

Léčba bolesti volně prodejnými léčivými přípravky

Roman Goněc, Šárka Kozáková

Ústavní lékárna, Masarykův onkologický ústav, Brno

Lékárny představují v léčbě bolesti často místo prvního kontaktu mezi pacientem a zdravotníkem. Nabídka volně prodejných analgetik není, co se týče účinných látek, příliš široká, zato je nepřehledná, co se týče množství přípravků na trhu – přípravky obsahují tytéž látky v různých dávkách nebo různé kombinace látek. I tak je možné pacientovi nabídnout hned několik řešení. Léčivé přípravky jsou dostupné v celé řadě lékových forem.

Klíčová slova: bolest, analgetika, volně prodejný přípravek.

Treatment of pain with over-the-counter medications

In the treatment of pain, pharmacies are often the place of first contact between a patient and a healthcare professional. The choice of over-the-counter analgesics is not so wide in terms of active ingredients; however, it is very confusing as to the number of products in the market. In spite of this fact, the patient can be offered several solutions. Medicinal products are available in a wide range of dosage forms.

Key words: pain, analgesics, over-the-counter medication.

Prakt. lékáren. 2012; 8(2): 90–92

Charakteristika

Bolest je nepříjemná senzorická a emocionální zkušenost související se skutečným nebo hrozícím poškozením tkáně, nebo jako takové poškození popsána (1). Bolest provází celou řadu onemocnění a z pohledu pacienta patří rozhodně ke klíčovým příznakům. Pokud není léčená, může zhoršit průběh samotné choroby. Akutní bolest je vyvolávána identifikovatelnými podněty, po jejichž odstranění bolest mizí. Je to bolest krátkodobá a neopakuje se. Její trvání nepřesahuje 30 dní. Právě v léčbě akutní bolesti mají své místo volně prodejné přípravky. Chronická bolest trvá delší dobu a její příčiny často nejsou jednoznačné. Ovlivňuje psychiku pacienta a zhoršuje kvalitu jeho života. Její trvání přesahuje 3–6 měsíců (2). Specifickými typy bolesti jsou migrény a koliky (3, 4).

Možnosti léčby

V terapii se uplatňují různé postupy – rehabilitační, psychologické, chirurgické, neuromodulační a především farmakoterapeutické. Světová zdravotnická organizace seřadila farmakoterapeutické možnosti do tří skupin: neopioidní analgetika, kombinace neopioidních a slabých opioidních analgetik, kombinace neopioidních a silných opioidních analgetik (5). Postupuje se postupně od jedné skupiny ke druhé, dokud pacient není osvobozen od bolesti a upřednostňuje se podávání analgetik v pravidelných časových intervalech. Pomocnou léčbu představují léčiva z jiných skupin, tzv. koanalgetika: antidepresiva, antipsychotika, hypnotika, myorelaxancia, antikonvulziva, kortikosteroidy, antiemetika. I když byl tento žebříček vytvořen pro potřeby léčby nádorové bolesti, využívá

Tabulka 1. Dávkování perorálních analgetik

Léčivo	Dospělí		Děti	
	Dávkování	Max. dávka	Dávkování	Max. dávka
Kyselina acetylsalicylová	3x 250–1 000 mg	4 000 mg	3x 10–15 mg/kg	50 mg/kg
Ibuprofen	3–4x 200–400 mg	2 400 mg	3–4x 10 mg/kg	2 400 mg
Naproxen	3x 275 mg	1 650 mg	Jen > 12 let, dávky jako dospělí	
Diklofenak	2–4x 25 mg	200 mg	Jen > 14 let, dávky jako dospělí	
Paracetamol	3x 500–1 000 mg	4 000 mg	3x 10–15 mg/kg	60 mg/kg

se v obecné praxi léčby chronické bolesti. Volně prodejné léčivé přípravky tvoří základ prvního stupně léčby bolesti, ale najdeme je i mezi koanalgetiky. Některé kombinace analgetik a koanalgetik jsou i volně prodejné, případně lze pacientovi nabídnout volně prodejné léčivé přípravky z obou skupin.

Při léčbě akutní bolesti je naopak vhodné co nejdříve nasadit co nejsilnější analgetikum. Pro racionální léčbu akutní bolesti existuje srovnávací tabulka, tzv. Oxfordská liga analgetik, která uvádí relativní účinnost analgetik založenou na „number needed to treat“, tj. průměrném počtu pacientů, počet pacientů (nereagujících na placebo), který musí být léčen určitým analgetikem, aby alespoň u jednoho z nich došlo nejméně k 50% poklesu intenzity bolesti (2, 6). Je důležité zmínit, že některé volně prodejné léčivé přípravky (ibuprofen v dávce 600 nebo 800 mg, diklofenak v dávce 100 mg) patří z tohoto hlediska k vysoce účinným a mohou být dokonce účinnější než opioidní analgetika. I perorální podání 200 nebo 400 mg ibuprofenu, nebo 25 nebo 50 mg diklofenaku je účinnější než 10 mg morfinu intramuskulárně.

S požadavkem na léčbu akutní bolesti (hlavy, zubů, pohybového ústrojí) nebo chorob bolesti

doprovázených (chřipka) přichází pacient obvykle s vědomím, že pokud samoléčba během několika dnů nepomůže, bude muset stejně vyhledat lékaře. Správné individuální zhodnocení situace ze strany lékárníka nebo asistenta, jehož výsledkem může být i včasné odeslání k lékaři, může léčbu urychlit. Je nutné nezapomenout na dispenzační minimum, varování před nežádoucími účinky a interakcemi.

Rizika léčby

S pacientem je vždy nutné probrat charakter (intenzitu, dobu trvání) a možné příčiny jeho bolesti a podle toho mu navrhnout další postup léčby nebo případnou návštěvu lékaře. Léčbou příznaků choroby totiž můžeme zabránit včasné diagnóze závažné choroby nebo zhoršit průběh jiné choroby, kterou pacient trpí. Analgetika, včetně volně prodejných, mají celou řadu nežádoucích účinků, lékových interakcí a kontraindikací. Nesteroidní antiflogistika (NSA) obecně by neměli užívat lidé s vředovou gastrointestinální chorobou ve své anamnéze. Dlouhodobé, tj. několikaleté, užívání, resp. nadužívání NSA zatěžuje ledviny a projevuje se nepříznivě i na dalších orgánech. Na NSA se vyskytuje často zkrácená přecitlivělost, přecitlivělost na jednu účinnou

látku tak brání podávání i jiných účinných látek. Ve třetím trimestru těhotenství jsou nesteroidní antiflogistika kontraindikována. Vždy je třeba zvážit užívání analgetik v těhotenství a při kojení, i v případech, kdy není výslovně kontraindikováno. Rizikem je i hepatotoxicita NSA nebo paracetamolu, která se může snáze projevit, jsou-li tyto látky podávány současně s jinými hepatotoxickými látkami.

Analgetika se systémovým účinkem

Nesteroidní antiflogistika (NSA) působí proti bolesti, zánětu, teplotě a horečce a lze je úspěšně použít u většiny bolestivých stavů pohybového ústrojí, u bolestí zubů, poranění apod. Jednorázová aplikace může ulevit od bolesti. Dlouhodobé podávání nižších dávek působí analgeticky, teprve při opakovaných vyšších dávkách se projevuje i antiflogistický účinek (analgetický účinek do desítek minut, antiflogistický účinek do 7 dnů). Kombinovat navzájem nesteroidní antiflogistika se považuje za iracionální. Podle charakteru bolesti je možné zvolit léčivo s vhodnou kinetikou a také vhodnou lékovou formu – např. při akutní bolesti tablety s okamžitým uvolňováním nebo šumivé tablety.

Mechanismem účinku je inhibice cyklooxygenázy (COX). Tento enzym hraje klíčovou roli v metabolismu prostaglandinů, které jsou v lidském těle důležitými mediátory celé řady procesů. Cyklooxygenáza se vyskytuje v podobě dvou isoenzymů. COX-1 se uplatňuje při syntéze fyziologicky působících prostaglandinů, COX-2 při syntéze prostaglandinů, které jsou mediátory zánětu. Jednotlivé NSA působí v různé míře na oba isoenzymy. Inhibice COX-1 vede při systémovém podání k celé řadě nežádoucích účinků, na prvním místě stojí riziko tvorby vředů a zvýšené riziko krvácení. Toto riziko se zvyšuje současným podáváním glukokortikoidů, antikoagulancií, protidestičkových léčiv, SSRI. Nejstarší a nejdéle používaná NSA patří k neselektivním inhibitorům NSA a pouze v této skupině najdeme volně prodejné přípravky. Na prvním místě je třeba zmínit **kyselinu acetylsalicylovou** (Acylypyrin, Anopyrin, Aspirin, Godasal). Analgetický účinek nastupuje do 30 minut po podání, maxima dosahuje do 2 hodin a přetrvává 4–6 hodin. Při přítomnosti horečky se nesmí podávat dětem do 16 let! Je dostupná také v kombinaci s paracetamolem, kofeinem nebo kyselinou askorbovou. **Ibuprofen** (APO-Ibuprofen, Brufen, Ibalgin, IbuMax, Ibuprofen AL, Nurofen) patří v současné době k nejrozšířenějším analgetikům a lze bez větších výhrad používat i u dětí. **Naproxen** (Nalgesin S) má delší biologický poločas, jeho

účinek nastupuje do 30 minut, ale přetrvává 8–12 hodin. Jeho použití není vhodné u starších pacientů. **Diklofenak** (Myogit, Veral, Voltaren Actigo, Voltaren Rapid) má odlišnou farmakokinetiku podle toho, o jakou sůl se jedná. Sodná sůl má nástup účinku za 30–45 minut, draselná sůl do 15 minut.

Inhibicí tvorby prostaglandinů v CNS působí **paracetamol** (Mexalen, Panadol, Paralen, Paramax Rapid). Paracetamol bývá často podáván, je důležité uvědomit si, že jednotlivá analgetická dávka pro 70kg dospělého je 1 000 mg. Denní dávka 150 mg/kg už je hepatotoxická, ale u pacientů s horší funkcí jater (alkoholici, malnutrice) nebo užívajících jiná hepatotoxická léčiva může jít i o dávku nižší. Na druhou stranu, výhodou paracetamolu je nízký výskyt nežádoucích účinků a interakcí s jinými léčivy. Použití u dětí je usnadněno dostupností přípravků v nižších silách (100 mg, 125 mg) a snadněji podávaných lékových forem (čípky, perorální suspenze). Je dostupný také v racionálních kombinacích s propyfenazonem (Saridon, Valetol) nebo anxiolyticky působícím guaifenesinem (Atargalin). Existují i kombinace s kyselinou acetylsalicylovou, kofeinem, nebo kyselinou askorbovou, jejichž základ je spíš tradiční nebo empirický. U akutních infekcí horních cest dýchacích se používají jeho kombinace s celou řadou látek (chlorfenamin, fenylefrin, dextromethorfan, pseudoefedrin).

Analgetika pro lokální použití

Při podání přes kůži, v podobě gelu, krému, masti, spreje nebo náplasti, dosahují léčiva terapeutických koncentrací v podkožních tkáních. Průnik přes kůži závisí nejen na složení přípravku (soli účinné látky, pomocné látky), ale i na aktuálních vlastnostech kůže pacienta. Je důležité uvědomit si, že i při lokálním podání se dostávají léčiva v omezené míře do systémového oběhu. Zvýšená pozornost je tak potřeba při aplikaci na větší povrchy. Topické přípravky také není možné aplikovat na sliznici nebo poraněnou kůži. U NSA se může vyskytnout fototoxicita, místa, na která bylo léčivo aplikováno, je vhodné chránit před slunečním zářením. I při lokální aplikaci platí kontraindikace ve třetím trimestru těhotenství. Použití v pediatrii je možné, tabulka 2 uvádí pro každou léčivou látku ten přípravek, jehož SPC má nejnižší věkovou hranici.

Lokální použití NSA má význam především u artrózy a mimokloubního revmatizmu, kde vhodně doplňuje systémovou léčbu a současně působí antiflogisticky. Uplatňují se také při porázových stavech, pohmožděninách a neuro-

Tabulka 2. Použití topických analgetik v pediatrii

Diklofenak (Dolmina)	Od 6 let
Indometacin (Indobene)	Od 14 let
Ibuprofen (Ibalgin)	Krém od 3 let, gel od 12 let
Naproxen (Emoxen)	Od 12 let
Diethylaminsalicylát (Reparil N)	Od 2 let
Hydroxyethylsalicylát (Arnidol)	Od 15 let
Piroxikam (Hotemin)	Od 14 let
Nimesulid (Aulin)	Od 12 let

genních bolestech zad. Přípravky jsou dostupné ve formě mastí a gelů, diklofenak i jako náplast. K nejčastěji používaným patří **diklofenak** (Almiral, Dolmina, Flector, Olfen, Veral, Voltaren). Po aplikaci se vstřebává asi ze 6 % a jeho biologický poločas je asi 2 hodiny. Jako sprej nebo gel je dostupný **indometacin** (Elmetacin, Indobene). Pouze z 1 % se vstřebává **ibuprofen** (Dolgit, Ibalgin). Dlouhý biologický poločas, 12–15 hodin, má **naproxen** (Emoxen). Lze použít i estery kyseliny salicylové – **diethylaminsalicylát** (kombinované přípravky Algesal, Reparil N), a **hydroxyethylsalicylát** (kombinovaný přípravek Arnidol). Velmi dlouhý biologický poločas, 50–80 hodin, má **piroxikam** (Hotemin). Léčivým přípravkem vhodným pro porázové stavy, který ale není vhodné užívat dlouhodobě, je **nimesulid** (Aulin).

Literatura

1. Part III: Pain Terms, A Current List with Definitions and Notes on Usage. In: Merskey H, Bogduk N (eds): Classification of Chronic Pain, Second Edition, IASP Task Force on Taxonomy. Seattle: IASP Press 1994. Definice dostupná na <http://www.iasp-pain.org/Content/NavigationMenu/GeneralResourceLinks/PainDefinitions/default.htm> [cit. 2012-01-10].
2. Doležal T, Hakl M, Kozák J, Kršiak M, Lejčko J, Skála B, Sláma O, Ševčík P, Vorlíček J. Bolest. Doporučený diagnostický a léčebný postup pro všeobecné praktické lékaře. Praha: CDP-PL 2008.
3. Rokyta R. Bolest. In: Vlček J, Fialová D, et al. Klinická farmacie I. Praha: Grada 2010: 295–323.
4. Lejčko J. Analgetika. In: Suchopár J, a kol. Remedia Compendium. Praha: Panax 2009: 310–330.
5. Grafické znázornění dostupné na <http://www.who.int/cancer/palliative/painladder/en/> [cit. 2012-01-10].
6. Oxfordská liga analgetik dostupná na <http://www.medicine.ox.ac.uk/bandolier/booth/painpag/Acutrev/Analgesics/lftab.html> [cit. 2012-01-10].
7. SPC přípravků platná k lednu 2012. Aktuální SPC lze vyhledat a stáhnout na stránkách SUKL: <http://www.olecich.cz/modules/medication/>.

Článek přijat redakcí: 13. 2. 2012
Článek přijat k publikaci: 14. 3. 2012

Mgr. Roman Goněc
Ústavní lékárna
Masarykův onkologický ústav
Žlutý kopec 7, 656 53 Brno
roman.gonec@mou.cz