

OPIOIDER

- Analgetika, centralt verkande
- Neurotransmissionen påverkas
- Mycket kraftig smärtlindring - efter operationer, vid cancer etc.
- Smärta - en individuell upplevelse
- Opioider har använts i 6000-år. Framförallt fr. Vallmo.

Opioider vs opiater

opioider → substanser med morfinliknande effekt

opiater → substanser med morfinliknande struktur

Endogena opioider: små peptider - endorfin, enkef:-

Receptorer → inhiberande, hämmar mottagarcellen.

- hämmar utåtgående kaliumjonkanaler via 2:nd messengers → hyperpolarisering
inåtgående Ca^{2+} -jonkanaler.

Finns i: dorsalhornet: överkoppling till spinothalama banan - hämmar

PAG → aktivering av nedåtgående smärtlindrande banor

Limbiska systemet: upplevelse av smärta påverkas

μ [my] - viktigaste receptorn
 δ [delta]
 κ [kappa]

} lkm har lite olika profiler - hur de påverkar de olika receptorerna.
→ rotation av lkm används för att hindra tolerans & beroende.

FARMAKOLOGISKA EFFEKTER VID OPIOIDREC.-AKTIVERING

- analgesi, smärtlindring. Kombineras ofta med andra preparat
- eufori (DA-frysättning)
- beroendeframkallande (DA) - beror på ökad tolerans
- ångestdämpande
- andningsdepression - beror på minskad känslighet för CO_2 i hjärnstammen
- dämpning av host-reflexen.
- illamående & kräkningar - kräkcentrum
- ökad tonus i MTK → förstoppning
- mios - liten pupill - tydligt tecken på opioidmissbruk
- histaminfrisättning - rött & klåda

Försiktighet: astma, KOL

Indikation	biverkningar
smärta	andningsdepression
hosta	kräkning, illamående
dianré	förstoppning

Antagonist på μ -receptorn → ges vid andningsdepression. NALOXON
- inte farligt att ge, reagerar pat. inte så finns det inga biverkningar.

LÄKEMEDEL

Opioidanalgetika

- Starka opioider - stor första-passage-effekt
- morfin aktiv metabolit - 100ggr mer potent än morfin men passerar BHB dåligt...

Fentanyl

- 80ggr mer potent än morfin. - stort missbruk i USA

Metadon

- smärtlindrande
- användning vid heroinmissbruk - "metadonprogrammet"

BUPRENOFIN - partiell agonist

- svårt att ta överdos - säkrare än andra preparat
- potent - små doser krävs
- användningsmedel - substitution

Svaga opioider

kodein

- kombination i tablett: med paracetamol, acetylsalicylsyra
- kodeinet omvandlas till morfin (10%), sker via CYP-enzym i levern.
 - olika genetisk variationer - ultraskabb metaboliserare 1-2%
 - missbruksrisk - god effekt av kodein
- Långsam metaboliserare: liten el. t.o.m ingen effekt av kodein.
L ~ 7%

Tramadol

- agonist till μ -receptor
- frisätter 5-HT (serotonin)
- hämmar återupptag av NA
- ger starkare effekt av cannabis