

ФГБОУ ВО

Башкирский государственный медицинский университет
Министерства здравоохранения Российской Федерации

Ненаркотические анальгетики

Преподаватель: к.м.н. доцент Хайрзаманова Ксения Александровна

Что такое анальгезия ?

- Анальгезия (аналгезия, аналгия, от лат. analgesia, analgia — дословно «без боли») — уменьшение болевой чувствительности (в том числе избирательное, когда другие виды чувствительности не затрагиваются) с помощью фармакологических препаратов различных групп (наркотические анальгетики, неопиодных препаратов, спазмолитики и др.), хирургических методов (нейротомия), физиотерапевтического воздействия.



Неопиоидные препараты с анальгетической активностью.

- Интерес к неопиоидным анальгетикам в основном связан с поиском эффективных болеутоляющих средств, не вызывающих наркоманию. В настоящем разделе выделены 2 группы веществ. Первая - это неопиоидные препараты, которые в основном применяют в качестве болеутоляющих веществ (ненаркотические анальгетики центрального действия). Вторая группа представлена разнообразными лекарственными средствами, у которых наряду с основным эффектом (психотропным, гипотензивным, противоаллергическим и др.) имеется и достаточно выраженная анальгетическая активность.



Классификация по химическому составу.

- А. Препараты, преимущественно периферического действия
 - 1. Производные салициловой кислоты: Ацетилсалициловая кислота (аспирин) Салицилаты
 - 2. Производные пиразолона: Анальгин (метамизол), Бутадион, Амидопирин
- Б. Препараты центрального действия
 - 3. Производные анилина: Парацетамол



Классификация НПВС

Избирательные ингибиторы ЦОГ-1 (во всех органах)	- АСК (в малых дозах, до 300 мг/сут, действует как антиагрегант)
Неизбирательные ингибиторы ЦОГ-1 и ЦОГ-2	- Производные салициловой (орто - оксибензойной) кислоты Кислота ацетилсалициловая - Производные антраниловой (орто - аминобензойной) кислоты К-та мефенамовая и флуфенамовая - Производные индолуксусной к-ты Индометацин - Производные фенилуксусной к-ты Диклофенак-Na - Производные фенилпропионовой к-ты Ибупрофен - Производные нафтилпропионовой к-ты Напроксен - Оксикамы Пироксикам , Лорноксикам
Избирательные ингибиторы циклооксигеназы – 2 (ЦОГ-2)	- Целекоксиб - Рофекоксиб

Механизм обезболивающего действия неопиоидных анальгетиков складывается из двух компонентов:

- **периферический компонент:** обусловлен угнетением синтеза простагландинов (блокада фермента циклооксигеназы (ЦОГ), участвующих в формировании воспалительной реакции любого характера. В основном этот механизм характерен для препаратов из группы производных салициловой кислоты и пиразолона;
- **центральный компонент:** по-видимому, связан с угнетающим действием препаратов на синтез в структурах ЦНС специфических простагландинов, участвующих в качестве модуляторов в регуляции некоторых функций ноцецептивной системы. Такой механизм более характерен для производных пара-аминофенола (они практически не обладают противовоспалительным действием).

Простагландины

- Основные эффекты неопиоидных анальгетиков связаны с их способностью тормозить синтез простагландинов – веществ, обладающих высокой биологической активностью. .

Простагландины – сильные вазодилататоры и противовоспалительные вещества которые вызывают гиперемию, отёк, боль, связанных с тканевым повреждением Кроме противовоспалительного действия, простагландины обладают различными другими периферическими и центральными физиологическими действиями: вазодилатация ,увеличение капиллярной проницаемости , воспалительный ответ, агрегация тромбоцитов.

- Схема образования простагландинов

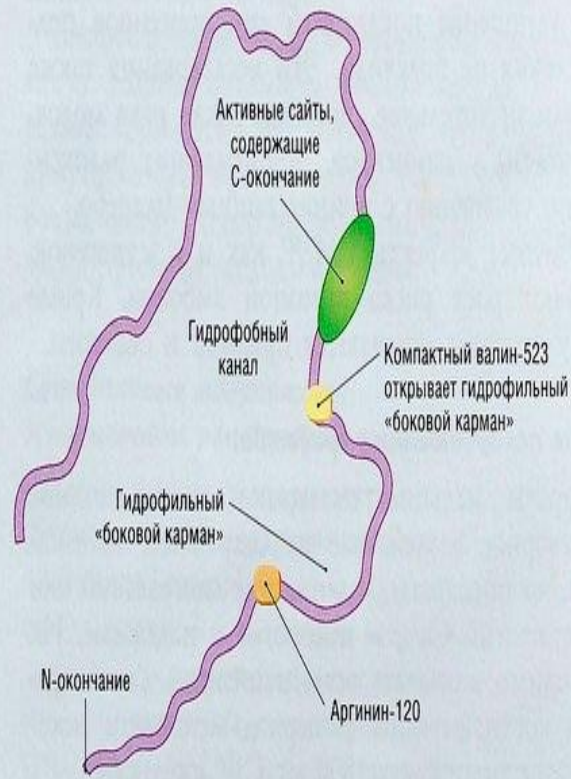


ЦОГ

цог-1



цог-2



- Простагландины образуются из арахидоновой кислоты под влиянием фермента циклооксигеназы (ЦОГ). Известны два типа этого фермента: ЦОГ-1 и ЦОГ-2.
- ЦОГ-1 обеспечивает синтез простагландинов, которые выполняют регуляторную функцию во многих тканях организма (участвуют в регуляции кровообращения, функций желудочно-кишечного тракта, почек, матки и других органов).
- Под влиянием ЦОГ-2 при повреждении и воспалении образуются простагландины, которые стимулируют воспалительный процесс, повышают проницаемость сосудов, усиливают чувствительность болевых рецепторов.



ОСНОВНЫЕ ЭФФЕКТЫ



Противовоспалительный эффект



Анальгезирующий эффект



Жаропонижающий эффект

Фармакологические эффекты НПВС:

1. Противовоспалительное действие
Механизм: ингибирование ЦОГ → уменьшение продукции простаноидов.
2. Анальгетическое действие
Механизм: угнетение синтеза простагландинов
снижение гиперальгезии.
3. Жаропонижающее действие
Механизм: угнетение синтеза простагландинов
уменьшение их пирогенного действия на центр терморегуляции (в гипоталамусе).

Противовоспалительный эффект

НПВС подавляют преимущественно фазу экссудации. Наиболее мощные препараты – индометацин, диклофенак, фенилбутазон – действуют также на фазу пролиферации (уменьшая синтез коллагена и связанное с этим склерозирование тканей), но слабее, чем на экссудативную фазу. На фазу альтерации НПВС практически не влияют.

Анальгезирующий эффект

Анальгетический эффект возникает через 0,5 – 2 часа и является, в основном, следствием ведущего противовоспалительного действия. Кроме периферического компонента болеутоляющего действия, у ННА имеется и центральный механизм, который связан с их влиянием на таламические центры, торможение которых приводит к ослаблению проведения импульсов к коре головного мозга, а также препятствуют повышению концентрации простагландинов в спинномозговой жидкости, что тормозит развитие вторичной гиперальгезии. При этом они не влияют на опиатную систему мозга, не вызывают психическую и физическую зависимость.

Жаропонижающий эффект



Снижают температуру тела (0,5-2ч), только если она повышена, т.е. при лихорадке, и связан с ингибированием синтеза простагландинов в центре терморегуляции в гипоталамусе.

Препарат парацетамол

Парацетамол. (лат. Paracetamolium, англ. Paracetamol, также ацетаминофен) — лекарственное средство, оказывающее жаропонижающее и обезболивающее действие

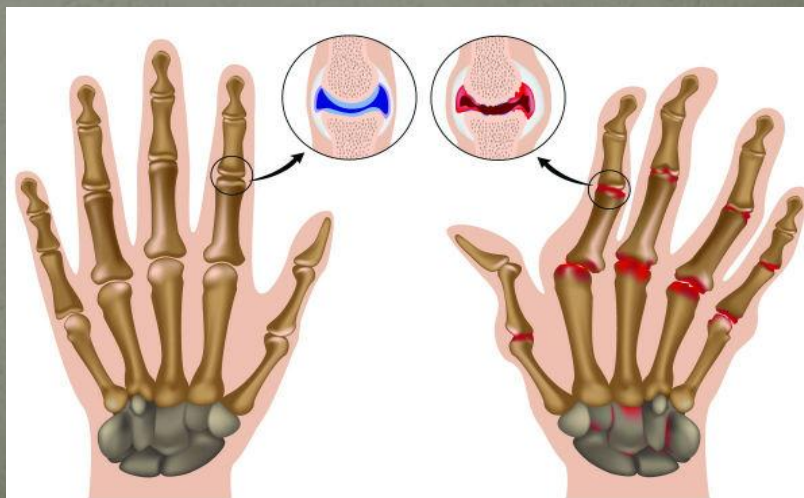


● **Лекарственная форма** :капсулы, порошок шипучий для приготовления раствора для приема внутрь [для детей], раствор для инфузий, раствор для приема внутрь [для детей], сироп, суппозитории ректальные, суппозитории ректальные [для детей], суспензия для приема внутрь, суспензия

- ***Противопоказания*** : Вирусный гепатит, алкогольное поражение печени, алкоголизм, беременность, период лактации, пожилой возраст, ранний грудной возраст (до 3 мес).
- ***Фармакологическое действие*** :
Ненаркотический анальгетик, блокирует ЦОГ1 и ЦОГ2 преимущественно в ЦНС, воздействуя на центры боли и терморегуляции.
- ***Побочные действия***: кожный зуд, сыпь на коже и слизистых оболочках , токсический эпидермальный некролиз , гипогликемия , анемия

Основные показания к применению

1. Воспалительные заболевания соединительной ткани – все НПВС, кроме бен-гея.
2. Миалгии. радикулит, бурситы - все НПВС, кроме этодолака, набуметона, диклокаина и целекоксиба.
3. Головная боль - АСК, лизина ацетилсалицилат, мефенамовая кислота, копацил.
4. Послеоперационный болевой синдром - диклофенак натрия, тиапрофеновая кислота, нифлумовая кислота, клофезон, нимесулид, этодолак, кеторолак.
5. Боли при травматическом повреждении - диклофенак, лизина ацетилсалицилат, кетопрофен, пироксикам, нифлумовая кислота, индометацин, этодолак, кеторолак.
6. Артриты - целекоксиб, все, кроме АСК и лизина ацетилсалицилата.
7. Остеоартроз - диклофенак, мелоксикам, клофезон, этодолак, нимесулид, индометацин.
8. Гипертермия - АСК, лизина ацетилсалицилат, мефенаминовая кислота, нифлумовая кислота, нимесулид, копацил.



Здоровый сустав

Ревматоидный артрит

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

НПВС противопоказаны при эрозивно-язвенных поражениях желудочно-кишечного тракта, особенно в стадии обострения, выраженных нарушениях функции печени и почек, цитопениях, индивидуальной непереносимости, беременности. При необходимости, наиболее безопасными (но не перед родами!) являются небольшие дозы аспирина.

Индометацин и фенилбутазон не следует назначать амбулаторно лицам, профессии которых требуют повышенного внимания.

СПАСИБО ЗА ВНИМАНИЕ!