaetylen**. Kokaetylen potencuje psychomotorickou stimulaci a působí depresivně na srdce, takže zvyšuje riziko náhlé smrti (Mark M. K., 2003; Vorel F. et al., 1999; Ševela et al., 2002).

Kokain a jeho metabolity jsou vylučovány močí, přičemž 1-9 % odchází z organismu v nezměněné formě, 35-53 % odchází jako benzoylekgonin, 32-49 % jako ekgonin methylester. Po jednorázové dávce je kokain detekovatelný v moči pouze 3-6 hodin, kdežto oba metabolity 24-60 hodin (u chronických toxikomanů až 5 dní). V testech na drogy se obvykle využívá detekce benzoylekgoninu (Vorel F. et al., 1999; Ševela et al., 2002).

Farmakodynamika

Kokain má účinky lokálně anestetické a sympatomimetické. Lokálně anestetický účinek kokainu je dán omezením vstupu sodíku do nervových buněk a tím zastavení vedení informace o bolesti. Tento účinek však byl využíván spíše historicky, dnes existuje mezi lokálními anestetiky řada vhodnějších polosyntetických alternativ (Lullmann et al., 2002).

Hlavní účinky, kvůli kterým bývá kokain zneužíván, jsou účinky centrálně stimulační, které jsou způsobeny interferencí kokainu se zpětným příjmem neuromediátorů v synapsích adrenergních, dopaminergních a serotonergních neuronů (Hynie S., 1995; Mark M. K., 2003).

V centrálním nervovém systému kokain usnadňuje uvolňování noradrenalinu a excitačních aminokyselin a blokuje zpětné vychytávání dopaminu a serotoninu. Na periférii pak ovlivňuje především adrenergní¹ neurony. Kokain je takzvané nepřímé sympatomimetikum², jelikož blokuje zpětný příjem katecholaminů (adrenalin, noradrenalin i dopamin) do presynaptických nervových

1 neurony využívající v přenosu vzruchů jako neurotransmitery adrenalin a noradrenalin

2 jelikož zde nepůsobí přes konkrétní receptor (přímá sympatomimetika působí přímo na receptory),

zakončení. V nervové synapsi pak zůstává více katecholaminů a tím se zvyšuje sympatomimetický efekt. Synaptické nahromadění katecholaminů má za následek jeho zvýšené odbourávání zvýšením aktivity enzymu COMT³, což následně vede k jejich nedostatku (Hynie S., 1995; Ševela et al., 2002; Lullmann et al., 2002).

Právě uvedené změny v synaptické koncentraci neurotransmiterů po podání kokainu souvisí s počáteční euforií a s následovanou nespavostí, únavou, depresí, ztrátou apetitu, agresivitou a psychózami – zejména po vyšších dávkách (Hynie S., 1995).

Příznaky akutního působení prakticky odpovídají podráždění sympatiku, jedná se zejména o mydriázu (rozšířené zornice), tachykardii (zvýšená frekvence pulzu), hypertenzi, a také jsou samozřejmě přítomny účinky centrální jako euforie, neklid a nespavost (Ševela et al., 2002; Vorel F. et al., 1999).

Velké dávky kokainu mohou způsobit letální intoxikaci. Smrt může nastat ochrnutím dýchacího systému nebo následkem srdeční arytmie („kokainový šok“). Jednou z hlavních příčin smrti po podání kokainu ovšem bývá hypertermie (přehřátí organismu), která je podmíněna řadou faktorů, mezi něž patří fyzická aktivita, enormní vazokonstrikce (snížení možnosti výdeje tepla) či dopaminem zprostředkovaná porucha termoregulace (Vorel F. et al., 1999; Ševela et al., 2002).

Při chronickém působení dochází ke změnám osobnosti, halucinacím, podrážděnosti, stihomanu a agresivitě. Z jiných medicínských komplikací dlouhodobého abúzu je třeba zmínit možnost vzniku hypertenze, hypertrofie levé komory srdeční, poruchy srdeční kinetiky dané recidivujícími ischemiemi. Po šňupání kokainu dochází vlivem místní vazokonstrikce k atrofii sliznice, ztrátě čichu, nekróze

3 enzym katechol-O-methyl transferáza, který katecholaminy odbourává

nosní přepážky až její perforaci (Ševela et al., 2002; Vorel F. et al., 1999; Hynie S., 1995).

Kokain vede k silné psychické závislosti pro silné psychostimulační a euforizující účinky; někdy se mohou vyvinout i halucinace. Symptomy vyvolané odnětím látky jsou způsobené adaptacemi v CNS a dysfunkcemi některých nervových synapsí, které jsou navozeny dlouhodobým podáváním kokainu (Hynie S., 1995).

Velmi nepříznivé je také působení kokainu na plod těhotných žen, popsány byly poruchy růstu plodu, malformace plodu, předčasné porody, častější potraty, aj. (Hynie S., 1995; Ševela et al., 2002).

Použitá literatura

AIHW (Australian Institute of Health and Welfare). (2008). 2007 National Drug Strategy Household Survey: detailed findings. Drug statistics series no. 22. Canberra: AIHW. ISBN 978-1-74024-870-9.

Baboian, D. (1974). *Vstupenka do pekla*. Praha: Orbis.

Csémy L., Lejčková P., Sadílek P., Sovinová H. (2006). *Evropská školní studie o alkoholu a jiných drogách (ESPAD). Výsledky průzkumu v České republice v roce 2003*. Praha: Úřad vlády České republiky. ISBN 80-86734-94-3.

Davenport – Hines, R. (2004). *Honba za zapomněním – světové dějiny narkotik (1500 – 2000)*. Praha: BB/Art.

Delpirou, A. et Labrousse, A. (1993). *Koka, kokain, koks*. Bratislava: Bradlo.

Doyle, A. C. (1971). *Příběhy Sherlocka Holmese*. Praha: Máj.

Doyle, A. C. (1972). *Vzpomínky na Sherlocka Holmese*. Praha: Máj.

Doyle, A. C. (1975). *Poslední poklona Sherlocka Holmese*. Praha: Máj.

EMCDDA (Evropské monitorovací centrum pro drogy a drogovou závislost); 2009. Výroční zpráva za rok 2009: Stav drogové problematiky v Evropě. Lucemburk: Úřad pro publikace Evropské unie. ISBN 978-92-9168-379-6.

- Janík, A. et Dušek, K. (1990). *Drogy a společnost*. Praha: Avicenum.
- Kalina, K. et al. (2003). *Drogy a drogové závislosti 1 – Mezioborový přístup*. Praha: Úřad vlády ČR.
- Klan, Z. (1947). *Omamné drogy*. Praha: Orbis.
- Kubů P., Škařupová K., Csémy L. (2006). *Tanec a drogy 2000 a 2003*. Praha: Úřad vlády České republiky. ISBN 80-86734-77-3.
- Mann, J. (1996). *Jedy, drogy, léky*. Praha: Academia.
- Mravčík V., Pešek R., Škařupová K., Orlíková B., Škrdlantová E., Šťastná L., Kiššová L., Běláčková V., Gajdošíková H., Vopravil J. (2009). *Výroční zpráva o stavu ve věcech drog v České republice v roce 2008*. Praha: Úřad vlády České republiky. ISBN 978-80-87041-99-4.
- NIDA (National Institute on Drug Abuse); 2010. NIDA InfoFacts: High School and Youth Trends [online]. [cit. 2010-2-14]. Dostupné z: <<http://www.drugabuse.gov/infofacts/HSYouthtrends.html>>
- Polanecký V., Šmídová O., Studničková B., Šafr J., Šejda J., Hustopecký J. (2001). *Mládež a návykové látky v České republice - trendy let 1994 - 1997 - 2000*. Praha: Hygienická stanice hlavního města Prahy.
- SAMHSA (Substance Abuse and Mental Health Services Administration). (2009). *Results from the 2008 National Survey on Drug Use and Health: National Findings*. Rockville, MD: Office of Applied Studies.
- Shapiro, H. (2005). *Drogy – obrazový průvodce*. Praha: Svojtka.
- Streatfield, D. (2003). *Kokain*. Praha: BB/Art.
- Szasz, T. (1997). *Drogy: historie jedné hysterie*. Olomouc: Votobia.

Trojáčková A. (2010a). Žádosti o léčbu v souvislosti s užíváním kokainu a cracku – analýza dat z výročních zpráv o uživatelích návykových látek Hygienické stanice hlavního města Prahy z let 1995-2008. Nепublikováno.

Trojáčková A. (2010b). Pacienti registrovaní na ambulantních AT pracovištích – analýza dat Ústavu zdravotnických informací a statistiky České republiky v publikacích Psychiatrická péče z let 2000-2007. Nепublikováno.

Tyler, A. (2000). *Drogy v ulicích. Mýty – fakta – rady*. Praha: Ivo Železný.

UNODC (United Nations Office on Drugs and Crime). (2009). World Drug Report 2009. Vienna: UNODC. ISBN 978-92-1-148240-9

Urban, E. (1973). *Toxikománie*. Praha: Avicenum.

Ústav zdravotnických informací a statistiky České republiky. (2005). Celopopulační studie o zdravotním stavu a životním stylu obyvatel v České republice – Rozsah užívání návykových látek v dospělé populaci. Praha: ÚZIS ČR. Nепublikované výsledky studie.

Valíček, P., Arcimovičová, J., Horák, V et. Vaněček, M. (2000). *Rostlinné omamné drogy*. Praha: Start.

Vaněček, M. et Nožina, M. (2009). *Mandragora, morfin, kokain – Drogový problém v českých zemích v dobách habsburské monarchie a v předválečném Československu*. Praha: KLP.

Vavřínková, B. et Binder, T (2006). *Návykové látky v těhotenství*. Praha: Triton.

Vondráček, V. (1935). *Farmakologie duše*. Praha: Nakladatelství mladé generace při Ú. J. ČS. L.

Vorel, F. et al. (1999). *Soudní lékařství*. Praha: Grada Publishing.

Hynie, S. (1995). Speciální farmakologie Díl 3. Praha: Univerzita Karlova.

Mark, M. K. (2003). Disorders associated with cocaine use: myths and truths; *Pharmacology & Therapeutics* 97 (2003), s. 181–222.

Tracey, L., Kurtzman, B. A., Kimberly, N. O. et al. (2001). Abuse by Adolescents; *Journal of adolescent health* 2001; 28, s. 170–180.

Lullmann, L., Mohr, K. et Wehling M. (2002). Farmakologie a toxikologie. Praha: Grada Publishing.

Ševela, K., Ševčík P., Kraus R. et al. (2002). Akutní intoxikace v intenzivní medicíně; Praha: Grada Publishing.

Keith, E. (2003). Válka bez konce aneb Krátký smutný příběh o dlouhé válce proti drogám. Praha: Volvox Globator.

http://cs.wikisource.org/wiki/Versailleská_smlouva#.C4.8Cl.C3.A1nek_295

<http://www.rect.muni.cz/drogy/POKUS/casti/kontr.htm>

http://www.psp.cz/eknih/1920ns/ps/tisky/T3997_00.htm

<http://www.biotox.cz/enpsyro/pj3rerc.html>

http://www.ped.muni.cz/wsedu/zdroj_mat/stud_mat/drogy/BM/pr ev.htm

<http://www.bbc.co.uk/czech/korespondent/13.shtml> (ze dne 9. 9. 2000).