

9

OPIOİD ANALJEZİKLER

Dr. Ersoy ÖKSÜZ

Opioid analjezikler, afyon bitkisinden elde edilen, kullanımı milattan önceye kadar dayanan, morfin ve kodein gibi opiyat alkaloidlerinin etki mekanizmalarına ve farmakolojik özelliklerine sahip ilaçlardır. Özellikle santral sinir sisteminde (SSS) bulunan kendi reseptörlerini etkilerler (agonistik).¹

OPIOİD RESEPTÖRLER VE ETKİLERİ

Opioid analjeziklerin, hepsi G proteinine bağlı, Mü (μ), delta (δ) ve kappa (κ) olmak üzere 3 farklı reseptörü vardır. Bütün reseptörler beyinde yaygın olarak bulunurlar ve temel olarak ağrı regülasyonunda rol oynarlar. SSS'nin yanı sıra bu reseptörler, periferik sinir uçları, spinal kord, gastrointestinal sistem (GİS), kalp ve böbrek gibi diğer organlarda da oldukça yaygındırlar. Opioid reseptörler, vücutta fizyolojik şartlarda bulunan endojen opioid peptidler ya da dışarıdan alınan eksojen agonistleri (opioid analjezik ilaçlar) tarafından aktive edilir.^{1,2,3}

OPIOİD ANALJEZİKLERİN GENEL ETKİLERİ

Analjezi: Opioid ilaçlar, supraspinal, spinal ve periferik sistemler üzerinden analjezik etki gösterirler.

Öksürük İnhibisyonu: Bu etkilerini, SSS'deki öksürük merkezini inhibe ederek gösterirler.

Öfori-Disfori-Sedasyon-Depresyon: Opioid reseptörler duyu durum merkezi olarak bilinen limbik sistemde diğer beyin bölgelerine oranla daha fazla bulunurlar. Bu yüzden opioid analjezikler yaygın olarak emosyonel değişikliğe yol açarlar. Bunlardan en önemlisi anksiyetenin azalmasına bağlı olarak gerçekleşen öforidir. Yine morfin kullananların büyük bir kısmında sedasyon görülebilir. bağımlılık

Nalokson: μ reseptörlerinin daha fazla olmak üzere diğer tüm opioid reseptörlerin tam antagonistidir. Yarı ömrü yaklaşık 1 saat olup oral biyoyararlanımı oldukça düşüktür. Bu yüzden tablet şekli yoktur. Piyasada özellikle bağımlılık tedavisinde kullanılmak üzere buprenorfin ile kombine edilmiş 2 mg dilatı ve opioid toksisitesinde kullanılmak üzere 0,4 mg/ml ampul şekli vardır. Bu genellikle infüzyon şeklinde uygulanır. IM-SC uygulamada 2-5 dakika içerisinde etkisi başlar. İV uygulamada ise bu süre 1-2 dakika kadardır.^{1,4}

Naltrekson: Naloksondan daha uzun etkili ve oral yararlanımı daha fazla olan opioid antagonistir. 50 mg günde 1 tablet şeklinde kullanılabilir.^{1,4}

Kaynaklar

1. Randa Hilal Dandan, Laurence L. Bruton. Çeviri Editörü Ş.Remzi Erdem. Goodman Gilaman'ın Farmakoloji ve Tedavi el kitabı. 2. Baskı. Opioidler, analjezi ve ağrı tedavisi. Bölüm: 18; sayfa 281-309.
2. H.C. Stephen Chan, Dillon McCarthy, Jianing Li, Krzysztof Palczewski, and Shuguang Yuan. Designing Safer Analgesics via μ -Opioid Receptor Pathways. Trends Pharmacol Sci. 2017 ; 38(11): 1016–1037
3. Bradley K Taylor, and Gregory Corder. Endogenous analgesia, dependence, and latent pain sensitization. Curr Top Behav Neurosci. 2014; 20: 283–325.
4. S. Oğuz Kayaalp. Akılcı tedavi yönünden Tıbbi Farmakoloji.13. baskı. Opioid analjezikler. Bölüm: 6; sayfa 826-845.
5. Carla Ghelar dini Lorenzo Di Cesare, Mannelli Enrica Bianchi. The pharmacological basis of opioids. Clinical Cases in Mineral and Bone Metabolism 2015; 12(3): 219-221.
6. Xiu-qin Feng, Ling-ling Zhu, Quan Zhou. Opioid analgesics-related pharmacokinetic drug interactions: from the perspectives of evidence based on randomized controlled trials and clinical risk management. Journal of Pain Research 2017;10 1225–1239
7. Yibing Zhu, Yinhua Wang, Bin Du and Xiuming Xi. Could remifentanil reduce duration of mechanical ventilation in comparison with other opioids for mechanically ventilated patients? A systematic review and meta-analysis. Critical Care (2017) 21:206.