

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. *oros* - 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	μ -рецепторы	κ -рецепторы	δ -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.