

# NEOPIOIDNÍ ANALGETIKA

## Poznámky ke cvičením z Farmakologie II

PharmDr. Jan Juřica, Ph.D.,  
Mgr. Barbora Ondráčková,  
MUDr. Jana Nováková, Ph.D.,  
PharmDr. Jana Kučerová

Tento studijní materiál slouží výhradně pro výuku praktických cvičení předmětu Farmakologie II studentů VL a ZL lékařské fakulty MU. Představuje stručné podklady pro přípravu k probírané látce a osnovu pro záznam vlastních poznámek ve výuce. Vysvětlující doplnění, aktuální údaje a prohloubení obsahu jsou předmětem jednotlivých cvičení.

---

---

---

---

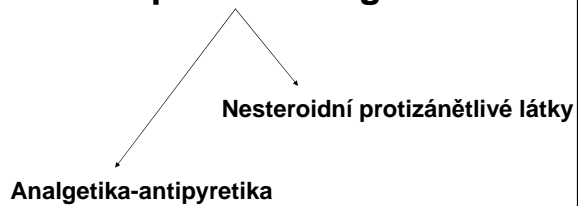
---

---

---

---

## Neopioidní analgetika



---

---

---

---

---

---

---

---

## Zánět

### HLAVNÍ MECHANISMUS ÚČINKU NSPZL:

↓  
inhibice cyklooxygenázy  
↓

---

---

---

---

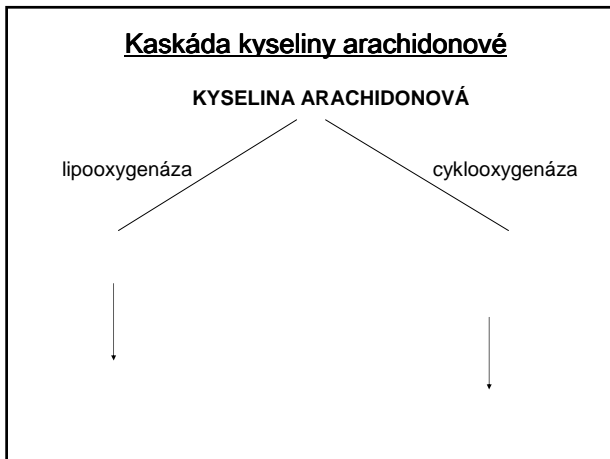
---

---

---

---

### Kaskáda kyseliny arachidonové



---

---

---

---

---

---

---

---

### Účinky mediátorů zánětu

- dilatace kapilár
- zvýšení permeability cévní stěny
- infiltrace tkání leukocyty a fagocyty, zvýšení imunitní odpovědi
- tkáňová degenerace, fibróza

---

---

---

---

---

---

---

---

### Mechanismus účinku

- společný hlavní mechanismus účinku – více či méně (případně selektivně) inhibují vznik eikosanoidů
- NSPZL se liší mírou inhibice COX1/COX2 a následně tendencí způsobovat typické NÚ (vředová choroba, krvácivost)

---

---

---

---

---

---

---

---

## Izoformy cyklooxygenázy

---

---

---

---

---

---

---

---

## NSPZL

Podle selektivity při inhibici COX:

---

---

---

---

---

---

---

---

## NSPZL – hlavní účinky

### INHIBICE CYKLOOXYGENÁZY

- protizánětlivý úč.
- analgetický úč.
- antipyretický úč.:

---

---

---

---

---

---

---

---

**Analgetika-antipyretika + NSPZL  
indikace**

---

---

---

---

---

---

---

---

**Nežádoucí účinky**

*hl.v důsledku inhibice COX-1*

**GIT**

**Renální systém**

**Krvácení**

**Respirační systém**

**Alergie**

---

---

---

---

---

---

---

---

**Rozdělení**

1. Deriváty kyseliny salicylové
2. Deriváty anilinu
3. Pyrazolony
4. Deriváty kyseliny propionové
5. Deriváty kyseliny octové
6. Fenamáty
7. Oxikamy
8. Preferenční inhibitory COX-2

---

---

---

---

---

---

---

---

## 1. Salicyláty

### ÚČINKY

- Analgetické
- Antiflogistické
- Antipyretické
- Antirevmatické
- Antitrombotické
- Profylaxe infarktu myokardu a CMP (primární i sekundární)
- Inhibice destičkových funkcí (antiagregační)

---

---

---

---

---

---

---

---

### Deriváty kyseliny salicylové - zástupci

ASA (k. acetylsalicylová)

---

---

---

---

---

---

---

---

### Další salicyláty

---

---

---

---

---

---

---

---

## NÚ

- **Salicylismus (↑d.)** - poruchy sluchu, tinnitus, hluchota, vertigo
- **Alergie** - bronchospasmus, svědění, vyrážka, anafylaktický šok, bronchokonstrikce (↑LT)
- **GIT** - nauzea, dyspepsie, krvácení, vředová choroba
- **Nefropatie** - glomerulární filtrace je reverzibilně snížena
- **Hepatopatie**

### CAVE

- Gravidita - dle trimestru
- Dětská populace - Reyův syndrom
- Starší populace - senzitivní k NÚ salicylátů

---

---

---

---

---

---

---

---

## 2. Deriváty anilinu

účinky:

analgetické + antipyretické, slabé protizánětlivé,  
neovlivňují srážlivost

**Fenacetin**

**paracetamol**

---

---

---

---

---

---

---

---

## paracetamol

analgetický+antipyretický úč. – srovnatelný s ASA

antiflogistický NE!

- *lepší snášenlivost ze strany GIT, neovlivňuje krevní srážlivost*
- *jeho metabolit je hepatotoxický*

---

---

---

---

---

---

---

---

### 3. Pyrazolony

Analgetický, antiflogistický, antipyretický, urikosurický účinek

NÚ: gastroduodenální vředy, poruchy krvevorbny (fenylbutazon)

**aminofenazon**

**propyfenazon**

**metamizol**

---

---

---

---

---

---

---

---

### 4. Deriváty kyseliny propionové

- dobrý analgetický a antipyretický úč., slabší protizánětlivý úč.

- nejlépe tolerované NSPZL, ↓ NÚ  
**ibuprofen**

**Další:**

---

---

---

---

---

---

---

---

### 5. Deriváty kyseliny octové

**diklofenak**

- středně silný protizánětlivý účinek, mírný antipyretický úč.
- dobrá tolerance

**NÚ:**

**indometacin** 40x účinnější než ASA

↑NÚ:

Indikace:

---

---

---

---

---

---

---

---

## 6. Fenamáty

více nežádoucích účinků → nehodí se k chronickému podávání!

**Kyselina mefenamová**

**Kyselina tolfenamová**

---

---

---

---

---

---

---

---

## 7. Oxikamy

delší  $t_{1/2}$  — možno podávat 1x denně

silný protizánětlivý, analgetický a antipyretický účinek, lepší tolerance než salicyláty a indometacin

**piroxikam**

**meloxikam**

---

---

---

---

---

---

---

---

## 8. Preferenční inhibitory COX-2 alkalony, koxiby, sulfonanilidy

vyšší inhibice COX-2 ( selektivita účinku)

**nabumeton**

**nimesulid**

---

---

---

---

---

---

---

---



## Koxiby

- 100 x specifitější ke COX-2
  - nižší NÚ v GIT, neovlivňují agregaci trombocytů ani průtok krve ledvinami
- vzestup tromboembolických KV a CV příhod (IM, CMP) po delším podávání
  - rofe- i valdecoxib již staženy
- drahé – preskripční omezení (revmatolog)
- pro problematické pacienty s revmatoidní artritidou
- neinhibují destičkové funkce

---

---

---

---

---

---

---

---

## Koxiby - zástupci

- celecoxib
- parecoxib
- rofekoxib
  - zvyšuje KVS riziko
  - stažen z trhu

---

---

---

---

---

---

---

---

## Výběr vhodného neopioid. analgetika

- poměr účinnost/riziko
- antipyretický účinek?
- antiflogistický účinek?
- dítě do 12 let?
- gravidní?
- dysmenorhea
- chronické podání
- degenerativní postižení kloubů
- gastroduodenální vřed

---

---

---

---

---

---

---

---

### LOKÁLNĚ POUŽÍVANÁ ANTIFLOGISTIKA

místní léčení projevů revmatismu měkkých tkání,  
lokalizované projevy zánětlivých a degenerativních  
onemocnění, poúrazové a pooperační otoky a záněty,  
periartritida

- diklofenak
- indometacin
- ibuprofen
- ketoprofen
- kyselina flufenamová
- piroxikam

---

---

---

---

---

---

---

---

### LOKÁLNĚ POUŽÍVANÁ ANTIFLOGISTIKA

- cholinsalicylát - stomatologikum



záněty, iritace, ulcerace, poranění  
a další bolestivé afekce v oblasti dutiny  
ústní a nosu, potíže při prořezávání  
zubů u kojenců a malých dětí

---

---

---

---

---

---

---

---