

Tab. 8. Silné opioidy dostupné v ČR

Opioid	Receptorová aktivita	Léková forma	Nástup účinku	Poznámka
Morfin	μ, κ, δ agonista	p.o. tablety s rychlým i řízeným uvolňováním, kapky, inj. (s.c., i.v.)	p.o. 20 min (v hodinách u retardované formy) s.c. 10 min i.v. 3–5 min	Neretardované formy jsou užívány ke kontrole průlomové bolesti, nástup účinku je ale pomalejší nežli u trans mukózních forem fentanylu.
Hydromorfon	μ, κ, δ agonista	p.o. tablety s rychlým i řízeným uvolňováním	hodiny	
Fentanyl	μ agonista	Transdermální (TD) náplast, inj. k i.v. a s.c. podání, trans mukózní podání TMF (bukální tbl, bukální film, nazální sprej)	TMF 5–10 min i.v. 1–2 min s.c. 2–10 min TD 8–12 h	
Sufentanil	μ agonista	Inj i.v., s.c.	1–5 min	Užíván v nemocničním prostředí na JIP, je zhruba 10x účinnější než fentanyl.
Remifentanil	μ agonista	Inj. i.v.	minuty	Užíván v úvodu a udržování celkové anestezie v podmínkách monitorovaného JIP lůžka.
Buprenorfin	parciální agonista na μ receptorech a antagonist na κ receptorech.	TD náplast	10 hodin	Užívá se také p.o. v kombinaci s naloxonem v terapii závislosti na opiátech.
Oxycodon	μ a κ agonista	Tablety s postupným uvolňováním	1–3 hodiny	Někdy se udává částečná výhoda v léčbě neuropatické bolesti.
Tapentadol	μ, κ, δ agonista a inhibitor zpětného vychytávání noradrenalinu	Tablety s rychlým/s řízeným uvolňováním, perorální roztok	20–60 min/3–5 h	Evidence o specifické výhodě v léčbě neuropatické bolesti není dostatečná (45, 46).
Piritramid	μ agonista	Inj. s.c., i.m., i.v.	15 min	Na některých pracovištích chirurgických oborů je rutinně užíván v léčbě pooperační bolesti.
Meperidin/ Pethidin	μ, κ, agonista	Inj. s.c., i.m., i.v.	minuty	Nevhodný v léčbě chronické bolesti. V jednorázovém podání může být vhodný při obavách ze spasmů a kolik.
Nalbufin	κ -agonista, μ-antagonista	Inj. s.c., i.m., i.v.	minuty	Nevhodný v léčbě chronické bolesti.
Methadon	μ, κ, δ agonista, NMDA antagonist	p.o. kapky	8–12 h	U některých pacientů může i při nízkém dávkování způsobit velmi dobrou kontrolu bolesti po převodu i z vysoké dávky jiných opioidů. Riziko kumulace a nežádoucích účinků.

Tab. 9. Antagonisté opioidů

Antagonista	Použití
Naloxon	Jde o zásadní lék indikovaný k odstranění opioidy způsobeného útlumu dechového centra – viz Tab. 10, v tabletách s řízeným uvolňováním bývá naloxon kombinován s oxycodonom, nevstřebává se a slouží ke zmírnění zácpy.
Naltrexon	Bývá součástí protokolů léčby závislosti na opioidech.
Naloxegol	Perorální periferně působící μ-antagonista účinný v terapii opioidy navozené zácpy nereagující dostatečně na laxativa (47).
Methyl-naltrexon	Forma s.c. periferně působícího μ-antagonisty účinná v terapii opioidy navozené zácpy nereagující dostatečně na laxativa, je výhodný u pacientů bez možnosti perorálního příjmu.

Tab. 10. Použití naloxonu při útlumu dechového centra

Praktický postup
V případě bezvědomí a minimální či žádné dechové aktivity podáváme jednu ampuli 400 μg i.v., v případě mírnější intoxikace a dechové frekvence nad 8 dechů za minutu je vhodné postupovat frakcionovaně v dávkách po 20 μg i.v. každé 2 minuty, abychom odstranili dechový útlum bez vyvolání abstinenčních příznaků a bolesti. Naloxon má krátký poločas a je ho třeba podávat opakovaně nebo v kontinuální infuzi až do odeznění tlumícího účinku opioidu.

Tab. 11. Tipy z praxe paliativního konziliáře

Ve většině případů může být morfin silným opioidem první volby (není-li jasný důvod použít jiný), lokální zvyky bývají jiné – morfin bývá odsunut do terminálních fází (je tak společností i odbornou veřejností někdy vnímán).
Volba opioidu v první linii je málokdy zásadní, je dobré mít osahané dva nebo tři dlouhodobě působící léky, mnohdy je důležitější dostupná cesta podání nežli účinná látka.
Vždy při indikaci dlouhodobě působícího opioidu je třeba vybavit pacienta krátce působícím opioidem na průlomovou bolest.
V ambulantní péči nabízí nejcitlivější titraci morfin v kapkách.
Telefonická služba, optimálně 24/7, schopná řídit opioidní analgezii, může účinně předcházet zbytečným hospitalizacím a návštěvám urgentních příjmů nemocnic.
Rizikový pacient nebo rizikové prostředí stran nesprávného nakládání s opioidy a abúzu – předepsat malá množství, kontrola intervalu, na který předepisují.
Kontrakt s pacientem – opioidy předepisuje jeden lékař.
Opioid naivní pacient – minimalizovat riziko odmítnutí opioidů pro nežádoucí účinky, začít nízkou dávkou, předvídat management nežádoucích účinků, časné zhodnocení.
Převod na jiný opioid – o 25 % nižší než ekvivalentní dávka.
Opioid naivní pacient v nemocnici, i.v. aplikace opioidu – CAVE – situace riziková z útlumu dechového centra.
Morfin není indikován k vedení paliativní sedace (zvláště v některých nemocničních odděleních přetrvává paradigma „už je to na morfin“ – aniž by bolest byla vedoucím příznakem). Lékem volby je zde midazolam.
Methadon je od ostatních opiátů zásadně odlišný, vyžaduje zkušenost a může pomoci v obtížných situacích.
V hospicovém prostředí v ČR je obvyklé používat kombinaci transdermálního fentanylu či buprenorfinu a většinou p.o. či s.c. neretardovaného morfinu na průlomovou bolest. Většinou je možné tento zvyk akceptovat, zjednodušuje to komunikaci.
Kombinace opioidů obecně raději nepoužívat (dobré výjimky jsou např. TDR fentanyl + s.c. morfin při průlomové bolesti v hospici, kombinace oxycodonu s postupným uvolňováním a morfinem či trans mukózním fentanylem na průlomovou bolest, základní opioid + methadon).