

**Вещества с**  
**анальгетической**  
**активностью**  
Часть I

**Анальгетики** — вещества, избирательно угнетающие болевую чувствительность, не влияя на другие виды чувствительности.

Основное показание - устранение боли.

**Классификация:**

1. Вещества центрального действия:
  - а) опиоидные (наркотические) анальгетики
  - б) неопиоидные средства центрального действия
  - в) препараты смешанного действия
2. Нестероидные противовоспалительные средства (ненаркотические анальгетики, НПВС)

# Опиоидные (наркотические) анальгетики

Опий (от греч. *opos* - сок) -  
высохший на воздухе  
млечный сок мака  
снотворного  
(*Papaver somniferum*).

В состав опия входит более  
20 алкалоидов: морфин,  
кодеин, папаверин и т.д.



# Эффекты стимуляции опиоидных рецепторов

Эффекты	$\mu$ -рецепторы	$\kappa$ -рецепторы	$\delta$ -рецепторы
Анальгезия			
супраспинальная	+++	-	-
спинальная	++	+	++
Седативное действие	++	++	-
Эйфория	+++	-	-
Дисфория	-	+++	-
Миоз	++	+	-
Угнетение дыхания	+++	-	++
Снижение моторики желудочно-кишечного тракта	++	+	++
Лекарственная зависимость	+++	+	-

## Классификация опиоидных (наркотических) анальгетиков:

1. Полные агонисты опиоидных рецепторов

а) природные

**Морфин, Кодеин, Омнопон**

б) синтетические

**Фентанил, Тримеперидин (Промедол)**

2. Частичные агонисты опиоидных рецепторов

**Бупренорфин**

3. Агонисты-антагонисты опиоидных рецепторов

**Буторфанол, Налбуфин, Пентазоцин**

# Полные агонисты опиоидных рецепторов

**Морфин** - высокоэффективный анальгетик. Низкая биодоступность (24%); мало липофилен □ плохо проникает через ГЭБ; длительность действия – 4-5 ч.

## Фармакологические эффекты:

### 1) Анальгезия

Механизм анальгетического действия:

1. Нарушение проведения болевых импульсов по афферентным путям ЦНС;
2. Усиление нисходящих тормозных влияний на проведение болевых импульсов по афферентным путям ЦНС;
3. Изменение эмоционального отношения к боли

- 2) Эйфория
- 3) Седативное действие
- 4) Миоз
- 5) Брадикардия
- 6) Угнетение дыхания
- 7) Противокашлевое действие
- 8) Тошнота, рвота
- 9) Снижение моторики ЖКТ
- 10) Влияние на мочевыводящие пути
- 11) Гистаминогенное действие
- 12) Влияние на продукцию гормонов

**Показания:** травмы, ожоги, инфаркт миокарда, злокачественные опухоли , при подготовке больных к хирургическим операциям и в послеоперационном периоде, острый отек легких.

**Побочные эффекты:** миоз, эйфория, головокружение, головная боль, сухость во рту, сонливость, брадикардия, урежение дыхания, тошнота, рвота, констипация, спазм гладких мышц мочевыводящих и желчевыводящих путей, задержка мочеиспускания, гистаминогенное действие, артериальная гипотензия, коллапс, лекарственная зависимость (морфинизм), абстиненция, привыкание, толерантность.



## Острое отравление морфином

Характеризуется развитием коматозного состояния, поверхностным редким дыханием, резким сужением зрачков, брадикардией, снижением артериального давления.

Лечение: Налоксон, промывание желудка 0,05% раствором калия перманганата, активированный уголь, солевое слабительное, форсированный диурез, ИВЛ.

Налтрексон – для лечения наркомании.

**Оmnopон** - смесь 5 алкалоидов опия (морфин, кодеин, папаверин, нарцеин, тебаин). Обладает спазмолитическим действием □ при болях, связанных со спазмами гладких мышц.

**Кодеин** - по анальгетическому действию в 10 раз менее эффективен, чем морфин. В качестве обезболивающего применяют обычно в сочетании с ненаркотическими анальгетиками (+парацетамол = **Ацетаминофен**).

**Используют как противокашлевое средство.**

## Тримеперидин (Промедол)

Менее эффективен ; слабее действует на дыхательный центр и вагус. Обладает слабыми спазмолитическими свойствами. Стимулирует сокращения миометрия.

Можно использовать для обезболивания родов!!!

## Фентанил

В 100 раз эффективнее морфина.

Применяют в сочетании с Дроперидолом (Таламонал) для нейролептанальгезии .

# Частичные агонисты опиоидных рецепторов

## Бупренорфин

Частичный агонист мю-рецепторов.

Уступает морфину по анальгетической активности, меньше угнетает дыхательный центр, менее опасен в отношении лекарственной зависимости.

Может вызывать синдром абстиненции у морфинистов.

# Агонисты-антагонисты опиоидных рецепторов

## Бупрофанол, Налбуфин, Пентазоцин

Блокируют мю-рецепторы □ менее опасны в отношении лекарственной зависимости, меньше угнетают дыхание.

Стимулируют каппа-рецепторы □ дисфория, повышение АД.

# Неопиоидные средства центрального действия

Закись азота

Клонидин (Клофелин)

Парацетамол (Панадол, Ацетаминофен)

Ингибирует циклооксигеназу (ЦОГ) в ЦНС.

Высшая суточная доза - 4 г.

При передозировке □ некроз печени

Для уменьшения токсического действия  
применяют ацетилцистеин, метионин.

# Препараты смешанного действия

## Трамадол (Трамал)

стимулирует мю-рецепторы; нарушает обратный нейрональный захват норадреналина и серотонина □  
усиливает нисходящие тормозные влияния на проведение болевых импульсов.

Мало влияет на дыхательный центр.

**Показания:** злокачественные опухоли, инфаркт миокарда, травмы.

**Побочные эффекты:** тошнота, рвота, головокружение, сухость во рту, лекарственная зависимость.