

# Opioidní analgetika

Opioidní analgetika (dříve opiáty – látky odvozené od opia, či narkotika – látky způsobující spánek<sup>[1]</sup>) mají velice silný analgetický účinek. Tlumí viscerální bolesti, potlačují psychickou složku a emotivní reakci na bolest. Působí centrálně, supraspinálně. Účinek mají analgetický a antitusický. Hlavním představitelem je **morfin**. Může se na nich vytvořit závislost.

## Struktura

Podle struktury rozlišujeme **2 skupiny opioidů**<sup>[1]</sup>:

1. odvozené od molekuly morfinu, která vyskytuje v opiu, zaschlé šťávě z makovic máku setého<sup>[2]</sup>
  - přirozené opioidy (alkaloidy) – morfin, kodein
  - polosyntetické alkaloidy – diacetyl-morfin (heroin), hydromorfon, oxycodon
2. syntetické (odvozené od molekuly fenylpiperazinu) – petidin, fentanyl, megafon

V lidském těle vznikají **endogenní opioidy** mezi něž patří endorfiny, enkefaliny, dynorfin a endomorfiny.<sup>[1]</sup> Ty vznikají v nervové tkáni z prekursorů<sup>[3]</sup>:

- *pre-POMC* (pre-pro-opiomelanokortin) – z něho vzniká β-endorfin, ACTH a MSH (melanocyty stimulující hormon)
- *pre-pro-enkefalin A* – z něho vzniká met-enkefalin a leu-enkefalin
- *pre-pro-enkefalin B* – z něho vzniká dynorfin a neo-endorfin

Dalším opioidním peptidem je *nociceptin*, který je podobný dynorfinu a ovlivňuje vnímání bolesti, ale nereaguje s některým ze známých opioidních receptorů.

## Farmakodynamika

Opioidy působí na 3 druhy opioidních receptorů:  $\mu$ ,  $\kappa$  a  $\delta$ . Podle afinity jednotlivých opioidů k receptorům je můžeme dělit následovně<sup>[1]</sup>:

1. agonisté – morfin, petidin, oxycodon atd.;
2. parciální agonisté – buprenorfin;
3. agonisté-antagonisté
4. antagonisté – naloxon.

### Účinky na CNS:

- analgetikum;
- zklidnění – odstranění napětí a strachu;
- euforie – vnitřní blaženost – vede k závislosti;
- dysforie –  $\kappa$  (*pentazin*) špatné nálady, noční můry – *pentazocin* (psychotomimetické účinky);
- ospalost, obluzení – „oblbovačka“ – premedikace před operací. Při předávkování až bezvědomí (útlum dechu, anestezie);
- respirace – snižují citlivost respiračního centra na  $\text{CO}_2$  (typicky *fentanyl*) útlum dýchání – monitorace oxymetrem;
- antitusické – léčebně *kodein*, (pro rizika opioidů se využívají antitusika bez centrálního účinku – *butamirát*, *dropropizin*).
- nausea/zvracení – častým vedlejším účinkem je zvracení vlivem na oblast v prodloužené míše – mizí po opakovaném podávání či s přídatkem antiemetik;
- mióza – je také marker intoxikace opioidy (krom *pethidinu*);
- neuroendokrinní – zvýšená sekrece ADH, PRL, STH, snížená sekrece FSH, LH.

### Periferní účinky OA:

- GIT – zvyšují tonus hladkých svalů, zpomalují střevní pasáž, uzavírají sfinktery (způsobují spastickou obstipaci);
- KVS – při infarktu myokardu nutno rozlišit opioid, neboť morfin vyplaví histamin, což způsobí hypotenzi, lepší je fentanyl (má lepší hemodynamiku);
- snížení tonu dělohy a děložní motility – zpomalí porod;
- snížení pohybu řasinek epitelu (tuba, bronchy);
- bronchokonstrikce – vyplavením histaminu;
- svalová rigidita – fentanyl – JIP s ventilací;
- prostupují do mateřského mléka (kojenci OA nedokážou metabolizovat)
- průnik placentární bariérou – modré děti (deprese dýchání).

## Principy podávání



1% morfin k intravenóznímu podání



12,5mcg/h fentanylová transdermální náplast

1. U akutní bolesti je indikována intravenózní forma, u chronické bolesti pak perorální.
2. Titrační podávání od nejmenších dávek.
3. Zahájení léčby znamená testování opioidu na danou bolest.
4. Podání antiemetik v prvních dnech, obstipací léčba a laxativa.
5. Maximální dávka neexistuje u nádorové bolesti. U chronické nenádorové bolesti se vyšší dávky než 180-200 mg morfinu neosvědčily.
6. Při rozvoji NÚ nebo oslabení účinku se převádí na jiný opioid.<sup>[1]</sup>

## Nežádoucí účinky

- útlum dýchání – nejobávanější komplikace;
- nauzea, zvracení;
- závratě;
- deprese;
- svědění;
- zácpa;
- zvýšený tlak v žlučových cestách;
- retence moči;
- hypotenze
- vzestup tolerance – potřeba zvýšit dávky, aby se udržel původní účinek.

## Zástupci

1. Slabé opioidy – může se u nich uplatnit stropový efekt (další zvyšování dávky nevede ke zvýšení účinku)
  - Kodein – slabší účinky (podáván v kombinaci s paracetamolem), slouží jako antitusikum;
  - Tramadol
  - Dihydrokodein
  - Pentazocin
  - Nalbufin
2. Silné opioidy – pro silné neztížitelné bolesti
  - Morfin
  - Pethidin
  - Hydromorfon
  - Oxykodon
  - Buprenorfin
  - Piritramid
  - Methadon – jen jako substituční léčba psychické závislosti. <sup>[1]</sup>



Tramadol k perorálnímu podání

## Přepočet dávky a výpočet další dávky

Tento prvek vyžaduje JavaScript.

## Odkazy

### Související články

- Ekvianalgetické dávky opioidů
- Opioidy (pediatrie)
- Abúzus opioidů
- Poruchy vyvolané užíváním opioidů

### Externí odkazy

- **AKUTNE.CZ** Léčba akutní pooperační bolesti – interaktivní algoritmus + test (<http://www.akutne.cz/index.php?p=g=vyukove-materialy--rozhodovaci-algoritmy&tid=82>)

### Reference

1. LEJČKO, Jan. Přehled opioidních analgetik. *Prakt. lékař* [online]. 2009, roč. 4, s. 172-175, dostupné také z <<http://www.praktickelekarenstvi.cz/pdfs/lek/2009/04/05.pdf>>. ISSN 1803-5329.
2. HERDEGEN, Thomas. *Kurzlehrbuch Pharmakologie und Toxikologie : 328 Tabellen*. 2.. vydání. Thieme, 2010. 535 s. s. 253. ISBN 9783131422927.
3. KOLEKTIV AUTORŮ POSTGRADUÁLNÍ MEDICÍNA,. Opioidní analgetika. *Postgraduální medicína* [online]. 2006, roč. 4, s. 395, dostupné také z <<https://web.archive.org/web/20160331222721/http://zdravi.e15.cz/clanek/postgradualni-medicina/opioidni-analgetika-264351>>. ISSN 1212-4184.

## Použitá literatura

- HYNIE, Sixtus. *Farmakologie v kostce*. 2. vydání. Praha : Triton, 2001. 520 s. ISBN 80-7254-181-1.
- Zdraví E15. *Opioidní analgetika* [online]. Mladá fronta a. s., ©2006. [cit. 2014-03-03]. <<https://web.archive.org/web/20160331222721/http://zdravi.e15.cz/clanek/postgradualni-medicina/opioidni-analgetika-264351>>.