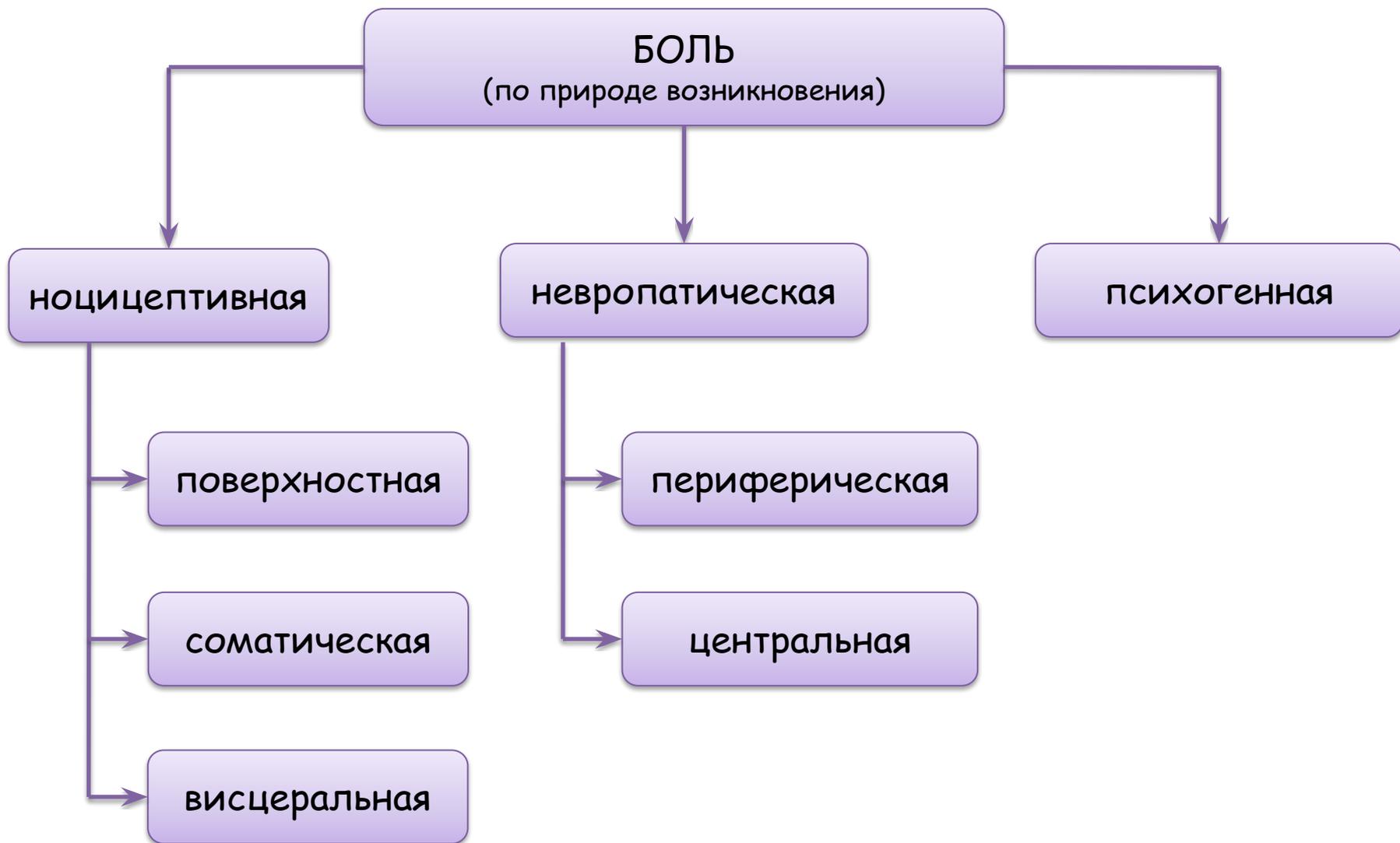


**БОЛЕУТОЛЯЮЩИЕ
(АНАЛЬГЕЗИРУЮЩИЕ)
СРЕДСТВА**

Боль - это неприятное ощущение и эмоциональное переживание, возникающие в связи с настоящей или потенциальной угрозой повреждения тканей или описываемые терминами такого повреждения

Определение и классификация боли



Основные характеристики анальгетических средств

1. Избирательно подавляют болевую чувствительность

2. Не подавляют рефлексы и не угнетают сознание

3. Не угнетают другие виды чувствительности (в отличие от МА)

Классификация болеутоляющих средств

I. Преимущественно центрального действия

Опиоидные (наркотические) анальгетики

Полные агонисты
опиоидных μ -рецепторов.

- морфин
- промедол
- фентанил

Агонисты-антагонисты и
частичные агонисты
опиоидных рецепторов

- буторфанол
- бупренорфин

Неопиоидные препараты с центральной анальгетической активностью

Ингибиторы ЦОГ в ЦНС

- ацетаминофен
(парацетамол)

Препараты из различных
фармакологических групп с
анальгетическим действием

- карбамазепин
- клофелин
- кетамин
- амитриптилин

Анальгетики со смешанным механизмом действия

- трамадол

II. Преимущественно периферического действия (ингибиторы ЦОГ)

Неизбирательные ингибиторы
ЦОГ-1 и ЦОГ-2

- диклофенак
- ибупрофен
- ацетилсалициловая к-та

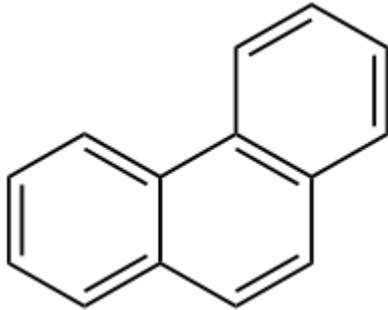
Избирательные ингибиторы
ЦОГ-2

- целекоксиб

**ОПИОИДНЫЕ
(НАРКОТИЧЕСКИЕ)
АНАЛЬГЕТИКИ**

Алкалоиды опия

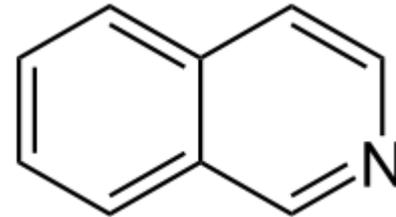
Фенантренового ряда



- морфин
- кодеин

- Действуют на ЦНС.
- Повышают тонус гладких мышц.

Изохинолинового ряда



- папаверин

- Не действуют на ЦНС.
- Снижают тонус гладких мышц.

Фармакологические эффекты морфина

Центральные

- Анальгезия

- Угнетение кашлевого центра

- Эйфория
- Угнетение дыхания
- Седативный эффект
- Снотворный эффект
- Сужение зрачка (миоз)
- Снижение выработки гонадотропных гормонов
- Повышение выработки пролактина и АДГ
- Тошнота и рвота
- Нарушение терморегуляции
- Повышение тонуса скелетных мышц и судороги
- Брадикардия, гипотензия

Периферические

- Угнетение моторики и перистальтики ЖКТ

- Повышение тонуса сфинктеров мочеточников и мочевого пузыря
- Усиление высвобождения гистамина (покраснение кожи лица, шеи, зуд, отеки, повышение тонуса бронхов, гипотензия)

Механизм анальгетического действия морфина

1. Угнетение межнейрональной передачи импульса в на уровне спинного мозга.
2. Активация нисходящего торможения (антиноцицептивной системы).
3. Угнетение передачи болевого импульса на уровне таламуса.
4. Изменение эмоционального восприятия боли.
5. Снижение чувствительности окончаний первичных афферентов ноцицептивной системы (при воспалении).

Сравнительная характеристика опиоидных анальгетиков

Препарат	Активность	Длительность действия	Угнетение дыхания	Примечание
ПРОМЕДОЛ	в 2-4 раза менее активен	3-4 часа	+	Нейротоксичен, меньше повышает тонус гладкой мускулатуры
МОРФИН		4-5 часов	++	Повышает тонус гладкой мускулатуры
ФЕНТАНИЛ	в 100-400 раз активнее	20-30 минут	+++	Повышает тонус скелетных мышц

Сравнительная характеристика опиоидных анальгетиков

Препарат	Активность	Длительность действия	Угнетение дыхания	Лекарственная зависимость
МОРФИН		4-5 часов	+++	+++
БУТОРФАНОЛ	в 3-5 раз активнее	3-5 часов	+	+
БУТРЕНОРФИН	в 20-60 раз активнее	5-9 часов	+	+

Показания к применению опиоидных анальгетиков

1. Выраженный болевой синдром при травмах, инфаркте миокарда, в послеоперационный период, при злокачественных новообразованиях.

2. Премедикация перед общим наркозом.

3. Нейролептанальгезия.

ФЕНТАНИЛ
(опиоидный анальгетик)
+
ДРОПЕРИДОЛ
(типичный нейролептик)



- Усиление анальгетического эффекта
- Усиление седативного действия
- Эмоциональная индифферентность
- Предупреждение вегетативных реакций

НЕОПИОИДНЫЕ (НЕНАРКОТИЧЕСКИЕ) АНАЛЬГЕТИКИ

(преимущественно центрального действия)

Ацетаминофен (парацетамол)

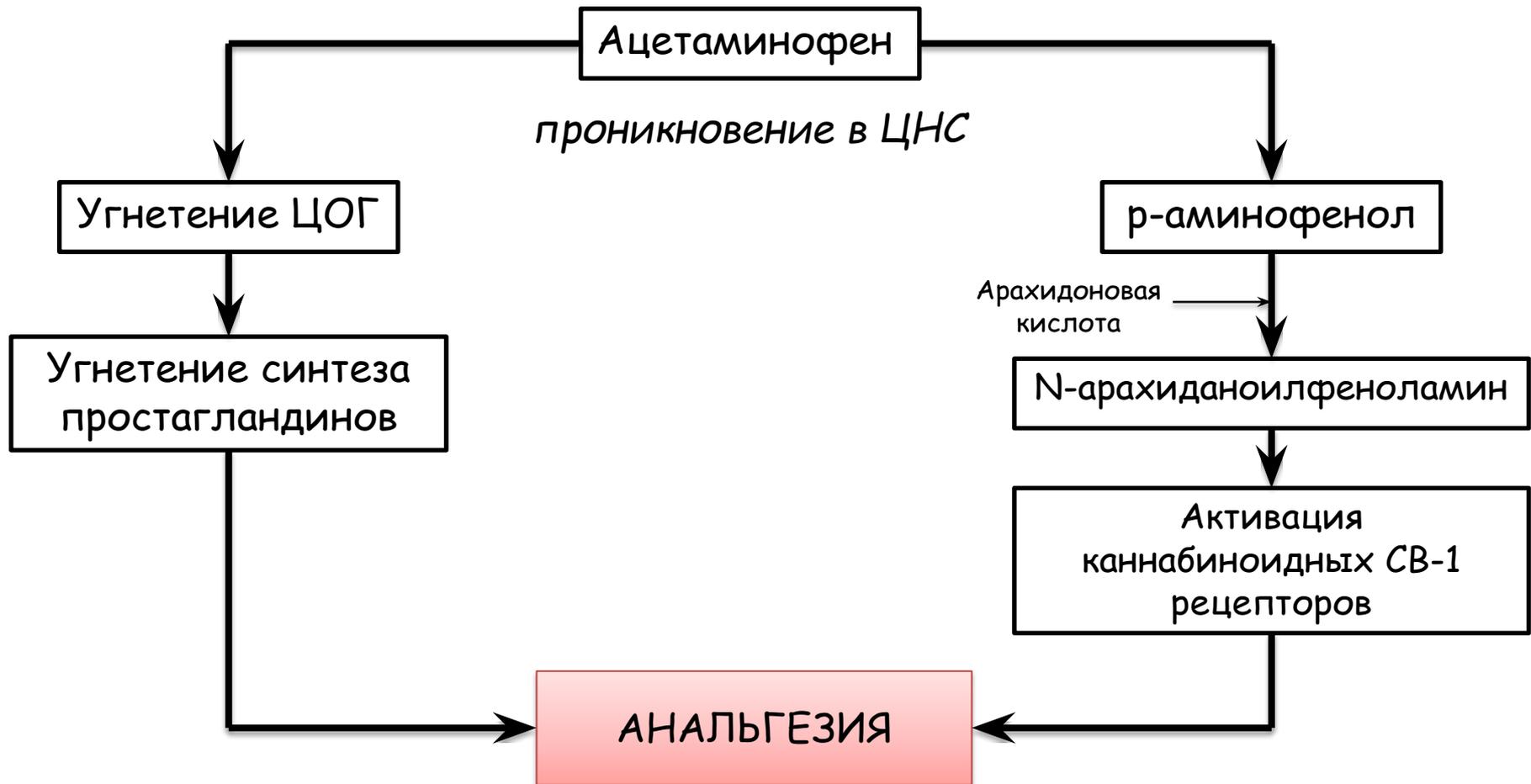
Фармакологические эффекты:

- Жаропонижающий
- Анальгетический (центральный)

Ацетаминофен (парацетамол)

Фармакологические эффекты:

- Жаропонижающий
- Анальгетический (центральный)



**Препараты других
фармакологических групп с
анальгетическим компонентом
действия**

1. Антikonвульсанты

- карбамазепин - дифенин
- ламотриджин - габапентин

Блокируют потенциалзависимые Na (карбамазепин) и Ca (габапентин) каналы, подавляют передачу в спинном мозге. Применяются при невралгиях (невралгии тройничного нерва, постгерпетической и диабетической невралгиях).

2. Антидепрессанты

- amitриптилин
- имипрамин

Нарушают обратный нейрональный захват моноаминов в антиноцицептивной системе, усиливая нисходящее торможение. Применяются при невралгиях и хронических болях.

3. Средства для наркоза

- кетамин
- закись азота

Кетамин - средство для внутривенного наркоза, антагонист глутаматных NMDA-рецепторов. Азота закись - средство для ингаляционного наркоза, в субнаркологических дозах вызывает выраженную аналгезию.

4. α_2 -адреномиметики

- клонидин (клофелин)

Обладает выраженным анальгетическим действием, применяется для устранения боли при инфаркте миокарда, в послеоперационный период, онкологических болей. Обладает гипотензивным и седативным эффектами.

5. Антигистаминные средства

- дифенгидрамин (димедрол)

Блокатор гистаминовых H_1 -рецепторов. Обладает умеренной анальгетической активностью, противоаллергическим эффектом, седативным и снотворным действием.

ПРЕПАРАТЫ СО СМЕШАННЫМ ТИПОМ ДЕЙСТВИЯ

(опиоидный+неопиоидный)

Трамадол

- **Центральный анальгетик с опиоидным и неопиоидным механизмами действия**
 - **агонист опиоидных μ -рецепторов**
 - **ингибитор нейронального захвата моноаминов в нисходящих тормозных путях на уровне спинного мозга**
- **При сильной острой боли уступает морфину по эффективности**
- **Мало влияет на дыхание и гладкие мышцы ЖКТ**
- **Имеет низкий наркогенный потенциал**

**ПРЕПАРАТЫ
ПРЕИМУЩЕСТВЕННО
ПЕРИФЕРИЧЕСКОГО
ДЕЙСТВИЯ**

Нестероидные противовоспалительные средства

Нестероидные противовоспалительные средства

1. Неизбирательные ингибиторы ЦОГ-1 и ЦОГ-2

ЦОГ1 > ЦОГ2

Пр-ные салициловой к-ты
- ацетилсалициловая
кислота (аспирин)

ЦОГ1 = ЦОГ2

Пр-ные фенилуксусной к-ты
- диклофенак
- кеторолак
Пр-ные арилпропионовой к-ты
- ибупрофен
- кетопрофен
- напроксен
Пр-ные оксикама
- пироксикам
Пр-ные индолуксусной к-ты
- индометацин
Пр-ные пиразолона
- метамизол натрия

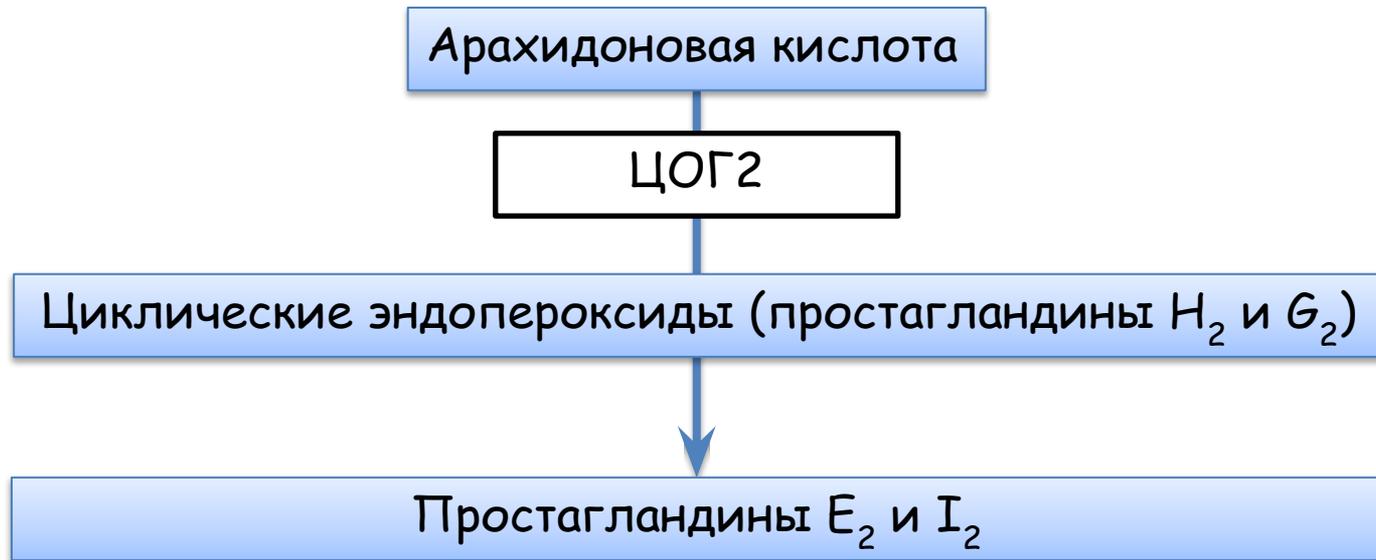
ЦОГ1 < ЦОГ2

Пр-ные оксикама
- мелоксикам
Пр-ные сульфонамида
- нимесулид

2. Избирательные ингибиторы ЦОГ-2

«Коксибы»
- целекоксиб

Механизм действия НПВС



Механизм действия НПВС

Арахидоновая кислота

НПВС

ЦОГ2

Циклические эндопероксиды (простагландины H_2 и G_2)

Простагландины E_2 и I_2

Повышение чувствительности ноцицепторов (к брадикинину и др. стимулам)

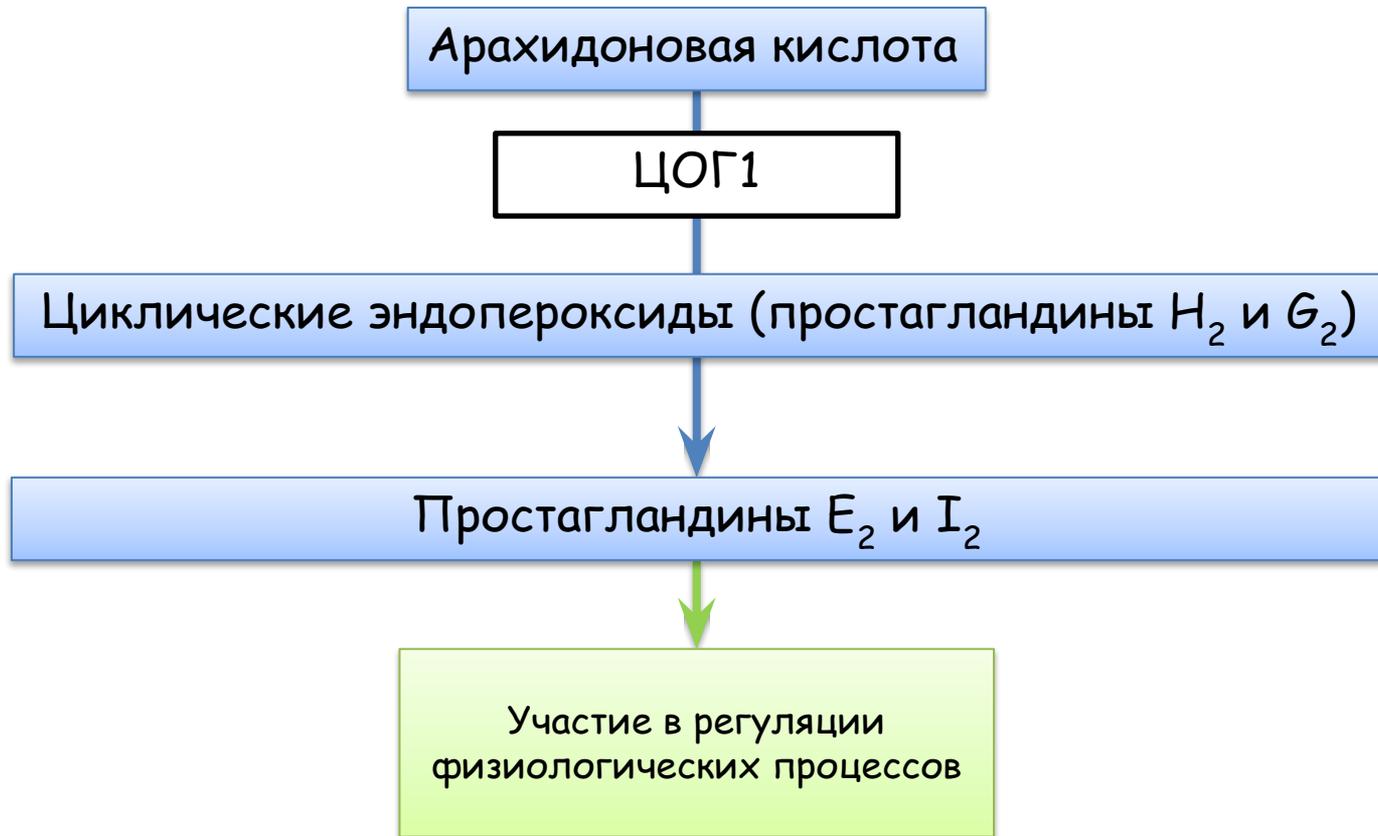
Расширение сосудов и увеличение проницаемости сосудистой стенки

Проведение импульса в ЦНС

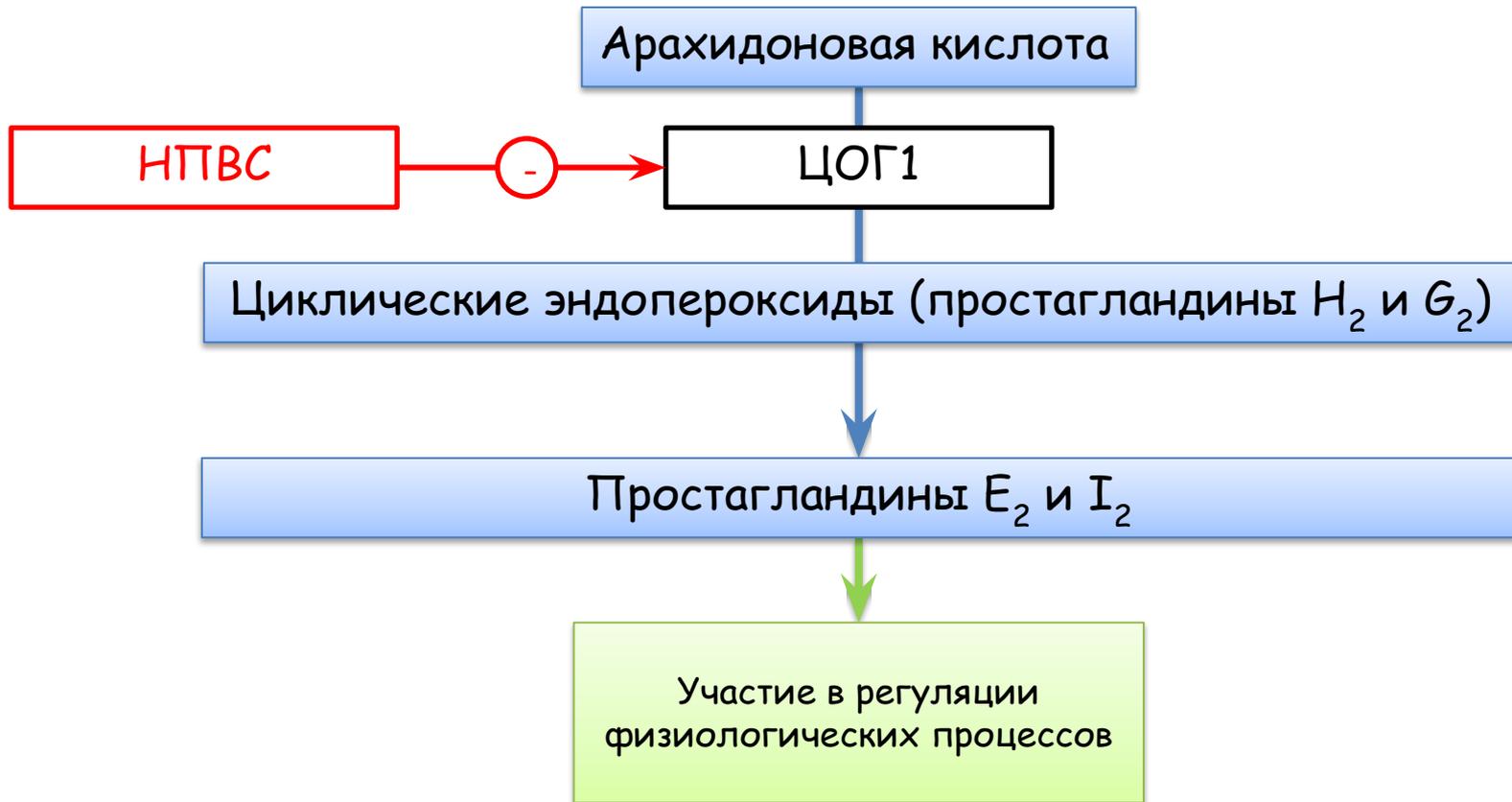
Отек и механическое сдавление ноцицепторов

ГИПЕРАЛГЕЗИЯ

Механизм действия НПВС



Механизм действия НПВС



Побочные эффекты:

- Ульцерогенное действие
- Гастропатии
- «Аспириновая астма»
- Аллергические реакции