**ЛЕКЦИЯ 1 Анальгетики** **1. Анальгезирующие средства.**

**Анальгезирующие средства**– это лекарственные препараты, избирательно устраняющие болевую чувствительность или ослабляющие чувство боли.

**Наркотические анальгетики**

Анальгетики делят на две основные группы:

1) наркотические анальгетики;

2) ненаркотические анальгетики.

Наркотические анальгетики. Это препараты морфина и его синтетические заменители. Основной механизм действия: связь с опиатными рецепторами ЦНС и периферическими тканями, приводящая к стимуляции противоболевой системы и нарушению нейронной передачи болевых импульсов; оказание специфического влияния на ЦНС человека, выражающееся в развитии эйфории, а затем синдромов психической, физической зависимости и привыкания.

**Морфина гидрохлорид**(*Morphini hydrochloridum*).

Активный анальгетик.

**Применение:**боль различной этиологии. Принимают внутрь по 0,01—0,02 г, вводят п/к по 1 мл 1 %-ного раствора. В. Р. Д. – 0,02, В. С. Д. – 0,05 г.

**Побочные действия:**тошнота, рвота, запор, угнетенное дыхание.

**Противопоказания:**дыхательная недостаточность, возможность развития наркомании.

**Форма выпуска:**ампулы по 1 мл 1 %-ного раствора № 10. Список А.

**Промедол**(*Promedolum*).

Синтетический препарат, близкий к морфину, но меньше угнетает дыхательный центр и возбуждает центр блуждающего нерва, рвотный центр.

**Применение:**боль различной этиологии. Вводят п/к по 1 мл 1–2 %-ного раствора; принимают внутрь по 0,025—0,05 г на прием.

**Форма выпуска:**порошки, таблетки по 0,025, ампулы и шприц-тюбики по 1 мл 1–2 %-ного раствора.

**Омнопон**(*Omnoponum*) – смесь алкалоидов опия, в том числе 50 %-ного морфина.

**Действие, применение, побочное действие, противопоказания:**такие же, как и у морфина.

**Способ применения:**вводят п/к по 1 мл 1–2 %-ного раствора, принимают внутрь – по 0,01—0,02 г.

**Форма выпуска:**ампулы по 1 мл 1–2 %-ного раствора № 10. Список Б.

**Валорон**(*Valoron*).

Синоним: *Tilidinum*. Синтетический заменитель морфина центрального действия.

**Применение:**выраженный болевой синдром различного генеза. Принимают по 50—100 мг 4 раза в сутки. Суточная доза – 400 мг.

**Побочные действия:**головокружение, тошнота, рвота, ослабление внимания, замедление реакции.

**Противопоказания:**наркотическая зависимость, лактация.

**Форма выпуска:**капсулы по 50 мг № 10 и 20.

К этой группе относятся еще и следующие препараты: кодеин (*Codeinum*), кодеина фосфат (*Codeini Phosphas*) (оба препарата применяются для успокоения кашля), этилморфина гидрохлорид (*Aethylmorphini hydrochloridum*) – в основном в офтальмологии в виде глазных капель и мази.

**2. Фентанил. Антагонисты наркотических анальгетиков**

**Фентанил**(*Phentanylum*).

Оказывает сильное, быстрое, но короткое анальгезирующее действие.

**Применение:**для нейролептаналгезии в сочетании с нейролептиками; для снятия острых болей при инфаркте миокарда, стенокардии, почечных и печеночных коликах.

Вводят в/м или в/в 0,5–1 мл 0,005 %-ного раствора. При необходимости повторяют каждые 20–40 мин.

**Побочные действия:**возможно угнетение дыхания, устраняемое в/в введением налорфина, двигательное возбуждение, спазм, гипотония, синусовая тахикардия.

**Противопоказания:**операция кесарево сечение; выраженная гипертензия, угнетение дыхательного центра.

**Форма выпуска:**ампулы по 2 мл 0,005 %-ного раствора. Список А.

**Антагонисты наркотических анальгетиков.**

**Налорфина гидрохлорид**(*Nalorphini hydrochloridum*).

Антагонист по отношению к морфину и другим опиатам, но сохраняет в определенной степени свойства морфина.

**Применение:**как антидот при резком угнетении дыхания и других нарушениях функций организма, вызванных острым отравлением при передозировке наркотических анальгетиков. Вводят в/в, в/м или п/к. Взрослым по 0,005—0,01 г (1–2 мл 0,5 %-ного раствора).

**Побочные действия:**при больших дозах возможны тошнота, сонливость, головная боль, психическое возбуждение. У наркоманов – приступ абстиненции.

**Форма выпуска:**порошок; 0,5 %-ный раствор в ампулах по 1 мл (для взрослых) и 0,05 %-ный раствор – для новорожденных.

**Налоксон**(*Naloxone*).

**Применение:**такое же, как у налорфина гидрохлорида. Вводят п/к, в/м, в/в 0,4 мг, при недостаточном эффекте вводят повторно в той же дозе через 2–3 мин.

**Побочные действия:**тахикардия, тошнота, рвота, гипотония.

**Форма выпуска:**раствор для инъекций: 1 мл – 0,4 мг налоксона.

**3**

**ЛЕКЦИЯ 2. Ненаркотические анальгетики.**

**Производные пирозолона и парааминофенола**

Ненаркотические анальгетики – это препараты различного химического строения, обладающие обезболивающим, жаропонижающим и противовоспалительным действием. Механизм анальгезирующего эффекта: угнетение синтеза основных факторов воспалительной реакции (простагландинов, простациклинов и тромбоксана), нарушение проведения афферентных болевых импульсов к коре головного мозга.

**Производные пирозолона.**

Среди препаратов этой группы известны бутадион (*Butadinum*), анальгин (*Analginum*), амидопирин (*Amidopyrinum*), антипирин (*Antipyrinum*), кетазон (*Cetazon*) и тандедрил (*Tandedril*). Механизм действия: снижение энергообеспечения воспаления, угнетение активности протеолитических ферментов, уменьшение проницаемости капилляров и торможение воспалительной инфильтрации.

**Анальгин**(*Analginum*).

Обладает жаропонижающим, анальгезирующим и противовоспалительным действием.

**Применение:**боли различного происхождения, ревматизм, хорея. Принимают по 0,25—0,5 г 2–3 раза в день внутрь, при ревматизме – 0,5–1,0 г 3 раза в день. В/м вводят по 1–2 мл 50 %-ного раствора 2–3 раза в день.

**Побочные действия:**возможны аллергические реакции и анафилактический шок.

**Форма выпуска:**таблетки по 0,5 г № 10, порошок, ампулы по 1 и 2 мл 50 %-ного раствора.

Анальгин входит в состав некоторых комбинированных препаратов: бенальгина (*Benalginum*), беллалгина (*Bellalginum*), темпальгина (*Tempalginum*), анапирина (*Anapyrinum*), пенталгина (*Pentalginum*).

**Бутадион**(*Butadionum*).

**Применение:**как у анальгина. Принимают внутрь по 0,15 г 4–6 раз в сутки после еды. Мазь наносят тонким слоем, не втирая, на поверхность кожи 2–3 раза в сутки.

**Побочные действия:**тошнота, боль в области желудка, болезни печени и почек, аритмия, недостаточность кровообращения.

**Форма выпуска:**таблетки по 0,05 № 10; мазь – 20 г в тубе.

**Производные парааминофенола.**

К ним относятся препараты фенацетин (*Phenacetinum*) и парацетамол (*Paracetamolum*).

Широко применяется парацетамол. Фенацетин в чистом виде практически не используется, а в смеси с другими средствами это – препараты седальгин, цитрамон.

**Парацетамол**(*Paracetamolum*).

Синонимы: *Acetaminophen, Panadolum, Efferalganum*. Жаропонижающее и болеутоляющее.

**Применение:**как у других препаратов, по 0,2–0,4 на прием.

**Побочные действия:**нефротоксичен.

**Противопоказания:**заболевания почек.

**Форма выпуска:**таблетки по 0,2 № 10.

**4. Нестероидные противовоспалительные средства**

Механизм действия: оказывают нормализующее влияние на повышенную проницаемость капилляров и на процессы микроциркуляции, таким образом уменьшая энергетическое обеспечение биохимических процессов, играющих роль в воспалении.

К этой группе относятся салициламид, ацетилсалициловая кислота (аспирин) – *Acidum acetylsalicylicum*(*Aspyrinum*).

**Фармакологическое действие**и **показания**такие же, как у других анальгетиков, но еще обладает антиагрегатным действием, поэтому используется и для профилактики тромбозов и эмболий.

**Применение:**Принимают по 0,5–1,0 3–4 раза в день после еды, для профилактики тромбозов – 125–300 мг в день.

**Побочные действия:**тошнота, снижение аппетита, боли в области желудка, анемия, ульцерогенное действие.

**Противопоказания:**язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, болезни почек, склонность к кровотечениям, беременность.

**Форма выпуска:**таблетки по 100, 300 и 500 мг № 10 и 100.

Комбинированные препараты с аспирином: Алка-прим, Алка-Зельтцер, аспирин Упса с витамином С, аскофен, цитрамон, седальгин.

**Производные индолуксусной кислоты**представлены препаратами: индометацином (метиндолом); толектином; клинорилом.

**Индометацин**(*Indometacinum*).

Синоним: *Metindolum*. Блокирует синтез простагландинов и миграцию лейкоцитов в область воспаления. Обладает жаропонижающим, анальгетическим и противовоспалительным действием.

**Применение:**ревматические болезни суставов, травмы опорно-двигательного аппарата, невралгии. Принимают внутрь после еды по 25 г 2–3 раза в день.

Мазь наносят на участки 2 раза в день.

**Побочные действия:**головная боль, головокружение, диспепсические явления, анемия, боли в области желудка.

**Противопоказания:**язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, нарушение процессов кроветворения, лактация, беременность, возраст до 14 лет.

**Форма выпуска:**капсулы по 0,25 № 30; мазь 10 %-ная в тубах по 40 г; ректальные свечи по 50 и 100 мг № 10.

**Производные фенилуксусной кислоты.**

**Диклофенак натрия**(*Diclofenac natrium*).

Оказывает сильное противовоспалительное, анальгезирующее и жаропонижающее действие, ингибирует агретацию тромбоцитов.

**Применение:**ревматические заболевания и другие воспалительные и дегенеративные болезни суставов.

Принимают внутрь по 25 мг 2–3 раза в день после еды, затем дозу увеличивают до 100–150 мг в день. В/м – не более 2 ампул в течение суток.

**Побочное действие и противопоказания:**как у индометацина.

**Форма выпуска:**таблетки по 25 мг № 30 и 10; раствор для инъекций – 3 мл в ампулах № 5 (1 мл содержит 25 мг активного вещества).

**Нестероидные препараты – производные пропионовой кислоты.**

К производным пропионовой кислоты относятся: ибупрофен (*Ibuprofenum*), кетопрофен (*Cetoprofen*), фенопрофен (*Phenoprofen*), напроксен (*Naproxen*).

**Ибупрофен**(*Ibuprofenum*).

**Фармакологическое действие, показания к применению, побочные действия и противопоказания:**такие же, как и индометацина.

**Форма выпуска:**таблетки, покрытые оболочкой, по 0,2 № 100.

**5. Производные антраниловой кислоты**

Основные представители: флуфенамовая кислота (арлеор) и ее алюминиевая соль (опирин); мефенаминовая кислота (понстан, понстил); нифлумовая кислота (дональгин). Механизм действия: разобщение окислительного фосфолирования и угнетение активности лизосомных ферментов.

**Дональгин**(*Donalgin*).

Нестероидный противовоспалительный препарат. Активное вещество – нифлумовая кислота.

**Применение:**ревматизм, болезни опорно-двигательного аппарата, болевые синдромы при переломах, воспалительные заболевания лор-органов.

**Способ применения:**принимают внутрь после еды по 250 мг 3 раза в день, при необходимости дозу увеличивают до 1 г в день, поддерживающая доза 250–500 мг в день.

**Побочное действие и противопоказания:**такие же, как у индометацина.

**Форма выпуска:**капсулы по 250 мг № 30.

**Кислота мефенамовая**(*Acidum mefenamicum*).

По анальгезирующей активности она равноценна бутадиону и превосходит салицилаты, а по жаропонижающему действию равна этим препаратам.

**Показания, побочное действие и противопоказания:**свойственные препаратам этой группы.

**Форма выпуска:**таблетки по 0,25 и 0,5 г № 50.

**Оксинамы и препараты с выраженным анальгетическим эффектом.**

Оксинамы – это новый класс неспецифических противовоспалительных средств, обладающих выраженным противовоспалительным действием.

К ним относятся лорноксикам (ксефокам) (*Lornoxycam*) (*Xenofocam*), мелоксикам (*Meloxycam*) (мовалис) (*Movalis*), пироксикам (*Piroxicam*) (хотемин, толдин, эразон, роксикам, фелден), теноксикам (табитал, теноктил).

**Пироксикам**(*Piroxicam*).

Неспецифическое противовоспалительное средство с выраженным анальгезирующим действием, обладает также жаропонижающим свойством.

**Применение, побочное действие и противопоказания:**такие же, как у других нестероидных препаратов, кроме того, еще вызывает депрессию и сонливость.

**Форма выпуска:**капсулы по 10 и 20 мг № 20.

**Торадол**(*Toradol*).

Синоним: *Ketanov*. По своим обезболивающим свойствам приближается к опиоидным препаратам.

**Показания:**Кратковременное купирование сильных болей, требующих обезболивания, по интенсивности аналогично применению препаратов группы морфина и его заменителей.

**Способ применения:**принимают внутрь по 10 мг однократно, при необходимости – каждые 6 ч; в/м и в/в вводят в дозе 10–30 мг однократно. При многоразовом применении – не более 5 суток.

**Побочные действия:**боли в животе, диспепсия, нарушение зрения, головокружение, нарушение сна, брадикардия, гипертония, изменения со стороны крови.

**Противопоказания:**язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки; беременность, состояния с высоким риском кровотечения.

**Форма выпуска:**таблетки по 10 мг № 10; ампулы (в 1 мл 30 мг) № 5.

**6. Препараты золота**

Механизм противовоспалительного действия препаратов золота обусловлен их иммуномодулирующими свойствами. К ним относятся: кризанол (*Chrysanolum*), ауронофин (*Auronofin*), тауредон (*Tauredon*).

**Кризанол**(*Krizanolum*).

Содержит от 33,5 до 35 % золота.

**Показания:**ревматоидный артрит.

**Способ применения:**вводят в/м 1 раз в неделю. Разовая доза – 1 мл 5 %-ной взвеси (это 17 мг золота). Курс лечения – 58–60 инъекций.

**Побочные действия:**дерматиты, диарея, снижение уровня гемоглобина, альбуминурия, гематурия, лейкопения.

**Противопоказания:**заболевания печени и почек; системная красная волчанка, лихорадка, суставно-висцеральные и септические формы ревматоидного артрита.

**Форма выпуска:**ампулы по 2 мл 5 %-ной взвеси № 25.

**Ауронофин**(*Auronofin*).

Препарат, содержащий золото для приема внутрь. Оказывает противовоспалительное и десенсибилизирующее действие.

**Показания:**ревматоидный артрит.

**Способ применения:**назначают внутрь взрослым по 6 мг в сутки в 1 или 2 приема. Доза для детей – 150 мкг/кг массы тела в сутки. М. С. Д. для детей – 6 мг.

**Побочные действия:**диарея, боль в желудке, сыпь, зуд, стоматит, конъюнктивит.

**Противопоказания:**повышенная чувствительность к препарату, тяжелые заболевания печени и почек. Нарушения кроветворения, беременность, лактация.

**Форма выпуска:**таблетки по 3 мг ауронофина № 30.

**Тауредон**(*Tauredon*).

Содержание золота около 46 %. Активное вещество – натрия ауротиомалат. Вызывает торможение антиген инициированной стимуляции лимфоцитов, угнетение моноцитарного гранулоцитарного фагоцитоза, стабилизацию лизосомальных мембран, укрепление коллагеновых волокон с занятием иммунологически активных участков, способных спровоцировать аутоиммунный процесс.

**Показания:**ревматоидный артрит, ювенальный ревматоидный артрит, псориатический артрит.

**Способ применения:**взрослым в начале лечения назначают 2 инъекции в неделю. С 1 по 3 инъекции вводят 10 мг, с 4 по 6 инъекции – 20 мг. Суммарная доза составляет 1600 мг (максимальная – 2000 мг). Поддерживающая доза составляет 100 мг на инъекцию 1 раз в месяц либо 50 мг 1 раз в 2 недели.

**Побочные действия:**тахикардия, аритмия, тошнота, боли в животе, аллергические реакции.

**Противопоказания:**заболевания почек и печени, беременность, лактация, аллергические реакции на препарат.

**Форма выпуска:**раствор для инъекций: по 0,5 мл в ампулах № 10. В 1 ампуле содержится 10, 20, и 50 мг активного вещества.