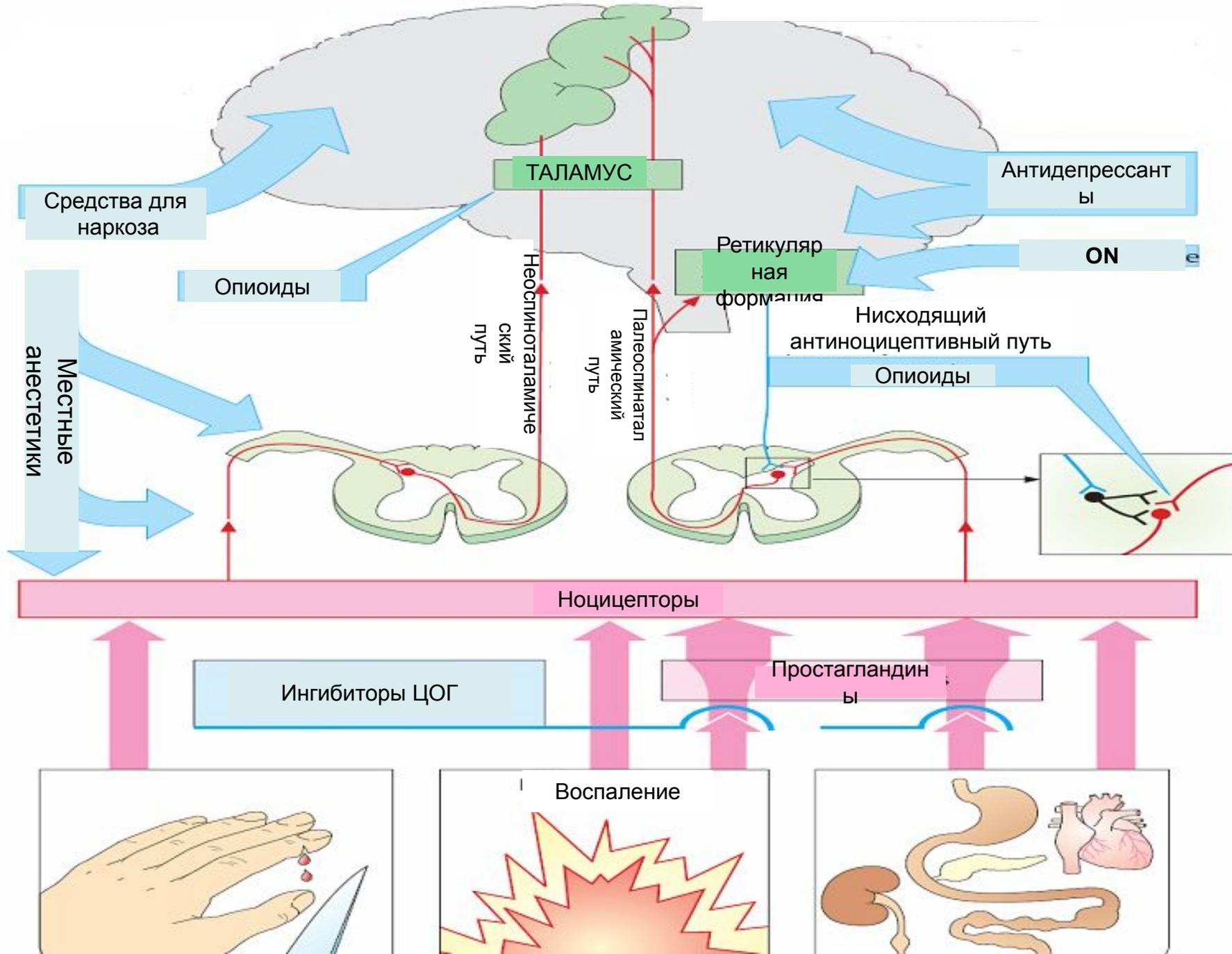


Наркотические анальгетики



Кафедра фармакологии с
клинической фармакологией ГОУ
ВПО СОГМА
Минздравсоцразвития России



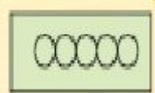
Антиноцицептивная система

Медиаторы:

- Лей-энкефалин
- Мет-энкефалин
- Динорфин А
- Динорфин В
- β -эндорфин

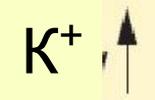


β -эндорфин

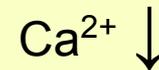


Энкефалин

Опиоидный
рецептор



Возбудимос
ть ↓



Высвобожден
ие
медиаторов
боли ↓



Антагони
ст
налосо
н

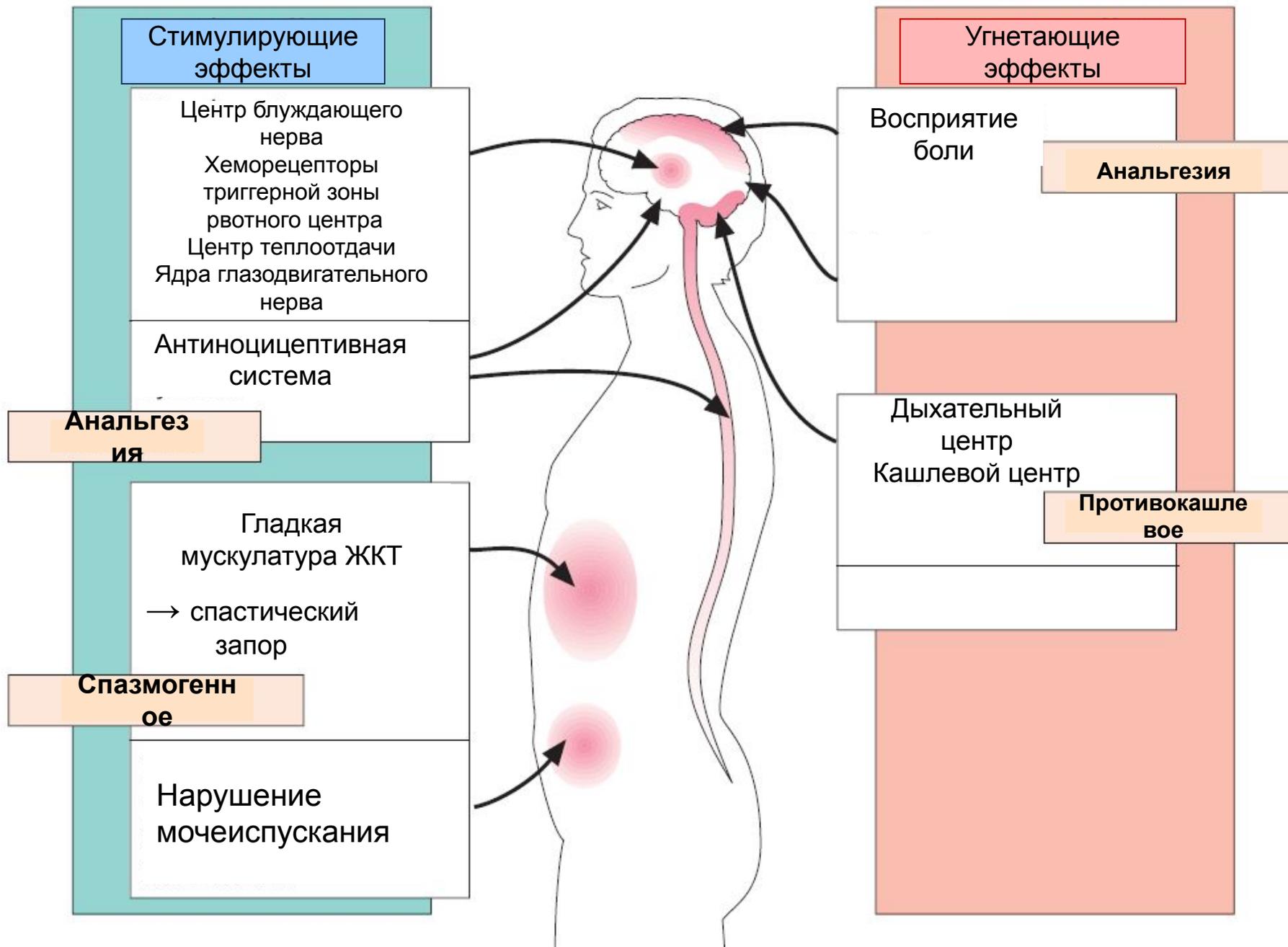
Эффекты стимуляции опиоидных рецепторов

Анальгезия супраспинальная спинальная	$\mu_1, \kappa_3, \delta_1, \delta_2$ $\mu_2, \kappa_1, \delta_2$
Эйфория и лекарственная зависимость	μ
Психотомиметическое действие	κ
Седативное действие	μ, κ
Угнетение дыхания	μ_2, κ, δ
Угнетение моторики желудочно-кишечного тракта	μ_2, κ, δ
Сужение зрачка	μ_2, κ_1
Диурез	κ_1
Процессы обучения, деятельность	μ_2, δ_2
Выделение гормонов: пролактин гормон роста	μ_1 μ_2 и/или δ

	μ	κ	δ
Полные агонисты			
Морфин	+++	+	+
Кодеин	++	+	+
Промедол	++	+	+
Фентанил	+++	-	+
Метадон	++	-	-
Агонисты-антагонисты и частичные агонисты			
Бупренорфин	Ч	-	++
Бупрофанол	Ч	+++	?
Налбуфин	+	++	+
Пентазоцин	Ч или +	++	+

+ - агонист; **+** - антагонист; **Ч** – частичный агонист;

- - активность отсутствует.



Эффекты стимуляции центральных опиоидных рецепторов

- Анальгезия
- Эйфория или дисфория
- Седативный и снотворный эффект.
- ↓ высвобождения рилизинг-гормона гонадотропинов и АКТГ. ↑ выделения пролактина, соматотропного гормона и вазопрессина.
- Гипотермия.
- Миоз и спазм аккомодации
- Угнетение дыхания
- Противокашлевое действие
- Тошнота и рвота
- Брадикардия

Эффекты стимуляции периферических опиоидных рецепторов

- Стимуляция выделения гистамина → расширение сосудов, бронхоспазм, отек слизистой носа.
- Повышение тонуса гл/м внутренних органов: желудка, кишечника, желчевыводящих путей, мочеточников.
- Снижение пропульсивной моторики ЖКТ.
- Подавление рефлексов на мочеиспускание.

- **Побочные эффекты:** тошнота, рвота, спазм гл/м, брадикардия, гипотония, угнетение дыхания, привыкание, зависимость.
- **Противопоказания:** гипотензия, дыхательная недостаточность, спастические заболевания ЖКТ и мочевыводящих путей, повышение внутричерепного давления, беременность, роды, дети до 2 лет.

Острое отравление морфином

Симптомы:

- Гипотермия
- Рост внутричерепного давления
- Клонико-тонические судороги
- Ступор, переходящий в кому
- Спинальные сухожильные рефлексy сохранены
- Аритмия, гипотензия, отек легких
- Миоз → мидриаз
- Рвота
- Задержка мочеиспускания и дефекации
- Потоотделение
- Поверхностное, затем периодическое дыхание
- Смерть от паралича дыхательного центра

Острое отравление морфином

Меры помощи:

- Налоксон – конкурентный антагонист наркотических анальгетиков
0,4%-1 мл внутривенно.
- Мероприятия по ускорению выведения ЛС.
- Симптоматическая терапия.

Зависимость:

- Физическая – абстинентный синдром в течение нескольких дней после отмены
- Психическая – месяцы и годы

Абстинентный синдром

Симптомы:

- Непреодолимое желание принять наркотический препарат
- Усталость, раздражительность, бессонница, тревога, дисфория.
- Зевота, тошнота, рвота, диарея.
- Спонтанная боль, атаксия, частое дыхание
- Гипертермия.
- Расширение зрачков
- Потливость, «гусиная кожа»
- Гипертензия