

ANALGETIKA – ANODYNA

MUDr. Jana Nováková, Ph.D.;
PharmDr. Jan Juřica, 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.

Farmakologické ovlivnění bolesti

Analgetika – anodyna (opioidy)

Neopioidní analgetika (analgetika – antipyretika → NSPZL)

Lokální anestetika

Celková anestetika

Adjuvantní léčba (antidepresiva, neuroleptika - antipsychotika, antiepileptika - antikonvulziva, antimigrenika, kortikoidy, bisfosfonáty, kofein...)

Analgetika

Analgetika – snižují vnímání bolesti (zvyšují práh pro vnímání bolesti) selektivně bez ovl. percepce jiných podnětů

Analgetika – anodyna (opioidy)

Neopioidní analgetika

Analgetika - anodyna

Blokují přenos signálů bolesti mezi buňkami CNS
(v míše, v mozku),
stejně jako endogenní opioidy:

Opiáty

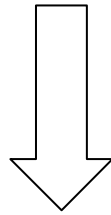
Opioidy

Opioidní receptory - μ κ δ (σ)

spojené s G-proteiny, i. adenylylcyklázy,
facilitují otevírání K^+ kanálů postsynapticky,
inhibují otevírání Ca^{2+} kanálů presynapticky

- μ
- κ
- δ
- (σ)

Opioidní receptory - μ κ δ (σ)



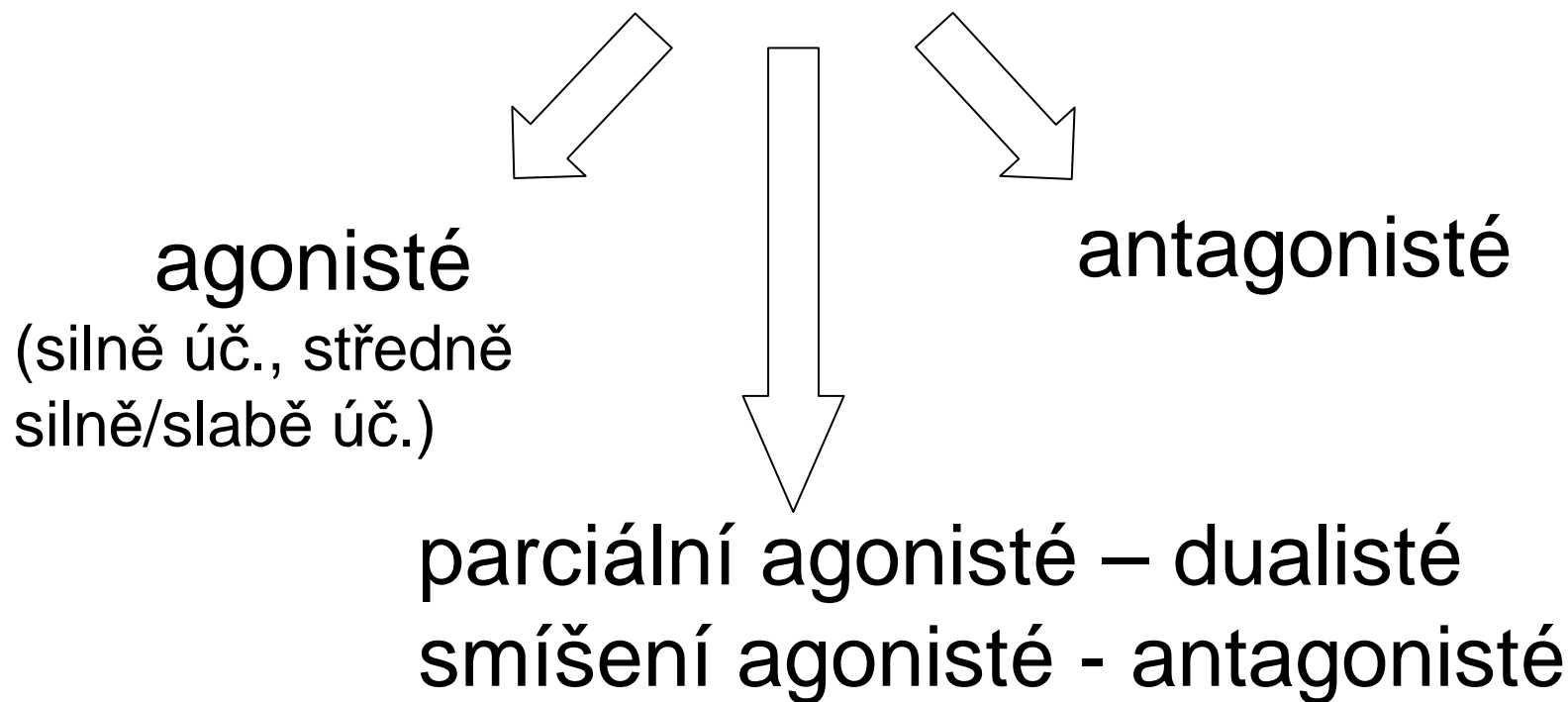
**PRO ANALGÉZII JE DŮLEŽITÁ PŘEDEVŠÍM
AKTIVACE RECEPTORŮ:**



μ - supraspinální analgesie

κ – spinální + periferní analgezie

Ovlivnění opioidních receptorů



Atypické opioidy

Farmakologické účinky analgetik - anodyn

CENTRÁLNÍ:

Farmakologické účinky analgetik - anodyn

TOLERANCE !!!

ZÁVISLOST !!!

Farmakologické účinky analgetik - anodyn

PERIFERNÍ:

Analgetika – anodyna

FARMAKOKINETIKA

ABSORPCE

DISTRIBUCE

Analgetika – anodyna

FARMAKOKINETIKA

BIOTRANSFORMACE

EXKRECE

Opioidní agonisté

selektivní μ agonismus

morfin

cca 10 % obsahu opia, spolu s kodeinem,
thebainem + ostat. fenantrenovými alkal.

silná afinita k μ receptorům

Opioidní agonisté

morfin

- viz výše uvedené účinky
- p.o. (i p.o. s postupným uvolňováním),
parent. (i.v., i.m., s.c., epidurální, intrathek.),
- p.rect. podání
- **indikace:**

Další silná opioidní analgetika

pethidin

metadon

piritramid

fentanyl, sufentanil, remifentanil,...

(heroin – diacetylmorfin)

Opioidní agonisté

Ostatní silná opioidní analgetika

fentanyl, sufentanil, remifentanil,...

piritramid

Další:

Opioidní agonisté

Středně a slabě účinní opioidní agonisté

kodein

dihydrokodein

Opioidní agonisté

Parciální agonisté + agonisté - antagonisté

nižší afinita k μ receptorům, silná afinita ke κ rcp.

nižší závislostní potenciál

nižší analgetické účinky, nižší nežádoucí účinky

Parciální agonisté,

agonisté-antagonisté

Parciální agonisté + agonisté - antagonisté

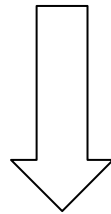
Př.: buprenorfin

Parciální agonisté,
agonisté-antagonisté

Parciální agonisté + agonisté - antagonisté

Další zástupci (použív. jako analgetika):

smíšení agonisté - antagonisté



nalbupin, pentazocin

Parciální agonisté,
agonisté-antagonisté

Atypické opioidy

tramadol

tapentadol

Atypické opioidy

Antagonisté opioidních analgetik

naloxon, naltrexon

Využití:

antagonisté

Nežádoucí účinky opioidů

- dechová deprese (útlum dýchání)
- nauzea a zvracení
- sedace, útlum kognitivních fcí
- zácpa
- **ZÁVISLOST**
- pozor u křečových stavů!
(zvýšení pohotovosti ke křečím)
- ↑ intrakran. tlaku

Intoxikace opioidními agonisty

nevolnost, zčervenání, „flush“, hučení v uších

apatie, sedace, spánek, mióza

povrchové dýchání

cyanotická, studená kůže, rychlý tep

asfyxie TRIÁDA:

Terapie

Terapie bolesti

Třístupňový analgetický žebříček WHO

