

**NEOPIOIDNÍ ANALGETIKA
NESTEROIDNÍ PROTIZÁNĚTLIVÁ
LÉČIVA**

**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.

nesteroidní protizánětlivé látky = NSPZL

analgetika-antipyretika



neopioidní analgetika

Neopioidní analgetika



Nesteroidní protizánětlivé látky

Analgetika-antipyretika

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)

Izofomy 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

Deriváty kyseliny salicylové
Deriváty anilinu
Pyrazolidiny
Deriváty kyseliny propionové
Deriváty kyseliny octové
Fenamáty
Oxikamy
Selektivnější inhibitory COX-2 (preferenční nebo selektivní 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. Pyrazolidinové deriváty

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 1xdenně
silný protizánětlivý, analgetický a antipyretický
účinek, lepší tolerance než salicyláty a indometacin

piroxikam

meloxicam

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

- celekoxib
- parekoxib
- 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

Řešení NÚ NSPZL

- redukce dávky nebo změna lékové formy
- kombinace s protektivními léčivými
- antiulceróza – inhibitory protonové pumpy (lansoprazol, omeprazol)
- prostaglandinové analogy (substituce)
- H₂ antihistaminika – (cimetidin ranitidin, famotidin)
- antacida
- zvážit podání selekt. COX-2 inh.

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
- piroxikam

LOKÁLNĚ POUŽÍVANÁ ANTIFLOGISTIKA

- cholinsalicylát - stomatologikum


