Реферат

Дисциплина: **«Ветеринарная фармакология»**

На тему: **«Наркотические анальгетики»**

Выполнил: студент 3 курса 1группы
Факультета ветеринарной медицины
Минаев Сергей Вадимович

Проверила:
Доцент
Кузнецова Марина Ивановна

Содержание:

1)Введение

Агонисты:

- Опий
- Морфин
- Промедол
- Фентанил
- Омнопон
- Кодеин
- Метадон

Агонисты – антагонисты (частичные агонисты):

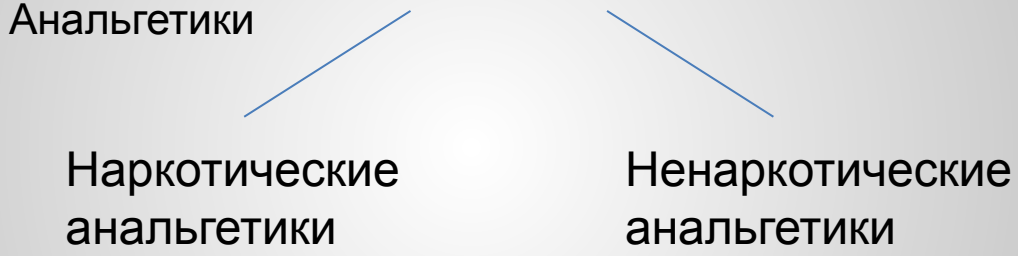
- Пентазоцин
- Налорфин

Антагонисты:

- Налоксон

Введение

Анальгезирующими веществами, или анальгетиками (от греч. algos — боль и an — без), называют лекарственные средства, ослабляющие или устраняющие чувство боли.

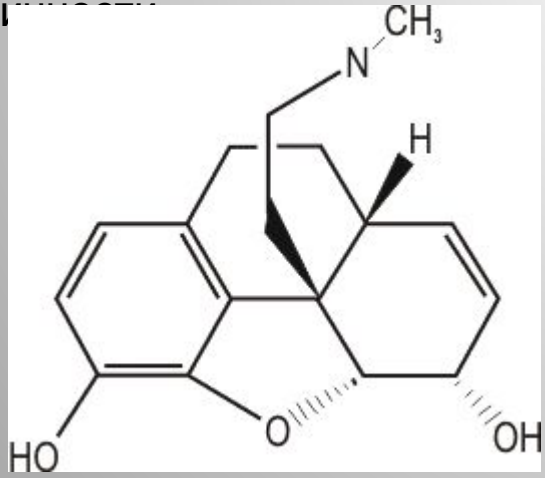


Введение

Наркотические анальгетики, помимо анальгезии, угнетают также другие функции центральной нервной системы, а при неоднократном применении формируется лекарственная зависимость (наркомания). Из-за опасности наркомании их применение для медицинских целей находится под строжайшим контролем и регулируется специальными законодательными актами. Использование этих средств для лечения животных в нашей стране запрещено (если и возможно, то только после их включения в перечень препаратов, разрешенных к применению в ветеринарии, утверждаемый Министерством сельского хозяйства РФ).). В ряде других стран такого запрета нет, но соблюдается строжайший контроль над их хранением и использованием.

Введение

К наркотическим анальгетикам относят препараты опия, изолированные из него алкалоиды и синтетические заменители главного его алкалоида — морфина. Они выключают любые виды боли и угнетают кашлевой рефлекс любого генеза. Наряду с анальгезией при первых приемах вызывают эйфорию. С последующими приемами формируется психическая и физическая зависимость (пристрастие или наркомания) — неудержимое стремление к возобновлению потребления средства, как только закончилось его действие в организме. При воздержании от применения наркотика проявляется синдром абстиненции— тяжелого психического и сомато-вегетативного расстройства с постепенной деградацией личности.



Морфин

Введение

Исходя из принципа взаимодействия анальгетиков этой группы с опиоидными рецепторами, их можно представить в виде следующих групп.

- Агонисты
- Агонисты-антагонисты
- Антагонисты

Агонисты

Агонисты-- вещества, которые при взаимодействии со специфическими рецепторами вызывают в них изменения, приводящие к биологическому эффекту.

Стимулируя специфические рецепторы, агонисты вызывают изменения функций органов и систем (например, изменяют силу и частоту сокращений сердца, АД, тонус гладких мышц внутренних органов, секрецию желез и т.д.) Такие изменения, вызываемые лекарственным веществом, обозначают как фармакологические эффекты данного вещества

Опий

Опий — высушенный млечный сок из незрелых головок снотворного мака (Papaver somniferum). В опии содержится более 20 алкалоидов — производных фенантрена (морфин, кодеин, тебаин и др.) и изохинолина (папаверин, наркотин, нарцеин). Производные фенантрена — типичные анальгетики, изохиналнины же не влияют на центральную нервную систему, не вызывают пристрастия оказывают только спазмолитическое влияние на гладкую мускулатуру.

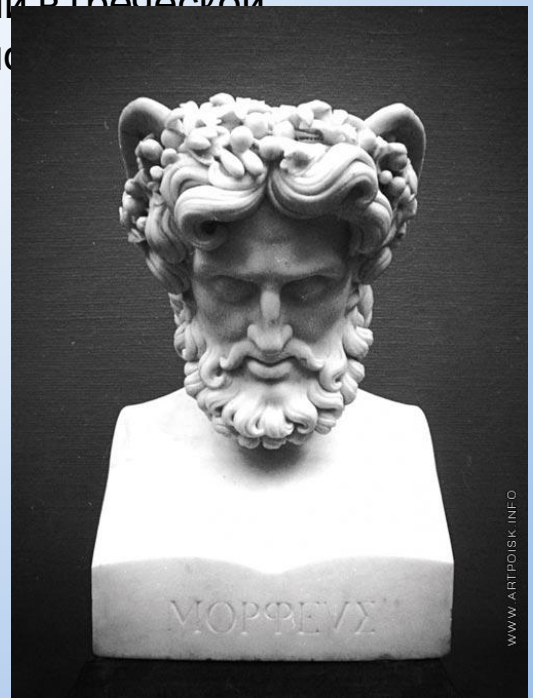
Опий (порошок или настойка) на протяжении тысячелетий широко применялся как противопоносное и обезболивающее средство. В настоящее время он исключен из врачебного применения из-за опасности наркомании и в связи с появлением более эффективных средств.

Морфин

Морфи́н — лекарственное средство, оказывающее анальгезирующее (опиоидное) действие.

В медицине применяют производные морфина, в частности, гидрохлорид (для инъекций) и сульфат (в качестве перорального препарата). Морфин способен эффективно подавлять ощущение сильной физической боли и боли психогенного происхождения. Обладает также седативной активностью, подавляет кашлевой рефлекс.

Слово *морфий* происходит от имени бога сновидений в греческой мифологии — Морфей. Морфей был сыном Гипно



Морфин

Свойства морфина гидрохлорида:

- Белые игольчатые кристаллы или белый кристаллический порошок; слегка желтеющий или сереющий при хранении.
- Медленно растворим в воде, трудно растворим в спирте (1:50). Не совместим со щелочами. Растворы стерилизуют при +100 °С в течение 30 мин, для стабилизации прибавляют 0,1 н. раствор хлористоводородной кислоты до pH 3,0—3,5.
- Температура плавления 254 °С
- Температура воспламенения 261 °С
- Температура самовоспламенения 349 °С
- Удельная теплота сгорания 31031,0 кдж/кг
- Показатель острой токсичности для животных (белые мыши) DL50=150 мг/кг

Морфин

Формы выпуска: таблетки по 0,01 г; 1 % раствор в ампулах и шприц-тюбиках по 1 мл.

Дозировка Морфина гидрохлорида:

Внутрь	Подкожно	Внутривенно	Эпидуральн о	Интратекальн о
1 мг/кг	0,50 мг/кг	0,3 мг/кг	0,1 — 0,05 мг/кг	0.02 — 0.005 мг/кг

Внутрь, дозы подбираются врачом согласно тяжести болевого синдрома и индивидуальной чувствительности.

Морфин

Фармакокинетика:

Морфин чаще назначают внутримышечно, внутривенно, подкожно. Возможно пероральное, ректальное, интратекальное или эпидуральное введение. Морфин быстро и полностью всасывается как при приёме внутрь, так и при подкожном, внутримышечном введении (при в/м введении раствора пролонгированного действия всасывание препарата осуществляется медленно). Примерно 20-40 % морфина связывается с белками плазмы, в основном с альбумином. Проникает через плацентарный барьер (может вызвать угнетение дыхательного центра у плода), определяется в грудном молоке.

При в/м введении 10 мг эффект развивается через 10-30 мин, достигает максимума через 30-60 мин и продолжается примерно 3-4 ч.При в/в введении его эффект развивается лишь немного быстрее, так как задержка наступления эффекта обусловлена низкой жирорастворимостью морфина и его медленным проникновением через гемато-энцефалический барьер (что объясняет и длительную продолжительность действия).

При приёме внутрь эффект развивается через 20-30 мин и длится примерно 4-5 ч (8-12 ч пролонгированной формы). При этом только 10-30 % препарата достигает системного кровотока из-за выраженного эффекта первого прохождения через печень, что требует высоких доз для достижения адекватного обезболивания.[После приёма внутрь пролонгированных форм начало эффекта больше, чем при в/м введении, максимум эффекта — через 60-120 мин. Пролонгированная форма морфина в инъекционном растворе вводится только в/м и обеспечивает быстрое и длительное поступление препарата в кровь из места инъекции. Местнораздражающего действия не оказывает. Длительность действия — 22-24 ч. По сравнению с обычным раствором морфина анальгезирующий эффект пролонгированных форм развивается несколько позже, но продолжается дольше и в меньшей степени вызывает эйфорию, угнетение дыхания и моторики ЖКТ. Пероральные и пролонгированные формы морфина часто применяют для длительного лечения болевого синдрома у онкологических больных.

Действие развивается через 10-30 мин после п/к, 15-60 мин после эпидурального или интратекального введения, 20-60 мин — после ректального введения. При эпидуральном или интратекальном введении эффект однократно принятой дозы продолжается до 24 ч.

Морфин метаболизируется, вступая в реакцию с глюкуроновой кислотой в печени. Скорость печёночного клиренса морфина высока (отношение печёночной экстракции 0,7), поэтому его элиминация может задерживаться при поражениях печени, сопровождающихся замедлением печёночного кровотока. Выводится из организма в основном почками с мочой (85 %)

Морфин

Фармакодинамика:

Морфин угнетает передачу болевых импульсов в ЦНС, снижает эмоциональную оценку боли, вызывает эйфорию (повышает настроение, вызывает ощущение душевного комфорта, благодушия и радужных перспектив вне зависимости от реального положения вещей), которая способствует формированию лекарственной зависимости (психической и физической).

В высоких дозах оказывает сильный снотворный эффект, который более выражен при нарушениях сна, связанных с болевыми ощущениями. Тормозит условные рефлексы, понижает возбудимость кашлевого центра, вызывает возбуждение центра глазодвигательного нерва и n.vagus . Повышает тонус гладкой мускулатуры внутренних органов, вызывает спазм сфинктеров желчевыводящих путей и сфинктера Одди, повышает тонус сфинктеров мочевого пузыря, ослабляет перистальтику кишечника, увеличивает перистальтику желудка, ускоряет его опорожнение.

Супраспинальную анальгезию, эйфорию, физическую зависимость, угнетение дыхания, возбуждение центров n.vagus связывают с влиянием на мю-рецепторы. Стимуляция каппа-рецепторов вызывает спинальную анальгезию, а также седативный эффект, миоз. Возбуждение дельта-рецепторов вызывает анальгезию.

Морфин оказывает тормозящее влияние на условные рефлексы.

Может стимулировать хеморецепторы пусковой зоны рвотного центра и вызывать тошноту и рвоту, что связано с возбуждением хеморецепторных пусковых (триггерных) зон продолговатого мозга. Морфин угнетает рвотный центр, поэтому повторные дозы морфина и рвотные средства, вводимые после морфина, рвоты не вызывают.

Снижает секреторную активность ЖКТ, основной обмен и температуру тела. Угнетает дыхательный и рвотный центры (поэтому повторное введение морфина или применение препаратов, вызывающих рвоту, рвоты не вызывают).

Под влиянием морфина повышается тонус гладкой мускулатуры внутренних органов. Наблюдается повышение тонуса сфинктеров желудочно-кишечного тракта, повышается тонус мускулатуры антральной части желудка, тонкого и толстого отделов кишечника, ослабляется перистальтика, замедляется продвижение пищевых масс, что приводит к развитию запора. Отмечается спазм мускулатуры желчевыводящих путей и сфинктера Одди. Повышается тонус сфинктеров мочевого пузыря. Может увеличиться тонус мускулатуры бронхов с развитием бронхиолоспазма.

Под влиянием морфина тормозится секреторная активность желудочно-кишечного тракта. В связи со стимуляцией выделения антидиуретического гормона возможно уменьшение мочеотделения.

Основной обмен и температура тела под влиянием морфина понижаются.

Характерным для действия морфина является угнетение дыхательного центра. Малые дозы вызывают урежение и увеличение глубины дыхательных движений. Токсические дозы вызывают появление периодического дыхания типа Чейна—Стокса и последующую остановку дыхания.

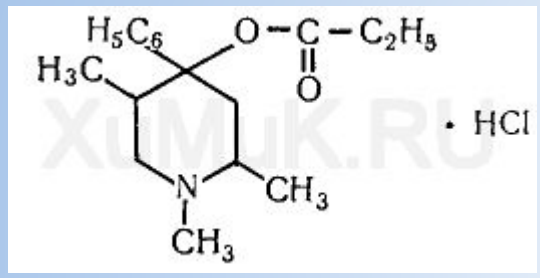
Морфин

Побочные действия:

1) Со стороны пищеварительной системы: тошнота и рвота , запор, сухость во рту, анорексия, спазм желчевыводящих путей, холестаз, гастралгия, спазмы в желудке, гепатотоксичность
2) Со стороны ССС:,снижение АД, тахикардия, брадикардия, повышение АД.
3) Со стороны дыхательной системы: угнетение дыхательного центра, бронхоспазм, ателектаз.
3) Со стороны нервной системы: головокружение, обморок, сонливость, необычайная усталость, общая слабость, головная боль, тремор, непроизвольные мышечные подергивания, дискоординация мышечных движений, парестезии, нервозность, депрессия, спутанность сознания (галлюцинации, деперсонализация), повышение внутричерепного давления с вероятностью последующего нарушения мозгового кровообращения, бессонница, беспокойный сон, угнетение ЦНС.
4) Со стороны мочеполовой системы: снижение диуреза, спазм мочеточников, спазм сфинктера мочевого пузыря, нарушение оттока мочи или усугубление этого состояния при гиперплазии предстательной железы и стенозе мочеиспускательного канала.
5) Аллергические реакции: свистящее дыхание, сыпь кожи лица, кожная сыпь, крапивница, кожный зуд, отек лица, отек трахеи, ларингоспазм, озноб.
6) Местные реакции: гиперемия, отек, жжение в месте инъекции
7) Морфин — опиоидный наркотик, вызывает привыкание. Морфиновая наркомания характеризуется выраженным снижением чувствительности организма, требующего приёма всё больших и больших доз, которые постепенно могут превышать смертельную для здорового человека дозу.

Промедол

Промедол является синтетическим производным фенилпиперидина и представляет собой смесь оптических изомеров.



Промедол обладает сильной анальгезирующей активностью. Он быстро всасывается и действует как при приёме внутрь, так и при парентеральном введении.

Форма выпуска:
Раствор для инъекций 20мг/мл в ампулах 1мл №5х2 и таблетки по 0,025 г

Промедол

По влиянию на ЦНС промедол близок к морфину; он уменьшает восприятие ЦНС болевых импульсов, угнетает условные рефлексы. Подобно другим анальгетикам понижает суммационную способность ЦНС, усиливает анестезирующее действие новокаина и других местных анестетиков. Оказывает снотворное влияние (преимущественно в связи со снятием болевого синдрома). По сравнению с морфином меньше угнетает дыхательный центр, меньше возбуждает центр блуждающего нерва и рвотный центр. Оказывает умеренное спазмолитическое действие на гладкую мускулатуру внутренних органов и вместе с тем повышает тонус и усиливает сокращения мускулатуры матки.

Применяют промедол как болеутоляющее средство при серьезных травмах и различных заболеваниях, сопровождающихся сильными болевыми ощущениями, при подготовке к операциям и в послеоперационном периоде и т. п.

Промедол

Способ применения и дозы:

Промедол назначают подкожно, внутримышечно и, в экстренных случаях, внутривенно. Под кожу и внутримышечно от 0,01 г до 0,04 г (от 1 мл 1 % раствора до 2 мл 2 % раствора). Во время наркоза дробными дозами препарат вводят внутривенно по 0,003г- ,01 г.

При болях, обусловленных спазмом гладкой мускулатуры (печеночная, почечная, кишечная колики), Промедол следует комбинировать с атропиноподобными и спазмолитическими средствами при тщательном контроле за состоянием больного.

Для премедикации перед наркозом вводят под кожу или внутримышечно 0,02 г -0,03 г вместе с атропином (0,0005 г) за 30-40 минут до операции.

Промедол

Побочные действия:

Промедол обычно хорошо переносится. В редких случаях могут быть лёгкая тошнота, иногда головокружение, слабость, ощущение лёгкого опьянения.

Эти явления проходят самостоятельно. Если побочные явления отмечаются при повторном применении препарата, необходимо уменьшить дозу.

При применении промедола возможно развитие привыкания (ослабление действия) и пристрастия.

Фентанил

Фентанил (Phentanylum) — опиоидный анальгетик, мощный агонист μ-опиоидных рецепторов. Выпускается в виде цитрата. Применяется главным образом как анальгетик в анестезиологии. Белый кристаллический порошок. Практически нерастворим в воде. Легко растворим в спир

Фентанил

Фармакодинамика:

Повышает активность антиноцицептивной системы, увеличивает пороги болевой чувствительности. Нарушает передачу возбуждения по специфическому и неспецифическому болевым путям к ядрам таламуса, гипоталамуса, миндалевидному комплексу. Изменяет эмоциональную окраску боли. Оказывает снотворное влияние (преимущественно в связи со снятием болевого синдрома). Вызывает эйфорию. При повторном введении возможно развитие толерантности и лекарственной зависимости. Угнетает дыхательный центр, возбуждает центры блуждающего нерва и рвотный. Повышает тонус гладких мышц желчевыводящих путей, сфинктеров,в т.ч. уретры, мочевого пузыря, сфинктера Одди, уменьшает кишечную перистальтику, улучшает всасывание воды из ЖКТ. Снижает почечный кровоток. В крови нарастает содержание амилазы и липазы.

Фентанил

Фармакокинетика:

Для достижения среднего уровня обезболивания концентрация фентанила должна достигать 15–20 нг/мл. При в/в введении эффект наступает через 1–3 мин, достигает максимума через 5–7 мин и продолжается 20–60 мин, при в/м — через 7–15 мин. С белками крови связывается до 79%. Клиренс составляет 0,4–0,5 л/мин. Быстро перераспределяется из крови и мозга в мышцы и жировую ткань. Биотрансформируется в печени (N-деалкилирование и гидроксилирование), почках, кишечнике и надпочечниках. Выводится с мочой и фекалиями. Проникает в грудное молоко.

Фентанил

Дозировка:

В/в, в/м, местно (трансдермальная система в виде пластыря). Для премедикации и в послеоперационном периоде в/м — по 0,05–0,1 мг, детям — 0,002 мг/кг; для вводного наркоза — в/в 0,1–0,2 мг; нейролептанальгезия — в/в 0,2–0,6 мг (введение повторяют каждые 20 мин); при операциях на открытом сердце — 0,05–0,1 мг/кг. Местно — на 72 ч накладывают на плоскую поверхность кожи Дозу подбирают индивидуально. Пациентам, ранее не принимавшим опиаты, — начальная доза 25 мкг/ч.

Фентанил

Побочные действия:

Гиповентиляция, угнетение дыхания, вплоть до остановки, бронхоспазм, парадоксальная стимуляция ЦНС, спутанность сознания, галлюцинации, кратковременная ригидность мышц, брадикардия, тошнота, рвота, запор, печеночная колика, задержка мочи, амблиопия; пластырь: местные кожные реакции — высыпания, эритема, зуд.

Омнопон

Омнопон (медицинский опиум) — смесь гидрохлоридов алкалоидов опиумного мака. Содержит 48—50% морфина и 32—35% других алкалоидов, таких как кодеин, тебаин, папаверин и наркотин.

Формы выпуска: порошок; 1% и 2% растворы в ампулах по 1 мл и во флаконах по 10 мл.

Порошок от кремового до коричневато-жёлтого цвета. Растворим в воде , трудно растворим в спирте . Водный раствор при взбалтывании сильно пенится.

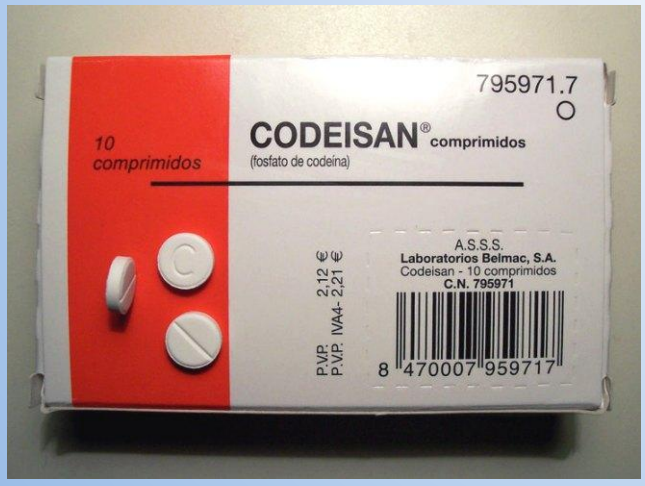
Омнопон

Показания те же, что и для морфина. Назначают внутрь или под кожу. Омнопон иногда лучше переносится, чем морфин, реже вызывает развитие спазмов гладкой мускулатуры. Назначают омнопон в дозе 0,01—0,02 г на приём; под кожу вводят по 1 мл 1% или 2% раствора..

Кодеин

Кодеи́н — 3-метилморфин, алкалоид опиума, используется как противокашлевое лекарственное средство центрального действия, обычно в сочетании с другими веществами. Обладает слабым наркотическим(опиатным) и болеутоляющим эффектом, в связи с чем используется также как компонент болеутоляющих лекарств. В сочетании с ненаркотическими анальгетиками (анальгин, амидопирин), кофеином, фенобарбиталом применяется при головных болях, невралгиях и т. п. Входит в состав микстуры Бехтерева, применяемой в качестве успокаивающего средства.

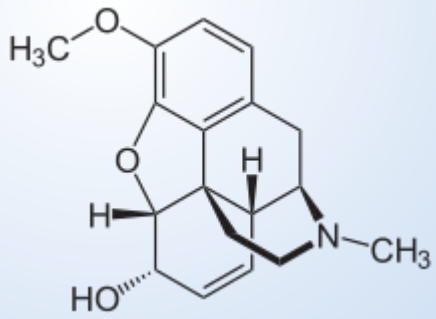
Формы выпуска: порошок и таблетки по 0,008 г (с гидрокарбонатом натрия).



Кодеин

Алкалоид, содержащийся в опии; получается также полусинтетическим путём - метилированием морфина.

По характеру действия кодеин близок к морфину, но болеутоляющие свойства выражены слабее; сильно выражена способность уменьшать возбудимость кашлевого центра. В меньшей степени, чем морфин, угнетает дыхание. Меньше тормозит также деятельность желудочно-кишечного тракта. На некоторых людей оказывает наоборот, возбуждающее действие, с сильно выраженной бессонницей.



Кодеин

Фармакодинамика:

Противокашлевое средство центрального действия; алкалоид фенантренового ряда. Центральный противокашлевой эффект связан с подавлением кашлевого центра. Анальгетическая активность обусловлена возбуждением опиатных рецепторов в различных отделах центральной нервной системы и периферических тканях. В меньшей степени, чем морфин, угнетает дыхание, реже вызывает миоз, тошноту, рвоту и запоры. Анальгетический эффект развивается через 10-45 мин после внутримышечного и подкожного введения и через 30-60 мин после перорального введения. Максимальный эффект достигается через 30-60 мин после внутримышечного введения и через 1-2 ч после перорального. Продолжительность анальгезии — 4 ч, блокады кашлевого рефлекса — 4-6 ч.

Кодеин

Фармакокинетика:

После приёма внутрь быстро всасывается. Связь с белками плазмы — 30 %. Метаболизируется в печени до активных метаболитов, 10 % путём деметилирования переходит в морфин. Выводится почками и с жёлчью.

Кодеин

Дозировка:

Внутрь при болях — 15-60 мг каждые 3-6 ч, при диарее — 30 мг 4 раза в сутки, при кашле — 10-20 мг 4 раза в сутки.

Кодеин

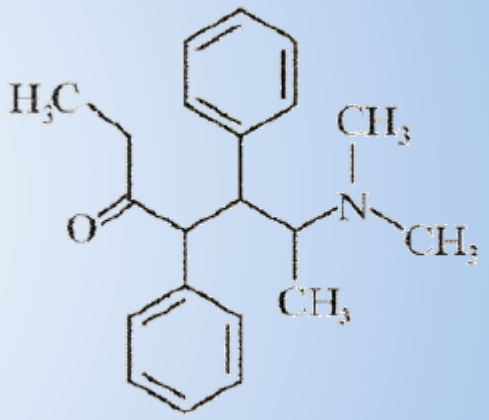
Побочные действия:

1) Со стороны пищеварительной системы: запор, сухость во рту, анорексия, тошнота, рвота, гастралгия, спазмы в ЖКТ, спазм желчевыводящих путей, паралитическая кишечная непроходимость, токсический мегаколон, гепатотоксичность
2) Со стороны нервной системы и органов чувств: сонливость, головокружение, головная боль, усталость, нервозность, спутанность сознания, нечёткость зрительного восприятия, беспокойный сон, кошмарные сновидения, судороги, депрессия, ригидность мышц , тремор, непроизвольные мышечные подёргивания, частота неизвестна — звон в ушах, ухудшение координации движений глазных яблок с нарушением зрения, повышение тонуса гладкой мускулатуры,
3) Со стороны ССС: аритмии (тахи- или брадикардия), снижение/повышение АД
4) Со стороны дыхательной системы: ателектаз, угнетение дыхательного центра.
5) Со стороны мочевыводящей системы: снижение диуреза, спазмы мочеточников, атония мочевого пузыря.
6) Аллергические реакции: кожная сыпь, крапивница, кожный зуд, отёк лица, бронхоспазм, отёк гортани, ларингоспазм.

Метадон

Метадо́н — синтетический лекарственный препарат из группы опиоидов, применяемый как анальгетик, а также при лечении наркотической зависимости.

Метадон применяется в ряде стран в заместительной терапии употребления «тяжёлых» наркотиков как заместитель героина («метадоновая программа»)



метадон

Метадон

При терапевтических дозах метадон проявляет анальгезирующее и седативное действие. Он воздействует на ЦНС, ССС и гладкую мускулатуру. Эффект наступает спустя 20—30 минут после перорального приема. Анальгезирующее действие проявляется через 4—6 часов.

Метадон действует от 24 до 72 часов, в зависимости от дозы и индивидуального метаболизма. Толерантность к метадону развивается медленно. Наркотический потенциал и длительность эйфорического эффекта сопоставимы с известными для морфина.

Побочные эффекты: расслабление, потливость, головокружение, тошнота, рвота.

При передозировке отмечается угнетение дыхания, подавление кровообращения (гипотензия и брадикардия) вплоть до остановки сердечной деятельности, кардиогенный и некардиогенный отёк легких, спазм сфинктера мочевого пузыря, миоглобинурия и острая почечная недостаточность нарушение сознания вплоть до комы.

Симптомы хронического использования: расслабление, подавление дыхания, гипергликемия, повышениетемпературы и давления, брадикардия, запоры, сп азмы желчных протоков. В ряде случаев с ним связывают клинические эффекты, включающиегенерализованные боли и бессонницу. В процессе сна возможна остановка сердца. Нередки, при случайных передозировках, коматозные состояния с летальными исходами.

Агонисты – антагонисты (частичные агонисты):

Агонисты-антагонисты опиатных рецепторов блокируют μ- (мю)- и стимулируют к- (каппа) и δ- (дельта)-опиатные рецепторы, что сопровождается анальгезирующим действием.

Пентазоцин

Пентазоцин — синтетическое соединение, содержащее бензоморфановое ядро молекулы морфина, но лишённое кислородного мостика и третьего шестичленного ядра, свойственных соединениям группы морфина. Применяют при острых болях препарат вводят парентерально, при хронических болях внутрь.

Пентазоцин

Пентазоцин

Фармакокинетика:

Препарат получен по принципу модификации молекулы морфина Он обладает анальгетической активностью, хотя в несколько меньшей степени, чем морфин, но меньше угнетает дыхание, реже вызывает запор и задержку мочеиспускания Пентазоцин хорошо всасывается при приеме внутрь и парентеральном введении Пик концентрации в плазме крови наблюдается через 15 мин -1 ч после внутримышечного введения и через 1-3 ч после приема внутрь Период полувыведения составляет 2-3 ч

Пентазоцин

Способ дозирования:

- При приеме внутрь по 25-100 мг каждые 3-4 ч после еды.
- П/к или в/м - по 30-60 мг каждые 3-4 ч; при в/в введении разовая доза - до 30 мг. *Максимальные дозы:* при п/к или в/м введении разовая доза - 60 мг, суточная - 360 мг; при в/в введении разовая доза - 30 мг.

Пентазоцин

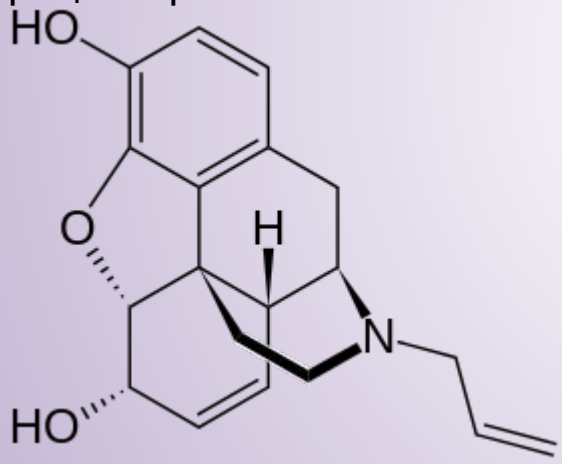
Побочные действия:

- Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: сонливость, слабость, головокружение, нарушение ясности мышления; возможны дисфория, головная боль, дезориентация, кошмарные сновидения, нарушения четкости зрения, миоз, ухудшение способности фокусировать зрение, бессонница, галлюцинации, тремор, парестезии, судорожные припадки, увеличение внутричерепного давления.
- Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота; возможны запор, сухость во рту, спазм желчных путей, боли в животе.
- Со стороны сердечно-сосудистой системы: возможны артериальная гипертензия, тахикардия; редко - артериальная гипотензия.
- Со стороны дыхательной системы: возможно угнетение дыхания.
- Дерматологические реакции: возможны дерматит, зуд.
- Аллергические реакции: возможны отек лица; редко - токсический эпидермальный некролиз.
- Местные реакции: возможны инфильтрация тканей, ухудшение состояния кожи в местах инъекций.
- Прочие: возможно усиление потоотделения, задержка мочи.

Налорфин

Налорфин (Nalorphini hydrochhloridum — N-аллилнорморфина гидрохлорид) — агонист-антагонист опиоидных рецепторов.

По химическому строению налорфин близок к морфину . Относительно небольшая модификация структуры морфина привела к получению соединения, оказавшегося не только агонистом, но и антагонистом по отношению к опиатным рецепторам.



Белый или белый со слегка желтоватым оттенком кристаллический порошок (на воздухе и на свету темнеет). Легко растворим в воде, трудно — в спирте.

Форма выпуска: 0,5 % раствор в ампулах по 1 мл и 0,05 % раствор в ампулах по 0,5 мл.

Налорфин

Налорфин оказывает анальгетический эффект, однако в значительно меньшей степени, чем морфин. Как антагонист он ослабляет угнетение дыхания, понижение артериального давления. Аритмии сердца и другие изменения в деятельности организма, которые могут вызываться морфином и его аналогами, снимаются налорфином. Налорфин уменьшает также аналгезирующее действие морфина и других наркотических аналгетиков и их влияние на тонус гладкой мускулатуры.

Введение налорфина обычно не сопровождается побочными явлениями. Большие дозы могут обусловить тошноту, миоз, сонливость, головную боль, психическое возбуждение.

Налорфин

Способ дозирования:

Вводят в/в, в/м или п/к. Наиболее эффективно в/в введение.

При в/в разовая доза составляет по 5-10 мг. При недостаточной эффективности инъекции повторяют с интервалом 10-15 мин. Общая доза - не более 40 мг.

Антагонисты

Антагонисты - это препараты, не обладающие или имеющие очень слабую истинную активность, противодействующие **агонистам**, предотвращая их доступ к рецепторам

Совместное введение частичных и полных агонистов снижает (антагонизирует) эффект действия полных агонистов.

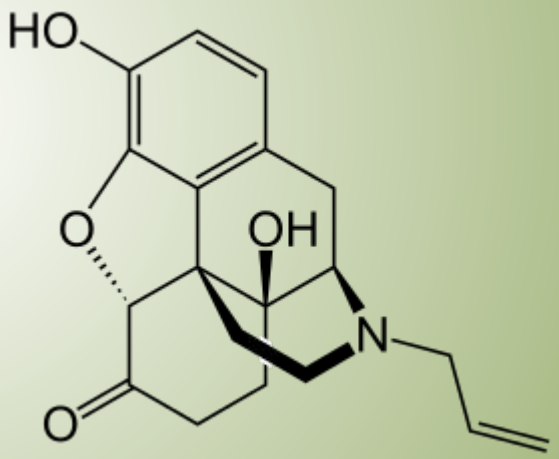
Налоксон

Налоксон — антагонист опиоидных рецепторов, применяется как антидот при передозировках опиоидов.

По химической структуре налоксон близок к налорфину.

Налоксон входит в перечень жизненно необходимых и важнейших лекарственных препаратов.

Форма выпуска: в ампулах по 1 мл; в коробке 10 ампул.



Налоксон

Фармакокинетика:

При в/в введении эффект проявляется в течение первых 2 мин, при в/м и п/к — через несколько минут и продолжается 20–45 мин после в/в введения и 2,5–3 ч после в/м или п/к введения. Метаболизируется в печени, выводится почками.

Налоксон

Способ применения и дозы:

В/в медленно (в течение 2–3 мин), *в/м* или *п/к.*

При отравлении опиоидными анальгетиками: начальная доза — 0,4 мг, при необходимости повторно с интервалами 3–5 мин до появления сознания и восстановления спонтанного дыхания

Для ускорения выхода из хирургического наркоза: 0,1–0,2 мг (1,5 –3 мкг/кг) каждые 2–3 мин до появления адекватной легочной вентиляции и пробуждения больного

- *При депрессии дыхания у новорожденных, вызванной введением наркотических анальгетиков во время родов:*0,1 мг/кг в/м, п/к или в/в, впоследствии возможно профилактическое введение в дозе — 0,2 мг (0,06 мг/кг) в/м.
- *С целью диагностики опиоидной наркомании:* 0,8 мг в/в.

Побочные действия:

Резкое прерывание состояния наркотической депрессии, вызванное введением налоксона, может сопровождаться тошнотой, рвотой, усиленным потоотделением, тахикардией, повышением давления, дрожью, судорогами, остановкой сердечной деятельности.

Список литературы: