

Tab. 4. Příklady v ČR dostupných forem lokálních nesteroidních antirevmatik

Účinná látka	Krém	Gel	Sprej	Náplast
Diklofenak		Voltaren Forte	Diky 4%	Voltaren 140 mg
		Flector EP gel		Flector EP Tissugel
		Olfen gel		Olfen 140 mg
		Almiral gel		
		Voltaren Emulgen		
Ibuprofen	Dolgit krém	Dolgit gel		
	Ibalgin krém	Ibalgin Duo Effect (+ heparoid)		
		Ibalgin gel		
Indomethacin		Indobene gel	Elmetacin sol	
Ketoprofen	Ketonal 5 % krém	Fastum gel	Prontoflex 10% sol.	Keplat emp
Naproxen		Emoxen gel		
Nimesulid		Aulin gel		
Piroxicam	Hotemin krém			

Upraveno podle: <https://www.sukl.cz/>

s klinickým zlepšením po diklofenaku bylo 60 % (NNT 6,4–9,8) a pacientů s klinickým zlepšením po ketoprofenu bylo 63 % (NNT 6,9) (10, 11, 12, 13).

Nežádoucí účinky lokálních NSA jsou minimální (7). Nejčastější byly mírné lokální kožní reakce. Sérové koncentrace léků zůstávají nízké (nepřekračují 5–10 %), a tudíž nevyvolávají nežádoucí účinky jako při celkové aplikaci. Přehled nejčastěji používaných lokálních NSA, uveden v tabulce 4.

2. Opioidy

Farmakologický účinek opioidních analgetik je dán vazbou na opioidní receptory. Analgezie je zprostředkována především stimulací μ -receptorů spinálně a supraspinálně. Podle síly analgetického účinku dělíme opioidy na slabé a silné.

a) Slabé opioidy

Ve srovnání se silnými opioidy mají sice slabší analgetický efekt, ale s jejich vedlejšími účinky (nevolnost, obtíže, ovlivnění kognitivních funkcí atd.) je nutno rovněž počítat. Farmakologicky jde o slabé μ -agonisty (tramadol, kodein, dihydrokodein). Léčbu slabými opioidy u OA zahajujeme, jestliže selhala léčba neopioidními analgetiky nebo je léčba těmito léky kontraindikovaná (14). Zástupci slabých opioidů jsou tramadol, kodein, dihydrokodein.

Tramadol

V Evropě nejrozšířenější slabý opiod je tramadol (1977). Je řazený k slabým opioidům pro svůj účinek na μ -opioidní receptory. Pro jeho analgetický efekt je stejně důležitá blokáda zpětného vychytávání serotoninu a noradrenalinu (15). Účinnost tramadolu je doplněna dlouhou dobou účinku a příznivým bezpečnostním profilem.

Velkou výhodou je existence řady aplikačních forem, od injekční, přes čípkovou až po tablety s dvoufázovým uvolňováním účinné látky. Obvyklá jednotlivá perorální dávka tramadolu s rychlým účinkem je 50–100 mg (1–2 cps., 20–40 gtt.), efekt přetrvává 4–6 hodin. Maximální denní dávka je 400 mg.

Dihydrokodein a kodein

Dihydrokodein je semisyntetický analog kodeinu. K dispozici je retardovaný kodein, který lze podávat v dávkách 60–120 mg po 12 hodinách, případně i po 8 hodinách. Maximální racionální denní dávka se udává 240 mg/denně. Kodein je slabý μ -agonista. Vzhledem ke slabému účinku se používá prakticky jen v kombinacích, převážně s paracetamolem.

b) Kombinované preparáty slabých opioidů

U pacientů se obecně doporučuje kombinace opioidních/neopioidních analgetik. Kombinují se dostupné léky obsahující různá analgetika, ale jsou využívány i fixní kombinace v jedné tabletě, které přinášejí další výhody. V současné době je používána řada fixních kombinací analgetik: paracetamol se slabými (např. kodeinem nebo tramadolem) (Tab. 5). V roce 2016 byla v Evropě schválena nová fixní kombinace slabého opioidu a NSA (tramadol/dexketoprofen), která je dostupná i u nás. Fixní kombinace účinného NSA s opioidem představuje novou alternativu pro léčbu bolesti.

Fixní kombinace tramadolu a paracetamolu

Aditivní efekt můžeme pozorovat u fixní kombinace tramadolu s paracetamolem, kde se vzájemně doplňuje efekt na syntézu prostaglandinů a na opioidní, serotoninergní a noradrenergní dráhy bolesti. Může tedy pokrýt jak nociceptivní bolest vycházející z poškozených tkání, tak inhibovat místa přenosu bolesti na synapsích neuronů na nervových drahách (16).

Dávkování u OA se většinou pohybuje v intervalech denní dávky tramadolu 130–150 mg společně s paracetamolem v dávkách 1000–1500 mg/den. V distribuci je kombinovaná tableta obsahující 37,5 mg tramadolu a 325 mg paracetamolu či její silnější varianta s dvojnásobným množstvím obou látek (Tab. 5).

Fixní kombinace kodeinu a paracetamolu

Na českém trhu je kodein ve fixní kombinované formě s paracetamolem nebo v kombinaci s paracetamolem a kofeinem. Používá se kombinovaná tableta 500 mg paracetamolu s 30 mg kodeinu (Tab. 5).