

**НЕНАРКОТИЧЕСКИЕ
АНАЛЬГЕТИКИ,
НЕСТЕРОИДНЫЕ
ПРОТИВОВОСПАЛИТЕЛЬНЫЕ
СРЕДСТВА (НПВС)**

ПЛАН ЛЕКЦИИ

1. Сравнительная характеристика ННА с НА
2. Классификация и номенклатура анальгетиков – антипиретиков
3. Классификация и номенклатура НПВС
4. Механизм действия ненаркотических анальгетиков
5. Фармакологическая характеристика ННА

1. Сравнительная характеристика ННА с НА

НЕНАРКОТИЧЕСКИЕ АНАЛЬГЕТИКИ. СРАВНИТЕЛЬНАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА С НА

1. В отличие от наркотических анальгетиков характеризуются меньшей интенсивностью противоболевого эффекта (чаще назначают при головной боли, зубной боли, миалгии).

2. Обладают анальгезирующим, противовоспалительным, жаропонижающим эффектами.

3. Не вызывают лекарственной зависимости, эйфории, абстиненции, не угнетают дыхательный центр.

2. Классификация и номенклатура анальгетиков – антипиретиков

2.Классификация и номенклатура анальгетиков – антипиретиков

Производные пиразолона

- Метамизол натрия (Анальгин)

Производные парааминофенола

- Парацетамол (Панадол)

Комбинированные средства

- Седалгин
- Баралгин
- Цитрамон

3.Классификация и номенклатура НПВС

3.Классификация и номенклатура НПВС

Производные салициловой кислоты

- Ацетилсалициловая кислота (Аспирин)

Производные арилкарбоновой кислоты

- Кетопрофен (Кетонал)
- Диклофенак натрия (Вольтарен, Ортофен)

Оксикамы и фенаматы

- Мелоксикам (Мовалис) (2 поколение)
- Пироксикам (1 поколение)
- Мефенамовая кислота (1 поколение)

Производные пиразолона и индолуксусной кислоты

- Фенилбутазон (Бутадион)
- Индометацин (Метиндол)

Комбинированные

- Артротек

4. Механизм действия ненаркотических анальгетиков

4. Механизм действия ненаркотических анальгетиков

Анальгезирующее действие:

Торможение синтеза и метаболизма простагландинов (E1; E2; F2a) и, как следствие, нарушение передачи восприятия боли (ингибируют фермент простагландин-синтетазу)

4. Механизм действия ненаркотических анальгетиков

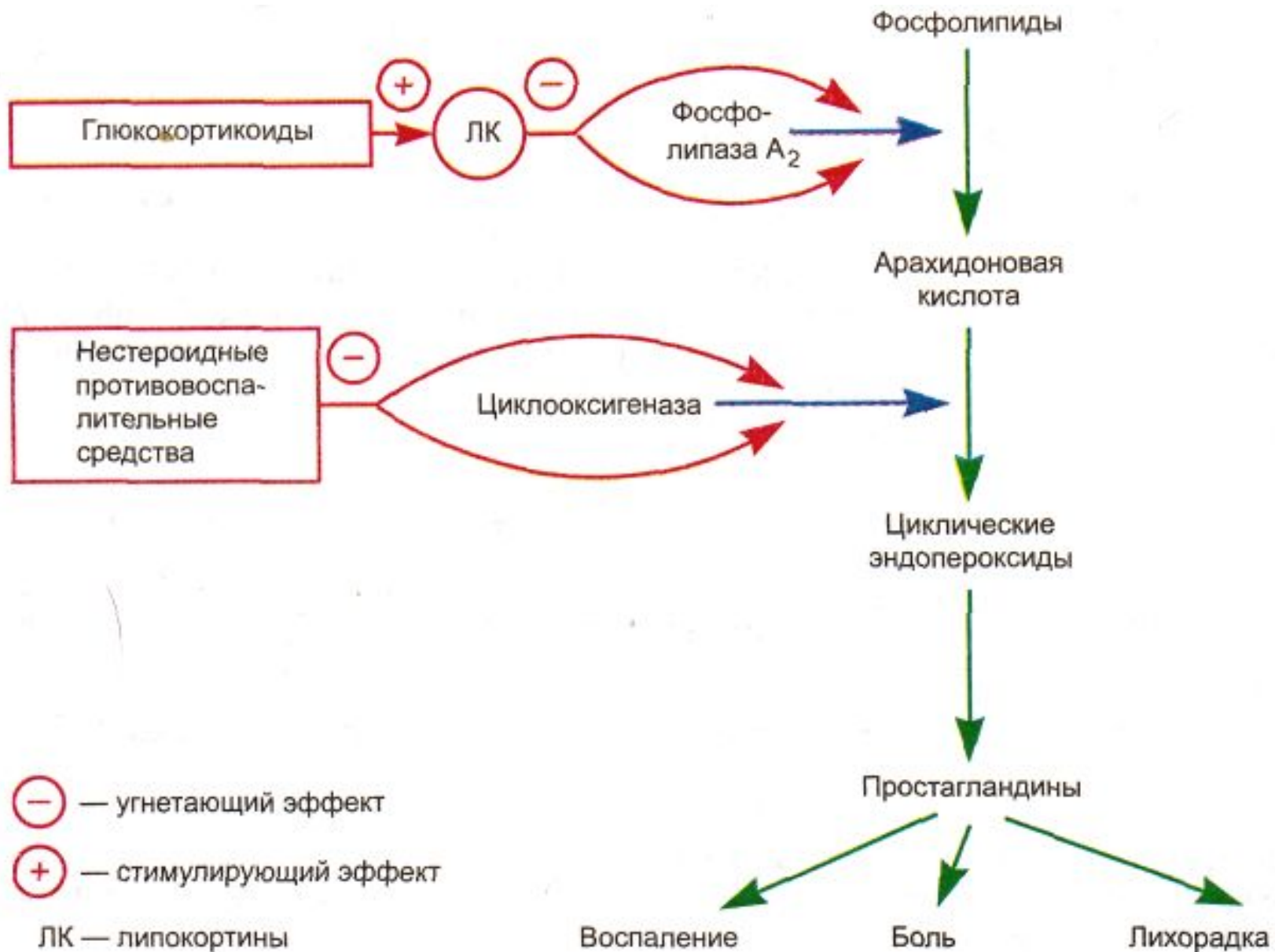
Жаропонижающее действие:

- угнетение центра терморегуляции;
- угнетение синтеза простагландинов и других пирогенов, вызывающих гипертермическую реакцию (уменьшение теплопродукции и увеличение теплоотдачи).

4. Механизм действия ненаркотических анальгетиков

Противовоспалительное действие;

Снижение
энергообеспечения (синтеза
АТФ) в области воспаления,
уменьшение метаболитов,
раздражающих
ноцицепторы.



5. Фармакологическая характеристика ННА

5. Фармакологическая характеристика ННА

АНАЛЬГИН (МЕТАМИЗОЛ НАТРИЯ)

Белый или с желтоватым оттенком порошок, хорошо растворимый в воде. Водный раствор при стоянии желтеет. Производное пиразолона.

Фармакодинамика.

- анальгезирующее;
- жаропонижающее;
- противовоспалительное действие.

5. Фармакологическая характеристика ННА

Показания к применению.

(Назначают внутрь после еды, в/м и в/в)

- боли различного происхождения (головная, мышечная, невралгии, радикулиты);
- лихорадочные состояния;
- грипп, ревматизм.

5. Фармакологическая характеристика ННА

При длительном использовании:

- угнетение кроветворения (агранулоцитоз) – под контролем анализа крови.
- аллергические реакции (анафилактический шок после в/в введения).

5. Фармакологическая характеристика ННА

Противопоказания:

- при повышенной чувствительности к препарату (кожная реакция);
- бронхоспазм;
- нарушение кроветворения.

5. Фармакологическая характеристика ННА

Форма выпуск:

Таб. 0.5 (взрослым);

Таб. 0.05; 0.1; 0.15.

Амп. 1мл и 2мл - 25%; 50%

5. Фармакологическая характеристика ННА

ПАРАЦЕТАМОЛ

Является активным метаболитом фенацетина.

Фенацетин очень токсичен, и поэтому его редко применяют в медицинской практике (фенацетиновый нефрит, гемолитическая анемия, желтуха, кожные высыпания).

Парацетамол – активный ННА, по эффективности соответствует аспирину.

5. Фармакологическая характеристика ННА

Фармакокинетика:

- быстро и хорошо всасывается из ЖКТ, максимальная концентрация в плазме крови через 30-40 мин., период полувыведения

1-3ч. у здоровых и 8-12ч. у больных заболеваниями печени.

- с белками крови связывается в небольшой степени;
- метаболизирует в печени;
- выводится почками.

5. Фармакологическая характеристика ННА

Фармакодинамика:

- жаропонижающее;
- анальгезирующее.

Показания:

- головная и зубная боль, миалгии, невралгии, артралгии, послеоперационный период.
- лихорадка.

В терапевтических дозах редко вызывает побочное действие (возможны аллергические реакции).

5. Фармакологическая характеристика ННА

Основной недостаток

- небольшая широта терапевтического действия, токсическая доза превышает максимальную терапевтическую всего в 2-3 раза.
- при острых отравлениях вызывает серьезные поражения печени и почек (накопление метаболитов).

5. Фармакологическая характеристика ННА

КОМБИНИРОВАННЫЕ СРЕДСТВА.

СЕДАЛГИН - таб.

- кислота ацетилсалициловая 0.2;
- парацетамол 0.2;
- фенобарбитал 0.025;
- кофеин 0.15;
- кодеин 0.01.

Болеутоляющее и успокаивающее средство при головных болях, невралгиях, невритах.

5. Фармакологическая характеристика ННА

БАРАЛГИН – таблетки, раствор, суппозитории.

- анальгин 0.5;
- питофенона гидрохлорид 0.005 (холинолитик);
- фенивериний бромид 0.0001 (ганглиоблокатор).

Анальгетическое и антиспастическое средство при почечных, печеночных, кишечных коликах; при спазмах коронарных сосудов и сосудов мозга.

5. Фармакологическая характеристика ННА

ЦИТРАМОН – в таблетках.

- ацетилсалициловая кислота 0.24;
- парацетамол 0.18;
- кофеин 0.03;
- какао 0.0225;
- кислота лимонная 0.005.

Головная боль, простудные заболевания.

НПВС

Производные САЛИЦИЛОВОЙ КИСЛОТЫ

АЦЕТИЛСАЛИЦИЛОВАЯ КИСЛОТА

Салицилаты – первые препараты, оказывающие специфическое противовоспалительное действие, которое сочетается с болеутоляющим и жаропонижающим эффектом, однако по сравнению с анальгетиками – антипиретиками, противовоспалительный эффект является у них доминирующим.

- **1827 год** – из коры ивы (жаропонижающее действие которое было известно с давних времен), был выделен гликозид **салицин**;
- **1838 год** – из салицина получена салициловая кислота;
- **1860 год** – осуществлен полный синтез этой кислоты и её натриевой соли;
- **1869 год** – была синтезирована ацетилсалициловая кислота (аспирин);
- **1875 год** – обнаружены противовоспалительная активность и лечебная эффективность при ревматизме;
- **1877 год** – было доказано, что салицилаты повышают выведение с мочой мочевой кислоты (лечение подагры);
- **1970 год** - установлена антиагрегантная активность ацетилсалициловой кислоты (профилактическое лечение тромбозов).

АЦЕТИЛСАЛИЦИЛОВАЯ КИСЛОТА

Фармакодинамика:

- противовоспалительное действие;
- жаропонижающее действие;
- анальгезирующее;
- антиагрегационное (ингибирует спонтанную и индуцированную агрегацию тромбоцитов).

АЦЕТИЛСАЛИЦИЛОВАЯ КИСЛОТА

Показания:

- лихорадочные заболевания, головные боли, мигрени, невралгии и др.;
- ревматизм, инфекционно – аллергический миокардит, ревматоидный полиартрит.

Побочные эффекты:

- профузное потоотделение, шум в ушах и ослабление слуха, аллергические реакции.
- диспепсия, желудочные кровотечения;
- ульцирогенное действие (прием препарата после еды: таблетки измельчить и запивать большим количеством воды, лучше молоком).

АЦЕТИЛСАЛИЦИЛОВАЯ КИСЛОТА

Противопоказания:

- язвенная болезни желудка и 12-перстной кишки;
- портальная гипертензия;
- венозный застой (в связи с уменьшением резистентности слизистой оболочки желудка);
- нарушение свертываемости крови;
- беременность (тератогенное действие) до 3-х месяцев – экспериментальные данные;
- есть сообщения о возможной опасности применения для снижения температуры при гриппе, ОРЗ в связи с развитием синдрома Рэя (гепатогенная энцефалопатия).

Форма выпуска: таб. 0,25 и 0,5 взрослым; 0,1 – детям.

Производные АРИЛКАРБОНОВОЙ КИСЛОТЫ.

КЕТОПРОФЕН

Фармакодинамика:

- противовоспалительное действие;
- анальгезирующее действие;
- умеренное жаропонижение.

Показания:

- ревматоидный артрит;
- анкилозирующий спондилит;
- суставные и внесуставные ревматоидные заболевания.

Противопоказания:

- язвенная болезнь желудка и 12-перстной кишки;
- беременность (первые 3 месяца);
- поражение печени и почек.

Форма выпуска: - капсулы 0,05; - суппозитории 0,1.

ДИКЛОФЕНАК НАТРИЯ

см. Кетопрофен

Форма выпуска:

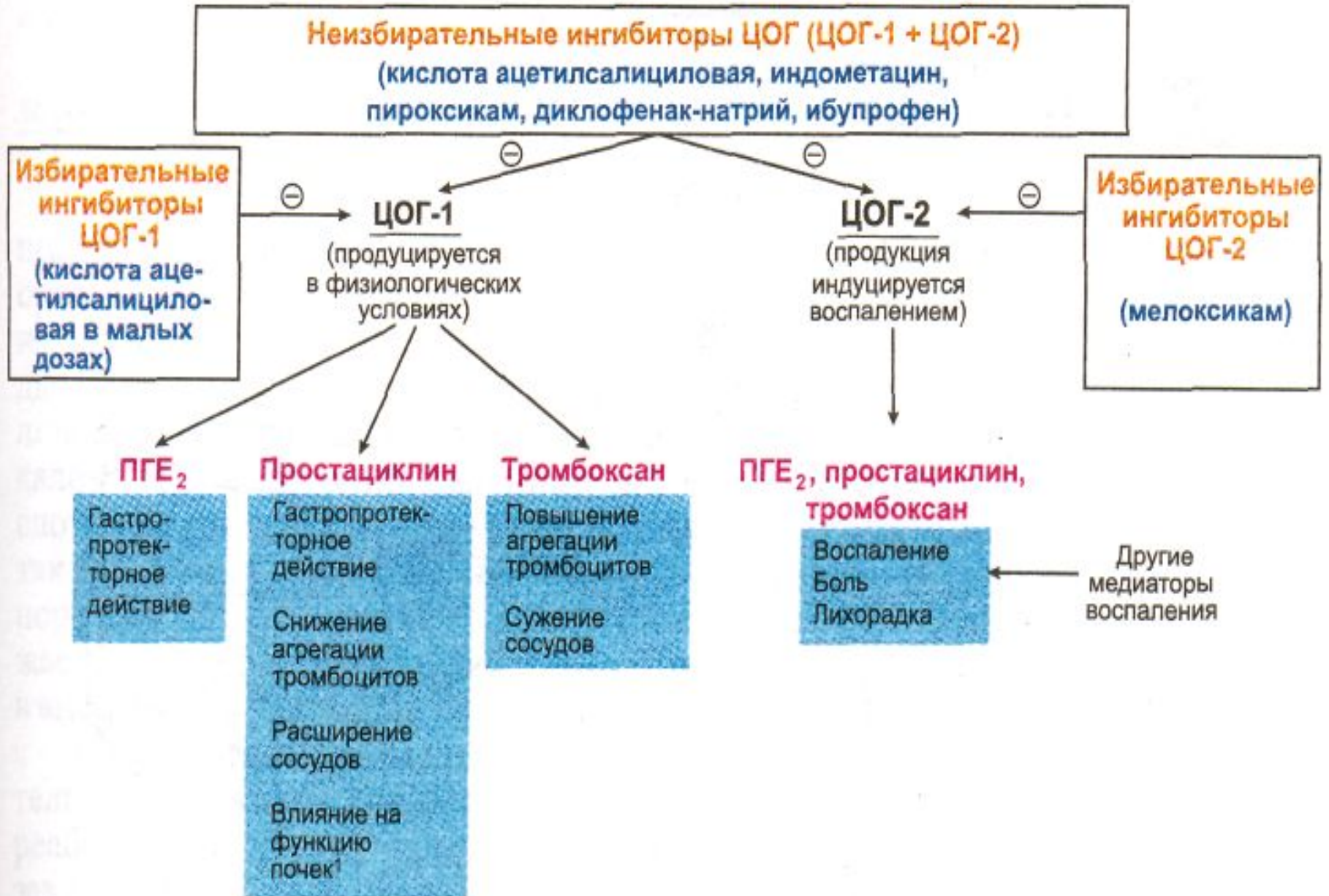
- таблетки 0,025 – взрослым;
0,015 – детям;
- раствор 2,5 % - 3мл

ОКСИКАМЫ И ФЕНАМАТЫ

Интерес представляет МЕЛОКСИКАМ (Мовалис)-
противовоспалительные препараты II поколения

- МОВАЛИС избирательно ингибирует ЦОГ-2 (противовоспалительное действие).
- ЦОГ (циклооксигеназа) – фермент, катализирующий биосинтез простагландинов, существует в виде двух изоформ - ЦОГ-1 и ЦОГ-2
- (противовоспалительный эффект-ингибирующее влияние на ЦОГ-2; язвирогенный-на ЦОГ-1)

Ингибиторы циклооксигеназы (ЦОГ)



Противовоспалительные препараты II поколения.

Основные отличия от I поколения (пироксикам)

- отсутствие ульцерогенного эффекта;
- лучшая переносимость;
- применяется 1 р. в сутки;
- по эффективности не уступает пироксикаму и ортофену.

Форма выпуска:

- таб. 0,0075; 0,015.
- свечи 0,015.

ОКСИКАМЫ И ФЕНАМАТЫ

МЕФЕНАМИНОВАЯ КИСЛОТА.

- как противовоспалительный препарат превосходит салицилаты;
- по анальгезирующим свойствам – равен бутадиону и превосходит салицилаты;
- по жаропонижающим свойствам – равен этим препаратам;
- хорошо переносится.

Формы выпуска: - таб. 0,25; 0,35 и 0,5.

ПРОИЗВОДНЫЕ ПИРОЗОЛОНА И ИНДОЛУКСУСНОЙ КИСЛОТЫ.

ФЕНИЛБУТАЗОН (Бутадион).

- по противовоспалительным свойствам превосходит ацетилсалициловую кислоту;
- долго задерживается в организме и задерживает другие препараты (морфин, ПАСК, пенициллин, антидиабетические);
- при приеме бутадиона – необходимо уменьшить прием жидкости, во избежания отеков.

Формы выпуска: таб. 0,15 взрослым;

0,05 детям;

мазь 5 %.

ПРОИЗВОДНЫЕ ПИРОЗОЛОНА И ИНДОЛУКСУСНОЙ КИСЛОТЫ.

ИНДОМЕТАЦИН (Метиндол)

Один из наиболее активных НПВС, обладает анальгезирующим действием.

Формы выпуска:

- таблетки и капсулы 0,025 и 0,1;
- мазь 10 % - 40,0

Комбинированные

АРТРОТЕК

- мизопростол 200 мг (предотвращает
ульцирогенное действие);
- диклофенак натрия (ортофен) 200 мг