



# ФАРМАКОЛОГИЯ



ТЕМА

Анальгезирующие  
(болеутоляющие) средства.

лекция



# ФАРМАКОЛОГИЯ



**Цель** - Сформировать знания студентов о фармакокинетике и фармакодинамике Анальгезирующих (болеутоляющих) лекарственных средствах.

**Задачи:**

**Учебные** - изучить фармакотерапевтические действия лекарств по основным группам Анальгезирующих (болеутоляющих) средств. (ПК. 3.2.)

**Развивающие** - развивать стремление к расширению своих профессиональных знаний (ОК.8)

**Воспитательные** - развивать аккуратность, добросовестность, интерес к профессии, интеллект, трудолюбие, стремление брать на себя ответственность за результат выполнения заданий. (ОК.7)



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Изучаемые вопросы

1. Классификация Анальгезирующих (болеутоляющих) средств. Общая характеристика.
2. Основные особенности ЛС - наркотические анальгетики.
3. Основные особенности ЛС - ненаркотические анальгетики.



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Мотивационная характеристика темы:

**Анальгезирующие (болеутоляющие) средства** устраняют или уменьшают чувство боли и отрицательные рефлекторные изменения в деятельности органов, вызванные болевыми раздражителями. Анальгетики избирательно угнетают болевые реакции и тем самым сохраняют функции органов, сознание и координированную двигательную активность. Анальгетики (наркотические и ненаркотические) нашли широкое применение в практической медицине, т.к. болевой синдром является спутником многих заболеваний и патологических реакций.



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## **Мотивационная характеристика темы:**

**Наркотические анальгетики** используются, главным образом, для подавления сильных, мучительных болевых ощущений в тех случаях, когда другие лекарственные средства не эффективны. Они применяются для подавления послеоперационных болей, травматических болей, болей при инфаркте миокарда, болей спастического генеза, для обезболивания родов, при хронических болях и для нейролептанальгезии.



# ФАРМАКОЛОГИЯ



**Мотивационная характеристика темы:**

**Ненаркотические анальгетики**, обладающие противовоспалительным, жаропонижающим и анальгезирующим эффектами назначаются при различных патологических состояниях воспалительной природы (за исключением фенаcetина и парацетамола). В практической медицине нестероидные противовоспалительные средства (НПВС) применяются для лечения ревматизма, ревмокардита, ревматоидного артрита, миозитах, невралгиях, лихорадочных состояниях с целью подавления воспаления, уменьшения боли и в качестве жаропонижающих средств.



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Анальгетики наркотики

(классификация по химическому строению)

1. Алкалоиды опия фенантреновой структуры :

**Морфин, Омнопон, Метилморфин (кодеин),  
Этилморфин.**

2. Синтетические: **Тримеперидин (промедол),  
Фентанил, Пентазоцин (фортрал, лексир),  
Бупренорфин (норфин), Буторфанол (морадол,  
стадол), Трамадол (трамал).**



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Анальгетики наркотики

(классификация по силе анальгезирующего действия)

**Сильные** (превышают по силе действия морфин) – фентанил (в 100 раз), бупренорфин (в 25 – 50 раз), буторфанол (в 5 раз).

**Средней силы** (аналогичны морфину) – морфин, этилморфин, пиритрамид, налбуфин.

**Слабые** (эффект уступает морфину) – омнопон (в 2 раза), промедол, пентазоцин (в 3 – 4 раза), трамадол (в 3 – 5 раз), кодеин (в 5 – 7 раз).



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Анальгетики наркотики

### Механизм действия

-подавляют восприятие боли, нарушая ее распространение, тормозят эмоциональную реакцию на нее.

По отношению к опиатным рецепторам наркотические анальгетики можно разделить на три группы:

- **агонисты** рецепторов (морфин, омнопон, кодеин, этилморфин, промедол, фентанил, пиритрамид, трамадол (смешанный механизм)).

- **агонисты-антагонисты** рецепторов (пентазоцин, бупренорфин, буторфанол, налбуфин, налорфин).

-**антагонисты** рецепторов (налоксон, налтрексон) используются при отравлении наркотическими анальгетиками.



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## **Анальгетики наркотики** **Фармакологические свойства**

Анальгезирующее действие.

Эйфория, седативный эффект, поверхностный сон.

Вызывают миоз, спазм аккомодации (Активируют рцентр глазодвигательного нерва).

Угнетение дыхательного центра.

Возбуждение вагуса – брадикардия, бронхоспазм.

Стимуляция хеморецепторов триггерной зоны рвотного центра – рвота.

Угнетение сосудодвигательного центра (при отравлении).



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Анальгетики наркотики

### Фармакологические свойства

**Морфин** вызывает ортостатическую гипотензию, спазм гладкой мускулатуры, запор, подавляет рефлекс на дефекацию и мочеиспускание, расслабляет матку, снижает частоту и амплитуду ее сокращений при родах, удлиняет роды, нарушает дыхание плода.

**Трамадол и агонисты-антагонисты** – вызывают тахикардию и повышают АД.

**Промедол** повышает сократительную деятельность матки, не препятствует открытию ее шейки, меньше морфина вызывает дыхательные расстройства у плода.



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## **Анальгетики наркотики** **Фармакологические свойства**

**Пентазоцин** плохо проникает через плацентарный барьер и слабо влияет на дыхание плода.

**Оmnopон**, содержит в своем составе папаверин, который обладает спазмолитической активностью.

**Морфин** снижает секрецию гонадотропинов и АКТГ, но повышает выделение пролактина, гормона роста и вазопрессина. Угнетение центрального звена кашлевого рефлекса – противокашлевое действие (кодеин, этилморфин); спазмолитическое действие (омнопон, промедол). Усиление болеутоляющего действия ненаркотических анальгетиков (кодеин).



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## **Анальгетики наркотики**    **Применение**

- 1. Профилактика болевого шока, инфаркт миокарда, острый отек легких, послеоперационные боли, боли у онкологических больных.**
- 2. Сухой кашель - (кодеин, этилморфин).**
- 3. Спастические боли, колики (омнопон, промедол).**
- 4. Нейролептанальгезия (фентанил совместно с нейролептиком дроперидолом).**
- 5. Перед наркозом (для премедикации).**



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Анальгетики наркотики

### Побочные эффекты

Угнетение дыхания, лекарственная зависимость, спастические запоры, миоз, дисфория, сухость во рту, затуманенность мышления, головокружение, тошнота и рвота, головная боль, повышенная утомляемость, парестезии, брадикардия. Иногда встречаются непереносимость в виде тремора и бреда, а также аллергических реакций.



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Анальгетики наркотики

### Противопоказания(относительные)

ранний детский возраст (до 3-х лет) - опасность угнетения дыхания;

у беременных женщин (особенно в конце беременности, во время родов);

при самых различных видах дыхательной недостаточности;

при тяжелых травмах головы (повышение внутричерепного давления; морфин еще более повышая внутричерепное давление, вызывает рвоту; рвота, в свою очередь, повышает внутричерепное давление и так формируется порочный круг).



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Нестероидные противовоспалительные средства

(классификация по химическому строению и активности)

### I группа - НПВС с выраженной противовоспалительной активностью:

Салицилаты	- <b>ацетилсалициловая кислота</b> (АСК);
Пр-е индолуксусной кислоты	- <b>индометацин</b> (метиндол);
Пр-е фенилуксусной кислоты	- <b>диклофенак</b> натрия и калия (ортофен, вольтарен, вольтарен – рапид);
Оксикамы	- <b>пироксикам</b> (роксикам); - <b>мелоксикам</b> (мовалис); - лорноксикам (ксефокам).
Пр-е пропионовой кислоты	- <b>ибупрофен</b> (бруфен, нурофен); - <b>напроксен</b> (напросин);- <b>кетопрофен</b> (кнавон, профенид);



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Нестероидные противовоспалительные средства

(классификация по химическому строению и активности)

### II группа - НПВС со слабой противовоспалительной активностью:

Пр-е антраниловой кислоты	- мефенамовая кислота (помстал);
Пиразолоны	- метамизол (анальгин);
Пр-е гетероарилуксусной кислоты	- кеторолак (кетанов, кеторол);
Содержащие сульфонамидную группу	- нимесулид (месулид, найз, нимесил); - целекоксиб (целебрекс).



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Нестероидные противовоспалительные средства (НПВС)

(классификация по химическому строению и активности)

### III группа анальгетики - антипиретики:

Производные парааминофенола	- фенацетин; - ацетаминофен (парацетамол).
Избирательные ингибиторы ЦОГ - 1	<b>Ацетилсалициловая кислота</b> в малых дозах
Неизбирательные ингибиторы ЦОГ	Большинство НПВС
Преимущественно избирательные ингибиторы ЦОГ - 2	Мелоксикам, набуметон, нимесулид
Специфические ингибиторы ЦОГ - 2	Целекоксиб
Ингибиторы ЦОГ в ЦНС	Парацетамол



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## **Нестероидные противовоспалительные средства (НПВС)** (классификация по степени избирательного ингибирования ЦОГ)

### **1. Выраженность противовоспалительного действия:**

индометацин > диклофенак > пироксикам,  
лорноксикам, мелоксикам, нимесулид, набуметон >  
напроксен > бутадион >> ибупрофен > анальгин >  
аспирин.

### **2. Выраженность анальгетического действия:**

кетопрофен, лорноксикам, пироксикам, мелоксикам,  
нимесулид > кеторолак > диклофенак > напроксен,  
целекоксиб > индометацин >> анальгин >> ибупрофен  
> бутадион > парацетамол > аспирин.



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## **Нестероидные противовоспалительные средства (НПВС)** (классификация по активности )

**3. Выраженность антипиретического действия:** диклофенак  
> пироксикам > анальгин > индометацин > напроксен >>  
ибупрофен > бутадион > аспирин.

**4. Выраженность ulcerogenicного действия:** индометацин >>  
пироксикам > диклофенак > напроксен > бутадион > аспирин >  
анальгин > ибупрофен.

По клиническим данным чаще всего ulcerацию вызывают аспирин и индометацин, реже пироксикам, напроксен, бутадион, более редко ибупрофен, диклофенак, анальгин, в минимальной степени – селективные ингибиторы ЦОГ-2.



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## НПВС

### Механизм действия

– угнетение синтеза простагландинов (ПГ) из арахидоновой кислоты путем ингибирования фермента циклооксигеназы (ЦОГ).

Изофермент – **ЦОГ–1** – контролирует выработку простагландинов, регулирующих целостность слизистой оболочки желудочно–кишечного тракта, функцию тромбоцитов и почечный кровоток,



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## НПВС

### Механизм действия

–Изофермент – **ЦОГ–2** – участвует в синтезе простагландинов при воспалении (в нормальных условиях отсутствует). Предполагается, что **противовоспалительное действие НПВС** обусловлено ингибированием ЦОГ–2, а их **нежелательные реакции** – ингибированием ЦОГ–1.



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## НПВС

### Фармакологические свойства

**Анальгезирующее** (центральное и периферическое)

**Противовоспалительное** (кроме фенаcetина и парацетамола).

**Жаропонижающее действие** - снижение теплопродукции и повышение теплоотдачи.

**Антиагрегантное,**  
токолитическое действие.

Мелоксикам, нимесулид, набуметон Мелоксикам, нимесулид, набуметон, целикоксиб преимущественно блокируют ЦОГ<sub>2</sub>.



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## НПВС

### Применение

- 1. Воспаления** (невралгии, радикулоневриты, люмбаго) - (Кеторолак, Диклофенак, Пироксикам), внутрь и парентерально.
- 2. Боль** спастического генеза (почечная, печёночная колика) - п (Анальгин, Баралгин).
- 3. Различные болевые синдромы** (головная, зубная боли, дисменорея) - Кеторолак, Диклофенак, Пироксикам.
- 4. Лихорадка.**
- 5. Профилактика тромбозов** - Аспирин.



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## НПВС Побочные эффекты

- 1. Раздражающее действие на ЖКТ** (кроме парацетамола). Наиболее ульцерогенны Аспирин, Индометацин, Пироксикам.
- 2. Гематологические реакции:** кровотечения; (Индометацин, Аспирин)
- 3. Реакции гиперчувствительности и аллергические реакции.** Аспирин и другие НПВС рекомендуется с очень большой осторожностью применять у больных бронхиальной астмой.
- 4. Реакции со стороны ЦНС** - головная боль, головокружения, обмороки, сонливость, чувство утомления, и даже судороги – Индометацин; ототоксичность – Аспирин, Индометацин, Ибупрофен, пиразолоны..



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## **НПВС Побочные эффекты**

**5. Нарушения функции почек.**

**6. Поражения печени.**

**7. Мутагенное и тератогенное действие (Аспирин, Бутадион), канцерогенное действие (Амидопирин, Фенацетин).**

**8. Удлинение беременности и замедление родов - из-за торможения синтеза простагландинов E2 и F2, которые стимулируют миометрий. Препараты (особенно Индометацин) могут тормозить родовую деятельность. Поэтому НПВС противопоказаны при беременности.**



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## НПВС

### Противопоказания

Язвенная болезнь, любые эрозивно-язвенные поражения желудочно-кишечного тракта.

Бактериальные артриты и др.

Беременность и период кормления грудью.

Дети до 2 лет.

Лейкопении.

Тяжёлые нарушения функции печени, сердца и почек.



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Информационные источники

Майский В.В., Аляутдин Р.Н.

«Фармакология с общей рецептурой»,

учебное пособие для мед. училищ,. –

М., 2015. Стр.80-89, 171-174.



# ФАРМАКОЛОГИЯ



**СВР:**

Составление конспекта по теме:  
«Средства, угнетающие ЦНС».

Майский В.В., Аляутдин Р.Н.  
«Фармакология с общей рецептурой»,  
учебное пособие для мед. училищ,. – М.,  
2015. Стр.67 – 80.



# ФАРМАКОЛОГИЯ



**СВР:** Выполнение в рабочей тетради заданий по рецептуре по теме.

1. 10 ампул по 1 мл 1% раствора Морфина (*Morphini hydrochloridum*). Назначить для подкожного введения по 1 мл.
2. 10 ампул по 1 мл 5% раствора Трамадола (*Tramadolum*). Назначить для внутримышечного введения по 1 мл каждые 4 часа.
3. 20 порошков по 2 сг Кодеина фосфата (*Codeini phosphas*). Назначить по 1 порошку 2 раза в сутки.
4. 10 ампул по 1 мл 0,04% раствора Налоксона гидробромида (*Naloxonei hydrobromidum*). Назначить для внутривенного введения по 1-2 мл.



# ФАРМАКОЛОГИЯ



**СВР:** Выполнение в рабочей тетради заданий по рецептуре по теме.

5. 10 таблеток по 5 дг Ацетилсалициловой кислоты (*Acidum acetylsalicylicum*). Назначить по 1 таблетке 3 раза в сутки после еды.

6. 10 ампул по 1 мл 3% раствора Кеторолака (*Ketorolacum*). Назначить для внутримышечного введения по 1 мл 4 раза в сутки.

7. 10 ампул по 1 мл 50% раствора Метамизола натрия (*Metamizolum natrium*). Назначить для внутримышечного введения по 1 мл.



# ФАРМАКОЛОГИЯ



**СВР:** Выполнение в рабочей тетради заданий по рецептуре по теме.

8. 10 ампул по 5 мл раствора «Баралгина» («Baralginum»). Назначить для внутримышечного введения по 5 мл.

9. 10 суппозиторий ректальных по 25 мг Парацетамола (Paracetamolium). Назначить по 1 суппозиторию ректально 3 раза в сутки.



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Вопросы для контроля

1. Понятие об анальгетических средствах.
2. Фармакологические группы, способные устранять боль, их сравнительная характеристика.
3. Основные особенности наркотических анальгетиков.
4. Препараты наркотических анальгетиков, их синонимы, показания к применению, побочные эффекты?
5. Характерные особенности ненаркотических анальгетиков, показания к их применению, побочные эффекты?
6. Терапевтические и побочные эффекты аспирина, основные противопоказания.
7. Ненаркотические анальгетики с доминирующим противовоспалительным эффектом и их синонимы.