

مسکن های اپیوئیدی و آنتاگونیست های آنها

کاربردهای بالینی : مسکن ها، داروهای ضد سرفه، داروهای ضد اسهال

قدرت تسکین درد : آگونیست های قوی (مورفین) ، متوسط و ضعیف

نسبت اثرات آگونیست به آنتاگونیست : آگونیست (فعال کننده ی گیرنده)، آنتاگونیست (مسدود کننده ی گیرنده) و آگونیست-آنتاگونیست مختلط

✓ طبقه بندی

جذب و توزیع

۱. سرکوب تنفس

۳. جذب از راه خوراکی و تزریقی

۲. وابستگی فیزیکی نوزاد

۴. توزیع گسترده در بافت های بدن

۵. عبور از سد جفتی

✓ فاماکوکینتیک

متابولیسم

۱. مدت اثر ضد درد : از ۱-۲ ساعت تا ۶-۸ ساعت متغیر

۲. ایجاد بی دردی برای ۲۴ ساعت یا بیشتر در برخی دارو های طولانی اثر

۳. نیمه عمر : در بیماران کبدی ↑ و در صورت متابولیزه شدن توسط استراز های بافتی و پلاسمایی ↓

جذب ← ورود به خون ← کبد ← متابولیزه شدن به کنژوگه های گلوکورونید غیر فعال ← حذف توسط کلیه

روی نورون های آوران اولیه

۱. محل گیرنده ها : تعدیل درد

نورون های منتقل کننده ی درد در نخاع (مسیرهای صعودی)

نورون های مغز میانی و بصل النخاع (مسیرهای نزولی)

گیرنده ها

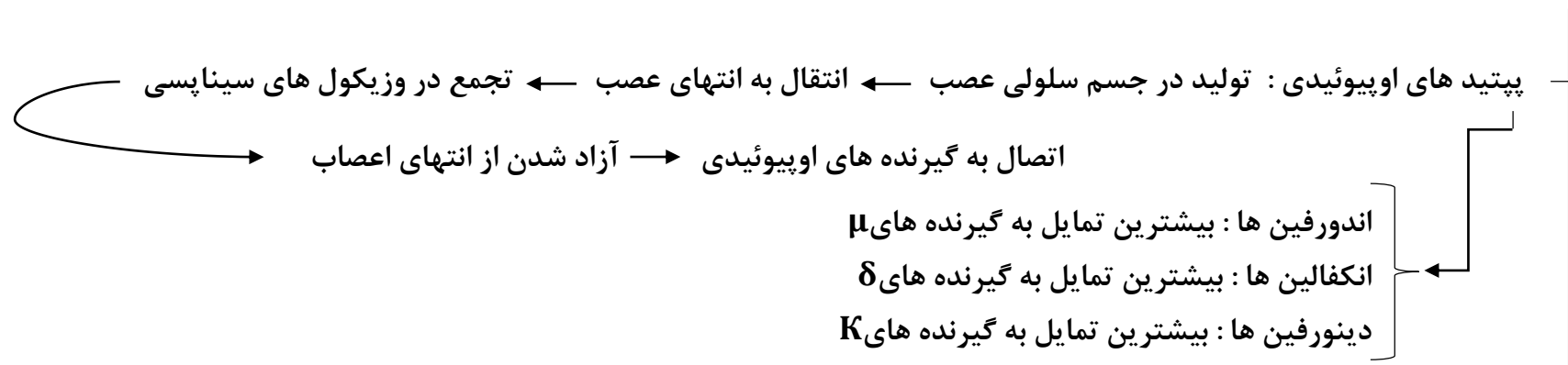
دخیل درواکنش به درد : روی نورون های عقده های قاعده ای ، هیپوتالاموس ، دستگاه لیمبیک و قشر مخ

گیرنده های μ : نقش مهم در سرکوب تنفس - ↓ زمان انتقال مواد از دستگاه گوارش به همراه K

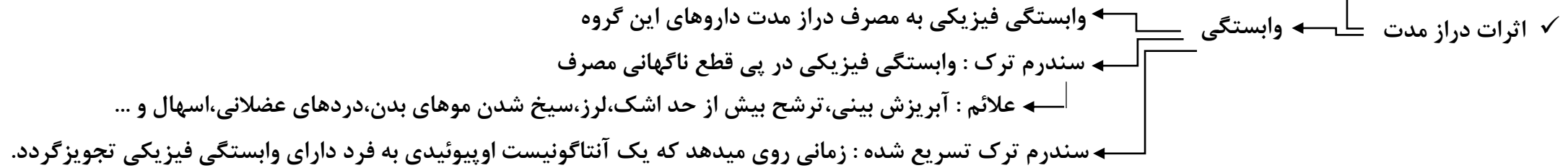
۲. انواع گیرنده ها : گیرنده های δ : ایجاد تحمل

گیرنده های K : ایجاد اثرات آرام بخش

✓ مکانیسم اثر



تحمل : تحمل قابل توجه به اثرات حاد (بجز یبوست) - تحمل به اپیوئید ← در اثر " جدانشدن " از گیرنده



✓ دارو های آگونیست-آنتاگونیست

- ← تسکین درد : تاثیر ضد درد این دارو ها متفاوت است، لیکن در تمام موارد کمتر از آگونیست های کامل می باشد. تاثیر ضد درد پنتازوسین به اندازه ی کدئین است.
- ← گیرنده ها : بوتورفانول، نالبوفین و پنتازوسین آگونیست های گیرنده ی K هستند و تاثیر آنتاگونیستی خفیفی بر گیرنده ی μ دارند.
- ← اثرات : خواب آلودگی، سرگیجه، تعریق و تهوع، گاه اضطراب، توهمات و کابوس های شبانه
- ← داروهای متفرقه ← ترامادول :

۱. آگونیست ضعیف گیرنده ی μ
۲. اثر تسکین درد ترامادول عمدتاً به علت مهار بازجذب سروتونین
۳. مهار کننده ی ضعیف بازجذب نوراپی نفرین
۴. درمان درد متوسط
۵. داروی کمکی همراه با اپیوئیدها در سندرم های درد مزمن
۶. مصرف این دارو در بیماران دارای سابقه اختلالات تشنجی، ممنوعیت نسبی دارد.

← تاپنتادول :

۱. اثر مهارکنندگی قوی بر بازجذب نوراپی نفرین
۲. میل اتصالی متوسط برای گیرنده ی اپیوئیدی μ
۳. درمان درد متوسط تا شدید
۴. کمتر موجب ناراحتی گوارشی و تهوع می شود
۵. در بیماران مبتلا به اختلالات تشنجی با احتیاط مصرف شود.

✓ آنتاگونیست های اپیوئید ها

- ← نالوکسان، نالمیفن و نالترکسان
- ← تمایل بیشتر به گیرنده های μ
- ← کاربرد بالینی مهم آنتاگونیست های اپیوئید : درمان مسمومیت حاد با اپیوئید
- ← نالوکسان و نالمیفن از راه وریدی تجویز می شوند.
- ← به دلیل نیمه عمر کوتاه نالوکسان (۲-۱ ساعت)، چندین دوز آن ممکن است برای درمان مسمومیت لازم باشد.
- ← برخلاف دارو های قدیمی تر، دو آنتاگونیست جدیدتر یعنی متیل نالترکسون و آلمیوپان از سد خونی-مغزی عبور نمیکنند. این

داروها اثرات سوء اپیوئید های قوی روی گیرنده های محیطی μ از جمله روی دستگاه گوارش (یبوست) را خنثی می کنند در حالیکه روی خاصیت مسکن آن ها تاثیری نداشته و سندرم ترک را تسریع نمی کند.