

Казахстанско-Российский медицинский
университет

Тема: **«Неопиоидные препараты
центрального действия с
анальгетической активностью»**

Выполнил: Сейсенбаев Т.
2 курс, Гр. 208 «А» ОМ.

Алматы 2016

Содержание:

- 1. Введение
- 2. Классификация и механизм действия
- 3. Фармакологические свойства
- 4. Фармакокинетические свойства
- 5. Показания к применению.
- 6. Побочные эффекты
- 7. Противопоказания и предостережения
- 8. Взаимодействия с другими лекарственными средствами
- 9. Использованная литература

- **Боль сопровождает большинство заболеваний. Проблема обезболивания была и есть одна из основных, решение которой способно значительно улучшить качество жизни пациента. Неопиоидные анальгетики в значительной степени дают такую возможность. Они известны уже почти полторы сотни лет. С тех пор были созданы многие десятки препаратов, которые широко используются в медицинской практике.**



КЛАССИФИКАЦИЯ И МЕХАНИЗМЫ ДЕЙСТВИЯ

- Для неопиоидных анальгетиков и нестероидных противовоспалительных средств (НПВС) характерны три основных свойства. С одной стороны, они обладают способностью подавлять боль; с другой — тормозят любой воспалительный процесс, независимо от вызвавшей его причины, и, помимо этого, они оказывают жаропонижающее действие. Однако соотношение и выраженность этих фармакологических эффектов у разных препаратов неодинаковы. Ориентируясь на этот принцип, выделяют следующие группы ненаркотических анальгетиков и нестероидных противовоспалительных средств:





**обладающие
анальгетическим и сильным
противовоспалительным
действием;**

**обладающие
анальгетическим и умеренно
выраженным
противовоспалительным
действием;**



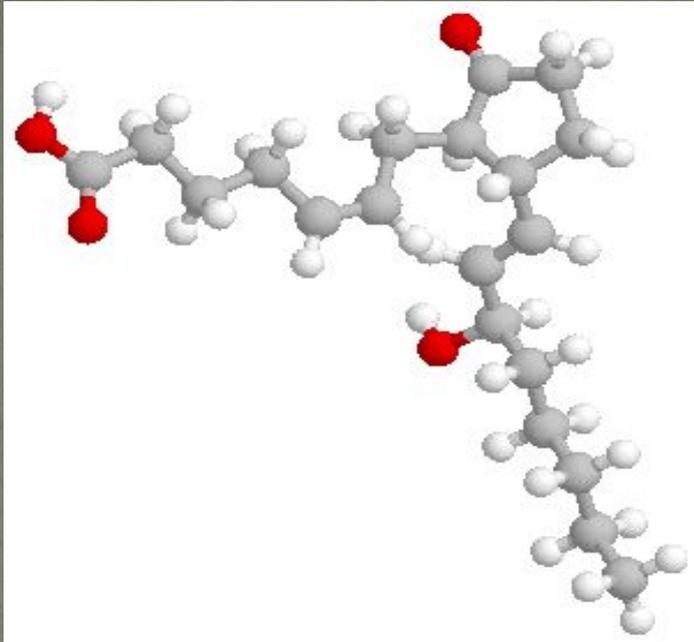
**обладающие
анальгетическим, но слабо
выраженным
противовоспалительным
действием.**



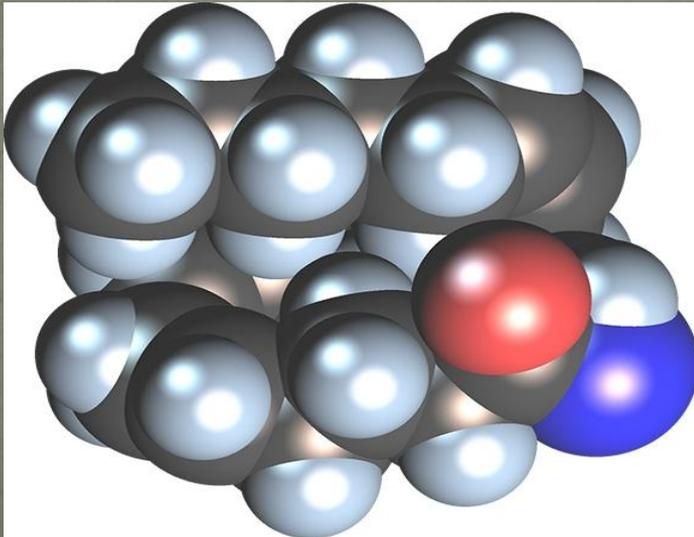
К первой группе относят производные салициловой кислоты (ацетилсалициловая кислота), производные фенилуксусной кислоты (диклофенак натрий). Ко второй — производные фенилпропионовой кислоты (ибупрофен, кетопрофен). Препараты двух первых групп получили название нестероидных противовоспалительных средств (НПВС). Наиболее популярным представителем третьей группы является парацетамол, практически лишенный противовоспалительных свойств.

- Неопиоидные анальгетики и НПВС широко используются в клинике и являются мощно развивающейся фармакологической группой. Это обусловлено потребностью медицинской практики, которая нуждается в обезболивающих средствах, лишенных тех нежелательных эффектов, что присущи опиоидным анальгетикам (привыкание, зависимость). Однако терапевтическое действие неопиоидных анальгетиков и НПВС также сопровождается побочными явлениями (иными, но иногда весьма серьезными).
- Механизм действия неопиоидных анальгетиков обусловлен, прежде всего, способностью угнетать циклооксигеназный путь метаболизма арахидоновой кислоты и, следовательно, понижать синтез простагландинов.





- Простагландины принимают участие в регуляции многих физиологических процессов в организме (свертывание крови, овуляция, тонус матки, сосудистый тонус, рост нервной ткани, метаболизм костной ткани, заживление ран, состояние ЖКТ, функция почек и др.). При развитии процессов воспаления они вызывают расширение сосудов, гиперемию, лихорадку, повышение чувствительности болевых рецепторов к действию медиаторов воспаления (брадикинин, гистамин и др.) и центров терморегуляции в ЦНС — к пирогенам.



ФАРМАКОКИНЕТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

Энцефалопатия
у детей



Фармакокинетические характеристики различных НПВС во многом схожи. Препараты группы хорошо всасываются из желудочно-кишечного тракта. В крови практически полностью связываются с альбуминами, вытесняя из связи с ними молекулы других химических соединений, в том числе лекарственных средств. Это приводит к увеличению свободной фракции последних и усиливает их действие. У новорожденных неопиоидные анальгетики и НПВС способны вытеснять билирубин из связи с белками, что может вызвать энцефалопатию.



- Следует отметить, что НПВС хорошо проникают в синовиальную жидкость, и это позволяет применять данные лекарственные средства при воспалительных заболеваниях суставов.

- Биотрансформируются препараты в печени, метаболиты выводятся с мочой. Лекарственные средства группы отличаются скоростью экскреции. По длительности периода полувыведения их делят на препараты короткого действия ($t_{1/2} < 4$ ч): ацетилсалициловая кислота, диклофенак, индометацин, ибупрофен, кетопрофен, фенпрофен, толметин, производные антраниловой кислоты; средней продолжительности (до $t_{1/2}$ до 20 ч): напроксен, сулиндак, дифлунизал; длительного действия ($t_{1/2} > 24$ ч): набуметон, фенилбутазон, оксикамы.





- Можно выделить несколько направлений в применении неопиоидных анальгетиков и НПВС: в качестве противовоспалительных средств, обезболивающих, жаропонижающих лекарственных средств, антиагрегантов. Для удобства применения при определенных заболеваниях препараты выпускаются в различных лекарственных формах: таблетки, таблетки-ретард, ректальные свечи, раствор для в/м введения и в виде средств для местного применения (мази, гели и т. д.).

ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ

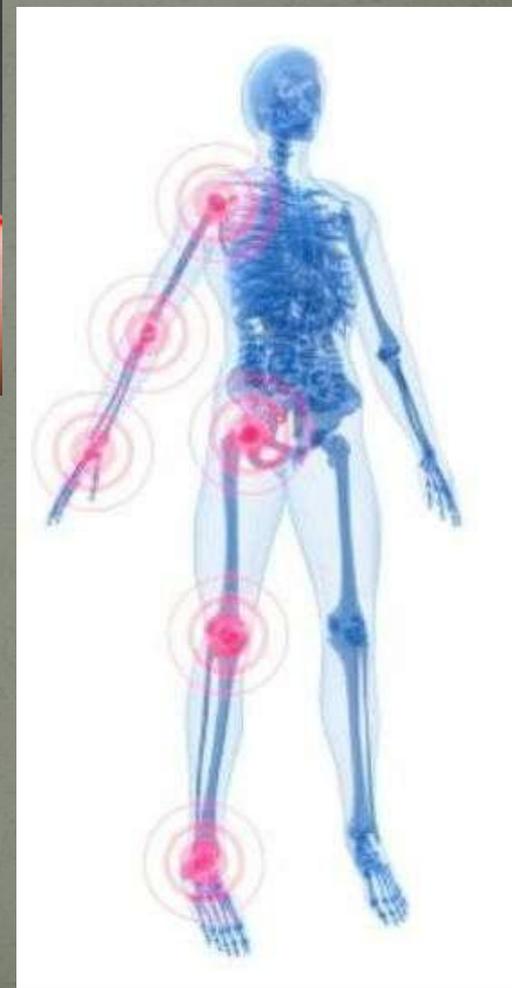
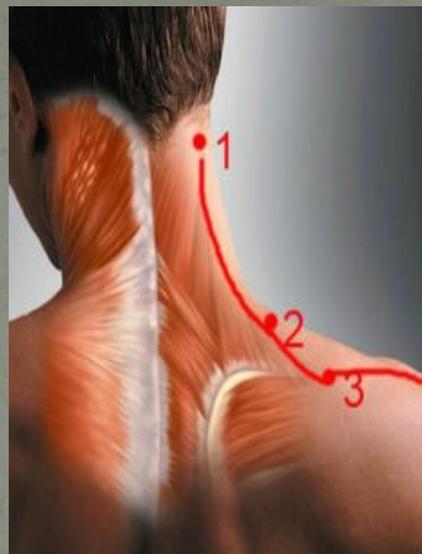
- Воспалительный синдром при ревматизме, артритах различной этиологии (ревматоидный, подагрический, инфекционно-аллергический и др.), анкилозирующем спондилите (болезнь Бехтерева), синдроме Рейтера. Менее эффективны НПВС при системной красной волчанке, склеродермии и других коллагенозах.

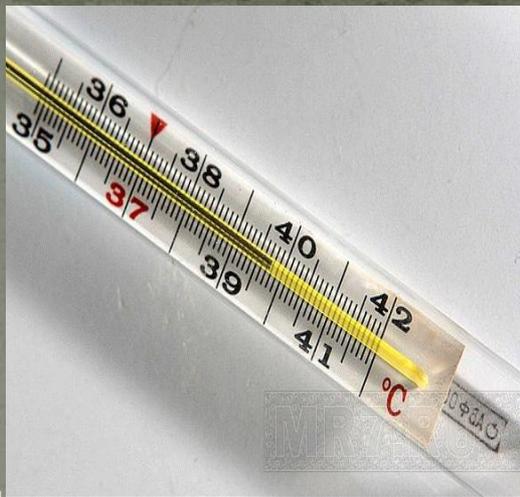
Различные неврологические заболевания (невралгии, радикулоневриты, ишиас, люмбаго и т.п.).

Неревматические заболевания опорно-двигательного аппарата (остеохондроз, остеоартроз, миозит и др.).

С целью обезболивания в послеоперационном периоде (сначала вместе с наркотическими анальгетиками, а с уменьшением остроты боли — в монотерапии).

Бытовые и спортивные травматические повреждения опорно-двигательного аппарата.





- **Зубная и головная боли.**

Острая боль спастического характера (почечная или печеночная колики). В этом случае в комбинации со спазмолитическими средствами.

В качестве жаропонижающих средств при лихорадке. Ограничением служит степень повышения температуры (выше 38,50С) и возраст пациента (противопоказаны у детей).

Различные формы ИБС (стенокардия, острый инфаркт миокарда), транзиторные нарушения мозгового кровообращения. Наиболее выраженными антиагрегантными свойствами обладает ацетилсалициловая кислота.

Первичная дисменорея.

Энурез, связанный с повышенным синтезом простагландинов в почках и в стенке мочевого пузыря.

ПОБОЧНЫЕ ЭФФЕКТЫ

Основные нежелательные явления, возникающие при назначении препаратов группы, связаны со снижением уровня простагландинов. Особенно чувствительна к этому процессу пищеварительная система, осложнения со стороны которой наблюдаются почти у 40% пациентов. Спектр побочных эффектов широк: от диспептических расстройств до возникновения язв, их перфораций и кровотечений.



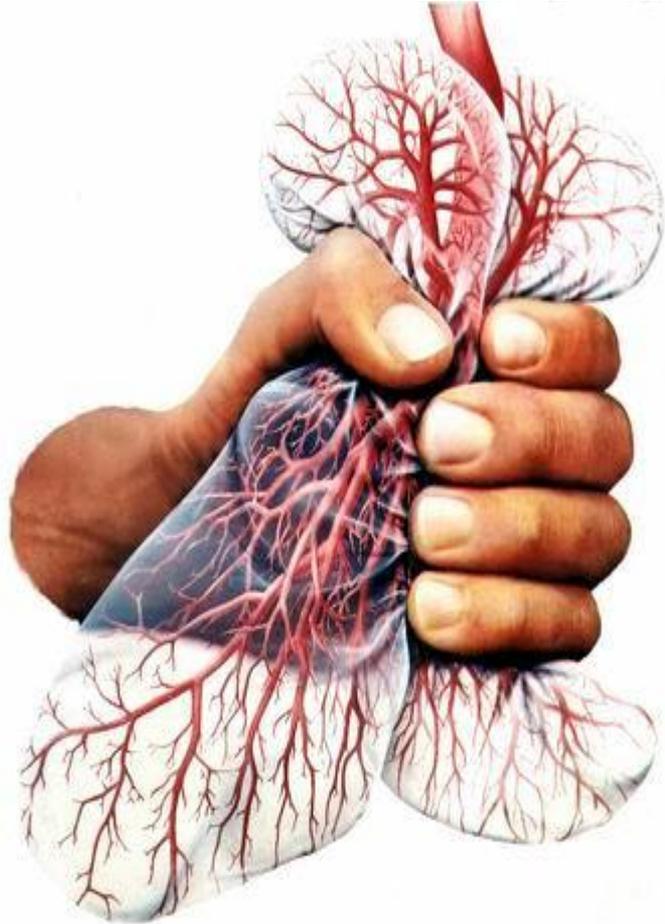
ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ И ПРЕДОСТЕРЕЖЕНИЯ



Неопиоидные анальгетики и НПВС противопоказаны при гиперчувствительности, желудочно-кишечных кровотечениях, язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки, язвенном колите, синдроме Рейя, «аспириновой» астме (провоцируемой приемом ацетилсалициловой кислоты или др. НПВС). Нарушения функции печени и почек, застойная сердечная недостаточность, тяжелая артериальная гипертензия, геморрагические диатезы, лейкопения, тромбоцитопения также являются противопоказаниями для назначения НПВС. Нельзя их применять при беременности (особенно в I и III триместрах) и в период кормления грудью. При необходимости приема этих лекарственных средств грудное вскармливание прекращают. Дефицит витамина К — противопоказание для приема препаратов этой группы.

- **Детский, а для некоторых препаратов и юношеский (для отдельных лекарственных средств до 18 лет) возраст являются препятствием для применения НПВС. Они противопоказаны пациентам пожилого возраста (старше 65 лет).**

При назначении НПВС необходим контроль картины периферической крови, функциональной активности печени и почек. Особенно внимательно необходимо следить за состоянием ЖКТ с целью предупреждения и/или выявления ulcerогенного действия препаратов, для профилактики которого рекомендуется одновременно назначать средства, обладающие гастропротекторным действием. У пациентов пожилого возраста или с артериальной гипертензией следует регулярно контролировать артериальное давление. В этом случае, а также при сердечной недостаточности необходимо с осторожностью выбирать НПВС, учитывая, что они влияют на содержание простагландинов, которые играют важную роль в регуляции почечного кровотока.



- Требуется соблюдать осторожность при назначении препаратов этой группы, если к одному из них отмечались аллергические реакции, так как высока вероятность перекрестной сенсibilизации. Необходимо учитывать, что НПВС могут вызывать бронхоспазм у больных бронхиальной астмой. При приеме некоторых НПВС следует прекратить занятия видами деятельности, требующей быстроты психомоторных реакций и повышенной внимательности.

- При назначении препаратов необходимо учитывать возраст пациента. Запрещено назначение ацетилсалициловой кислоты детям и подросткам с вирусными заболеваниями из-за повышенного риска развития синдрома Рейя. Высок риск побочных эффектов при назначении НПВС больным пожилого возраста. Такие пациенты требуют особо внимательного подбора доз и схем лечения, контроля за уровнем артериального давления, состоянием почек, печени, желудочно-кишечного тракта.





НПВС не следует одновременно назначать с рядом антибиотиков. Фторхинолоны и НПВС взаимно увеличивают нежелательные реакции со стороны ЦНС. Побочные эффекты бета-лактамных антибиотиков и аминогликозидов усиливаются при одновременном применении с НПВС из-за снижения выведения антибиотиков почками.

- Использованная литература:

Медицинский Вестник", № 12(283),
26.04.2004