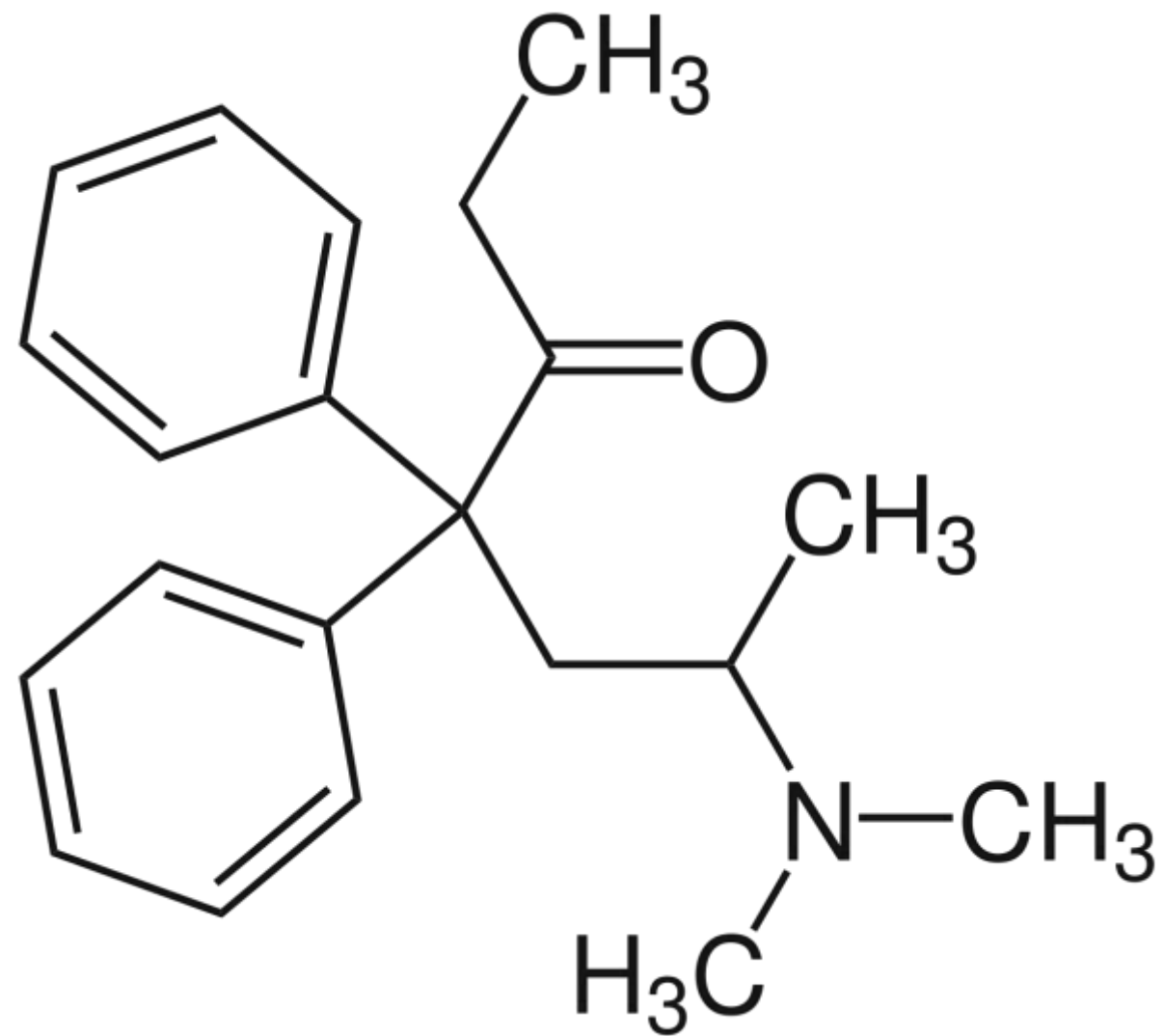




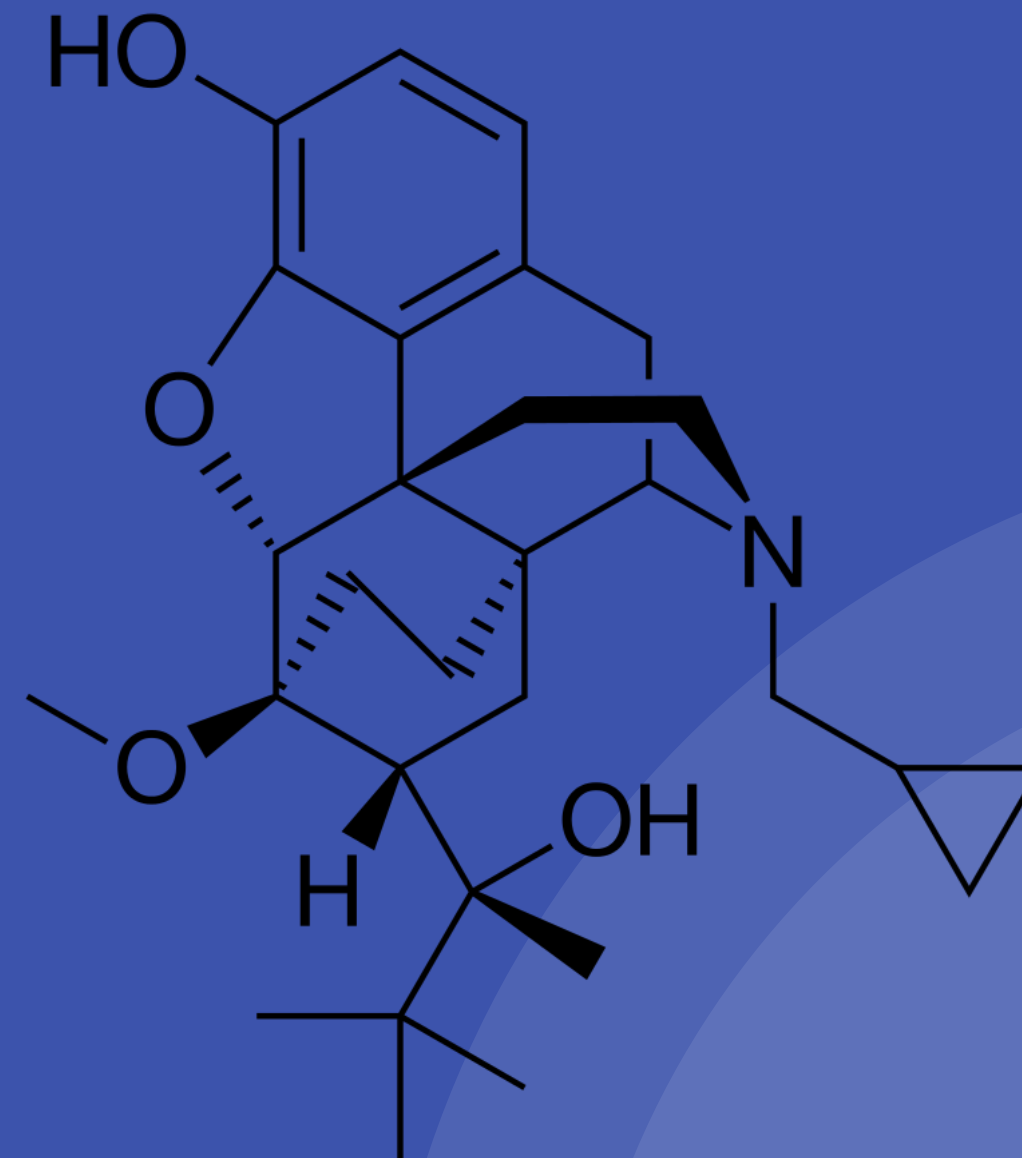
**Онлайн-курс «Препарати замісної
підтримувальної терапії»
Лекція «Основні препарати ЗПТ,
відмінності дії та особливості застосування»**



Препарати для лікування замісної
підтримувальної терапії:



Метадон



Бупренофір



Метадон почали використовувати
в 1960-х.

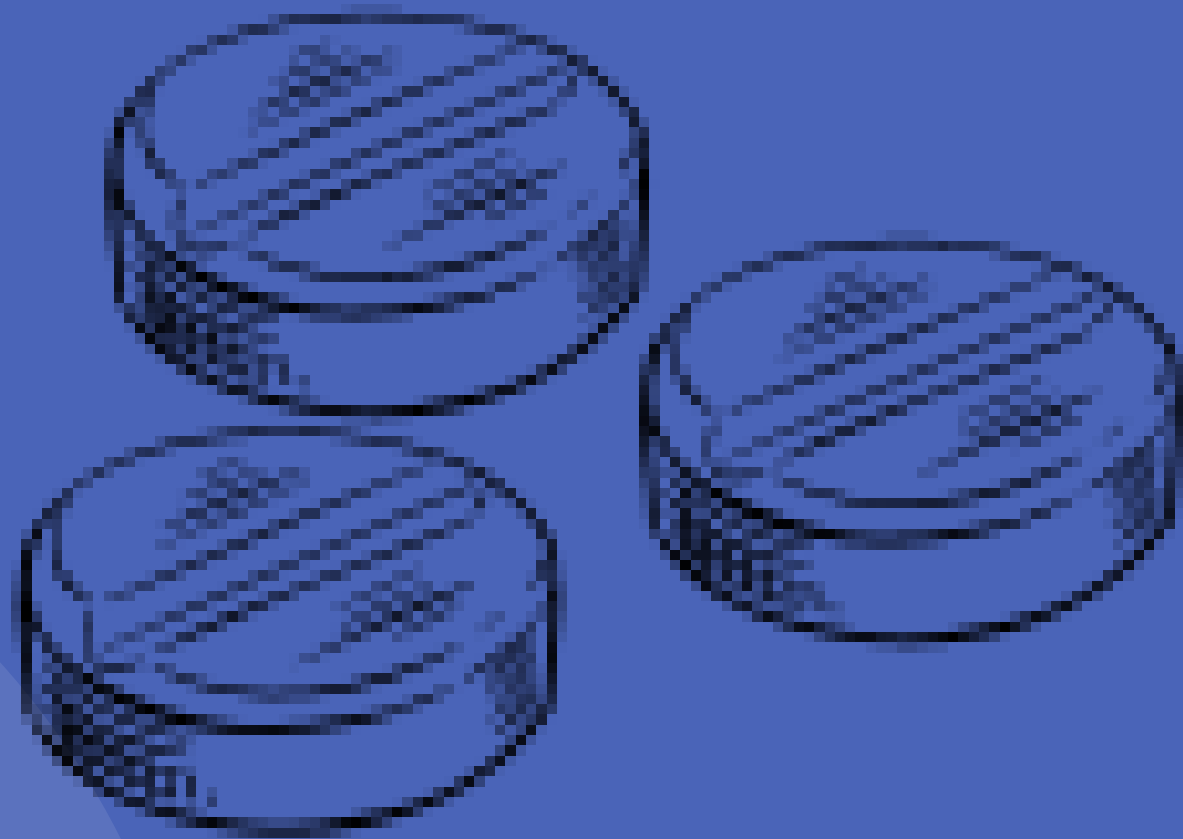


Метадон почали використовувати
в 1960-х.

Бупренорфін почали
використовувати в 1970-х.

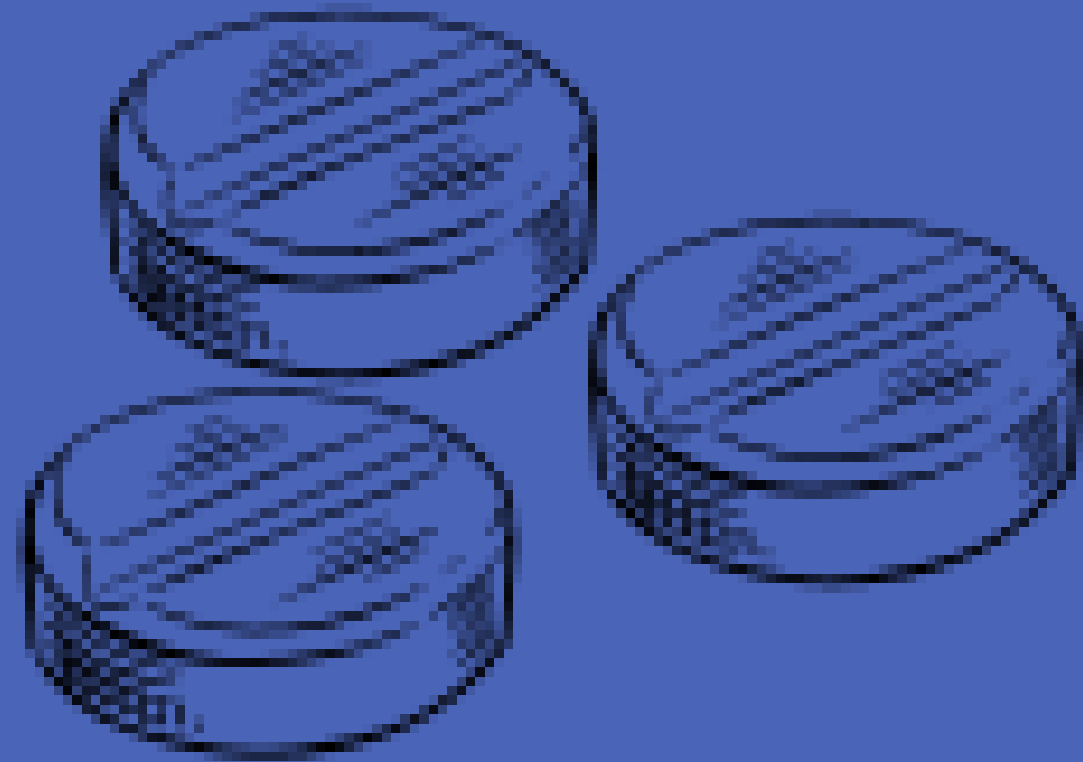


І метадон і бупренорфін є
безпечними та ефективними
медичними препаратами для
лікування залежності від опіоїдів.



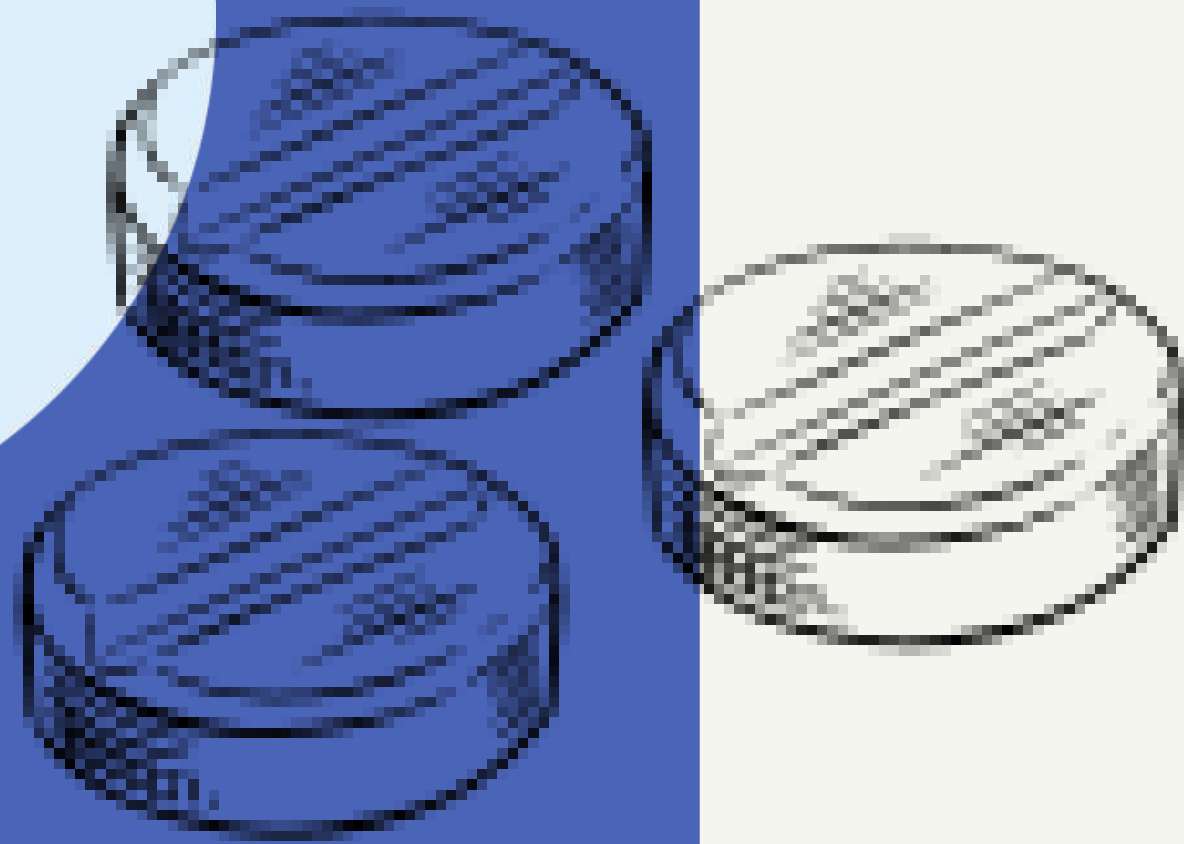
І метадон і бупренорфін є
безпечними та ефективними
медичними препаратами для
лікування залежності від опіоїдів.

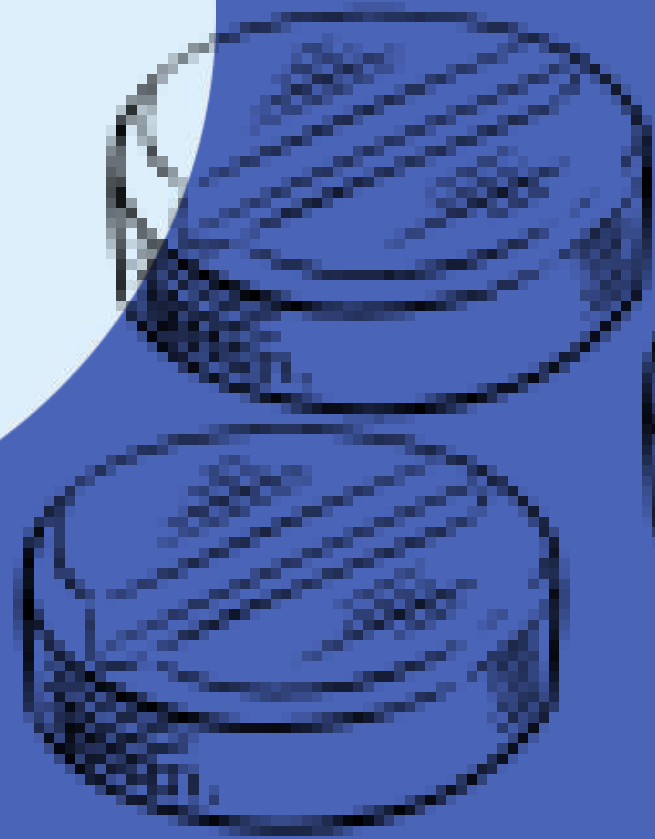
У 2005 році ВООЗ включила ці
препарати до списку
«ЖИТТЄВО важливих лікарських
засобів»



World Health
Organization

Обидва препарати ефективні, але між ними є певна **відмінність**.





Обидва препарати ефективні, але між ними є певна **відмінність**.

Метадон має більшу **опіоїдну дію** та пов'язаний із **вищою ефективністю** щодо утримання пацієнтів у лікуванні.





Обидва препарати ефективні, але між ними є певна **відмінність**.

Метадон має більшу **опіїдну дію** та пов'язаний із **вищою ефективністю** щодо утримання пацієнтів у лікуванні. ***Але для багатьох пацієнтів бупренорфін може бути більш бажаним препаратом, і вони можуть віддавати йому перевагу.***





Враховуйте думку пацієнта при виборі препарату!

А також загальні його/її очікування від лікування та організаційні можливості програм терапії.



Особливості метадоноу

Метадон (метадоноу гідрохлорид) — синтетичний опіатний антагоніст. Добре всмоктується у шлунково-кишковому тракті та має довгий варіабельний період напіввиведення з плазми.



Особливості метадоноу

Метадон (метадоноу гідрохлорид) — синтетичний опіатний антагоніст. Добре всмоктується у шлунково-кишковому тракті та має довгий варіабельний період напіввиведення з плазми.

Ефекти метадоноу в якісному сенсі **схожі на дію інших опіоїдів.**





Метадон добре розчиняється в ліпідах.





Метадон добре розчиняється в ліпідах.

Біодоступність при пероральному вживанні становить 80-95%.

Після першого прийому його концентрація в крові підвищується протягом 4 годин, сягає піку, а потім зменшується.





Метадон добре розчиняється в ліпідах.

Біодоступність при пероральному вживанні становить 80-95%.

Після першого прийому його концентрація в крові підвищується протягом 4 годин, сягає піку, а потім зменшується. Він також

здатний зв'язуватися з протеїнами крові та іншими тканинами організму, не пошкоджуючи їх.

Тому при повторному вживанні метадон накопичується у паренхіматозних органах (легенях, печінці, нирках), створюючи тканинні депо.





Період напіввиведення метадону при пероральному вживанні **першої дози дорівнює 12-18 годин**, але при повторних прийомах препарату **впродовж тижня період напіввиведення збільшується до 24-36 годин** завдяки відносно повільному переходові метадону з депо в плазму.



Пікова концентрація
метадону в крові підіймається
протягом першого тижня
після початку терапії.



Концентрація метадону досягає стану рівноваги **через 3-10 дні після початку терапії.**





Концентрація метадону досягає стану рівноваги **через 3-10 днів після початку терапії**. Після досягнення стабілізації, при пероральному введенні адекватної дози протягом 24 годин концентрація препарату в крові лишається стабільною та зберігає асимптоматичний рівень: без епізодів інтоксикації або проявів відміни.





Основна кількість метадону метаболізується в печінці шляхом N-диметилування за участі цитохрому Р-450.





Основна кількість метадону метаболізується в печінці шляхом N-диметилування за участі цитохрому Р-450.

Виводиться метадон через кишковий тракт і нирки.



Метадон діє на **опіатні рецептори**, які знаходяться у **головному мозку та інших органах**.

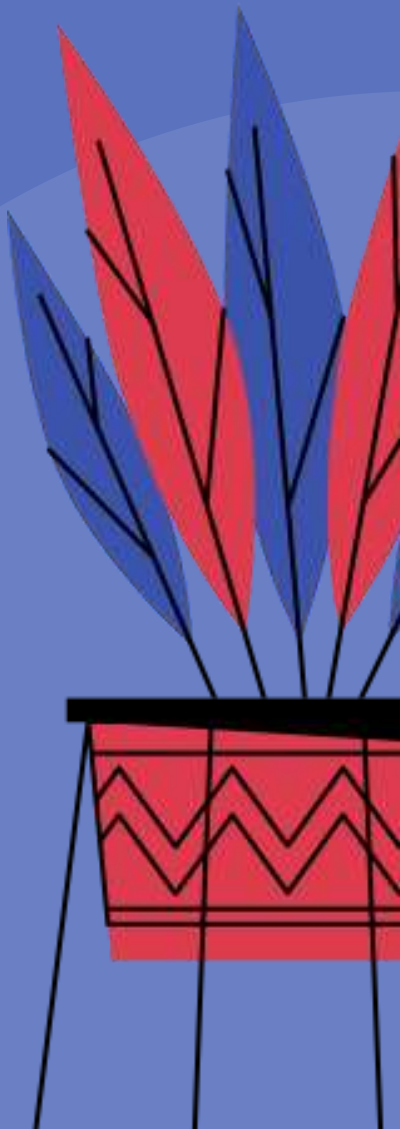


Метадон діє на **опіатні рецептори, які знаходяться у головному мозку та інших органах.**

Фармакологічні ефекти метадону подібні на ефекти **будь-яких інших опіатних агоністів.**

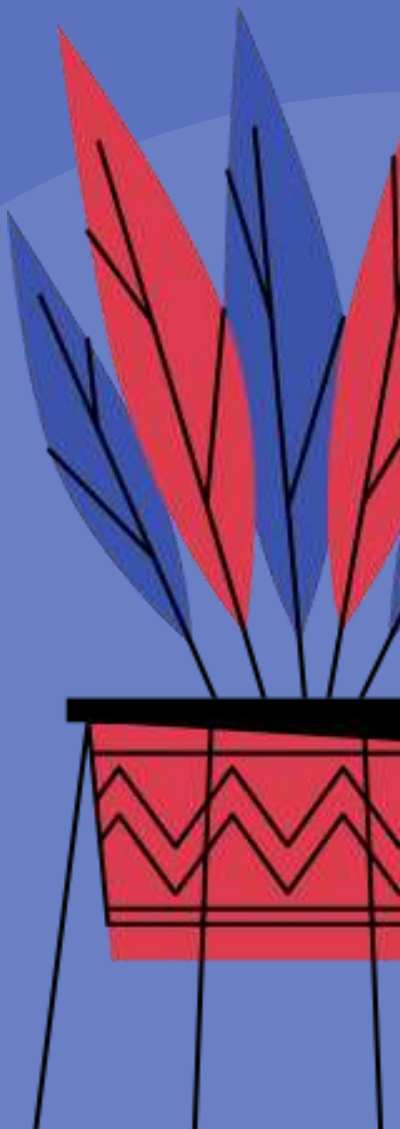


Метадон дозволяє ліквідувати прояви гострого абстинентного синдрому.



Метадон дозволяє ліквідувати прояви гострого абстинентного синдрому.

«Блокувальний ефект» метадону — прийом вуличного опію не призводить до стану ейфорії.





Тривалість дії метадону сягає **24-32 годин,**
тому його можна приймати його один раз
на добу.

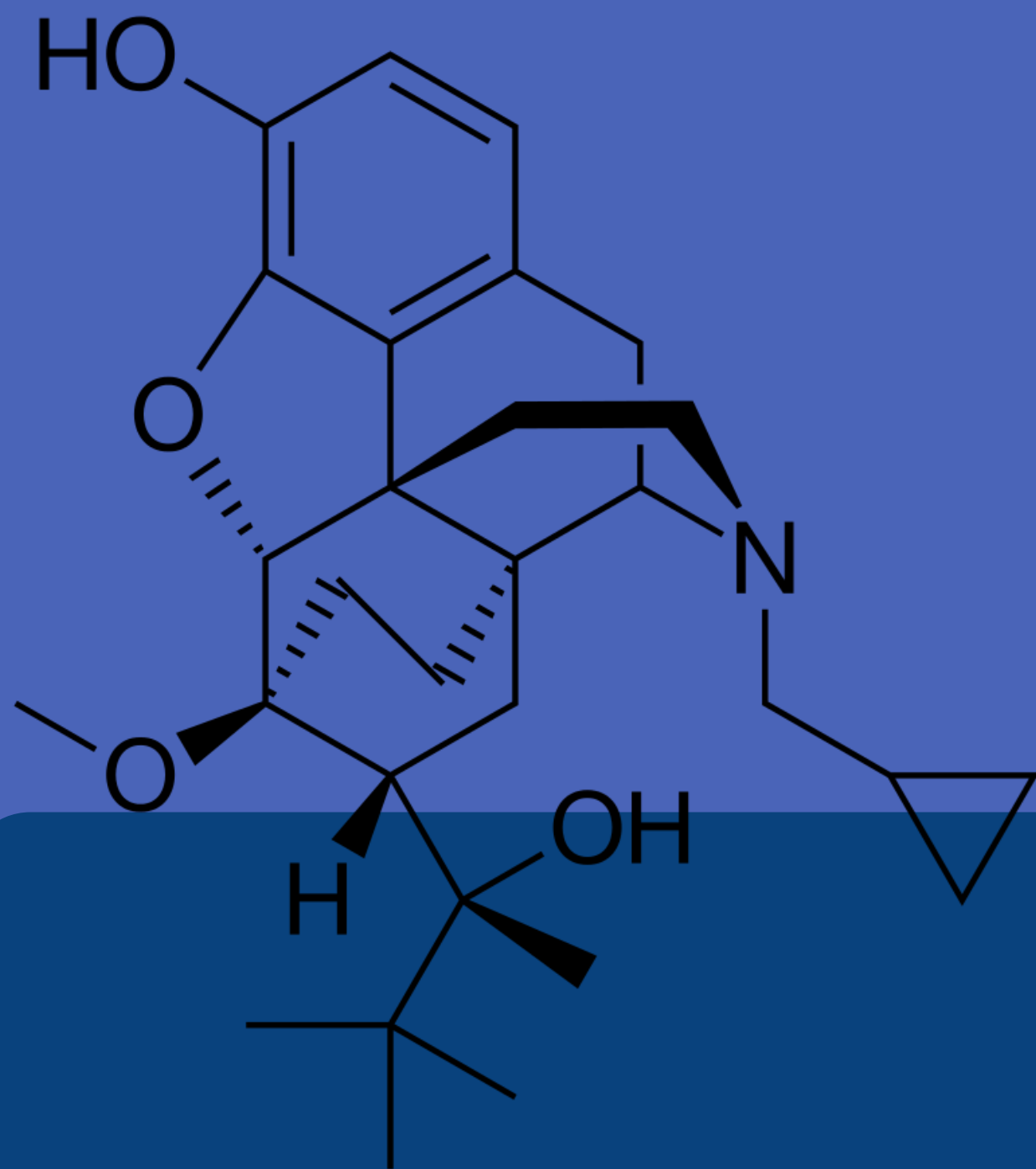




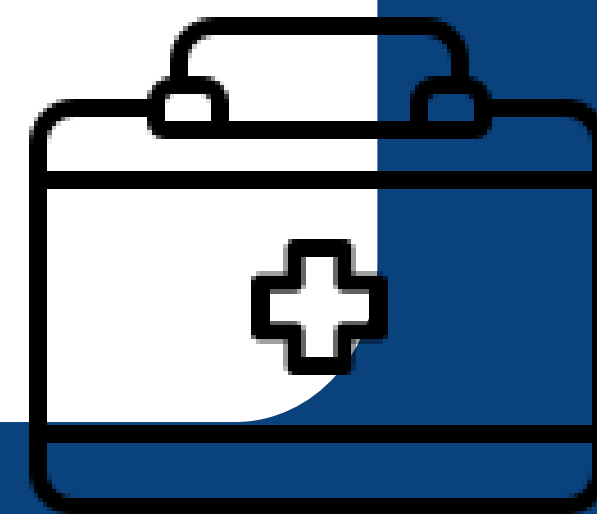
Тривалість дії метадону сягає **24-32 годин,**
тому його можна приймати його один раз
на добу.

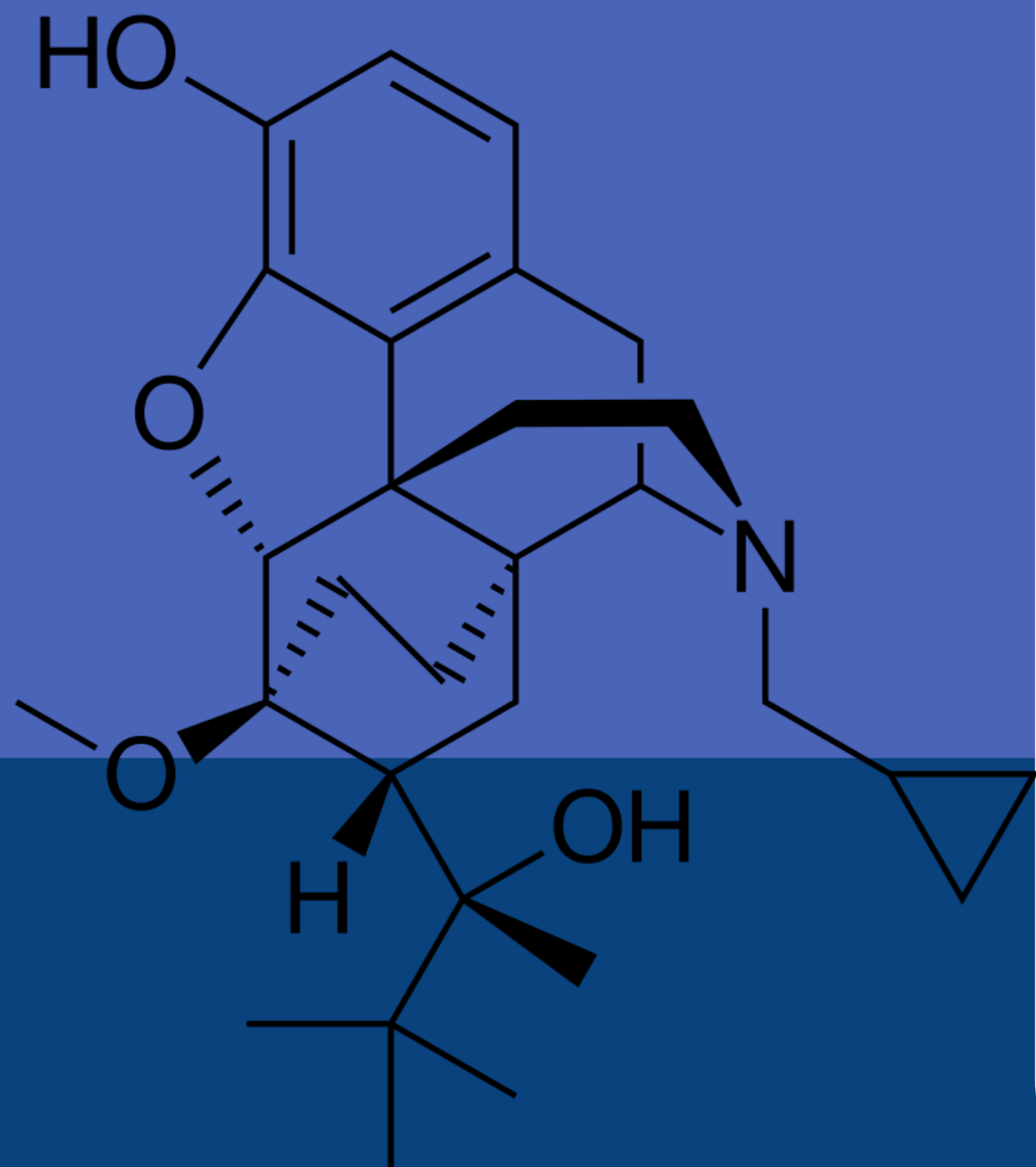
У правильно підібраній дозі метадон
протягом доби забезпечує стан комфорту
у пацієнтів.





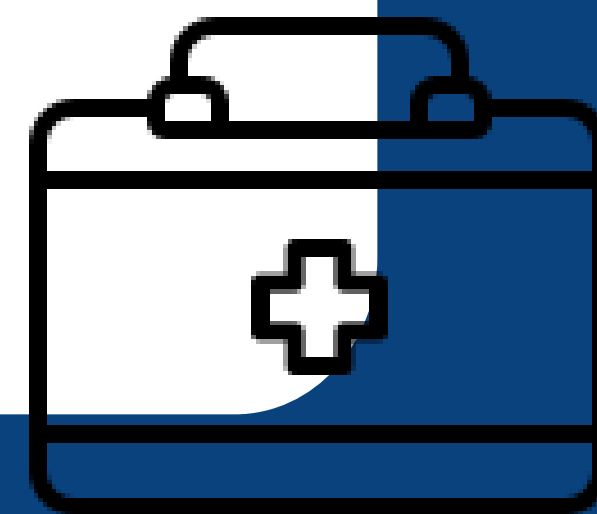
**Бупренорфін – наркотичний анальгетик,
похідний тебаїну, що має подвійну
природу.**

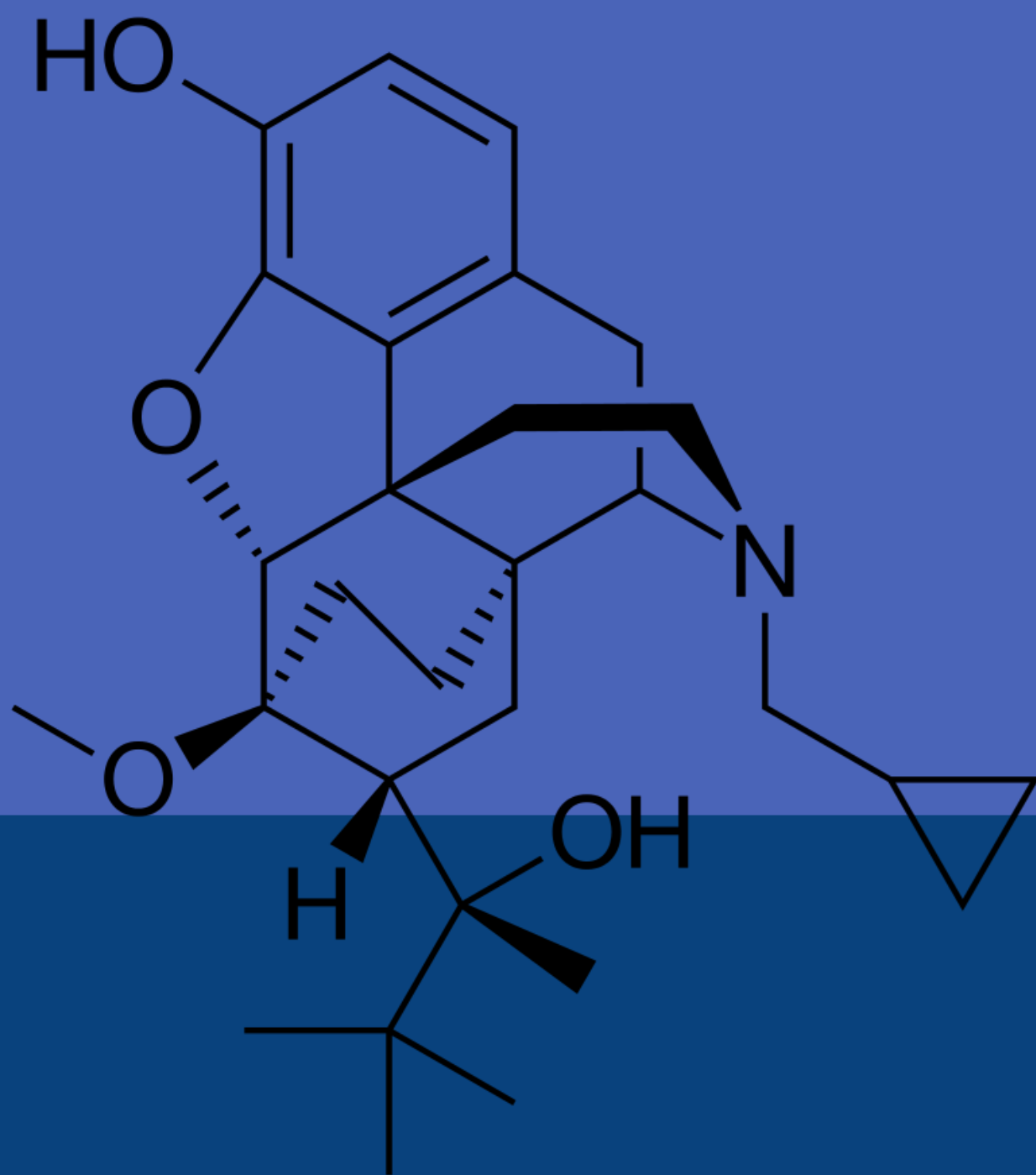




Бупренорфін – наркотичний анальгетик, похідний тебаїну, що має подвійну природу.

З одного боку, він активує μ - і δ -рецептори, але, водночас, зв'язується з κ -рецепторами і **блокує дію інших опіоїдів.**

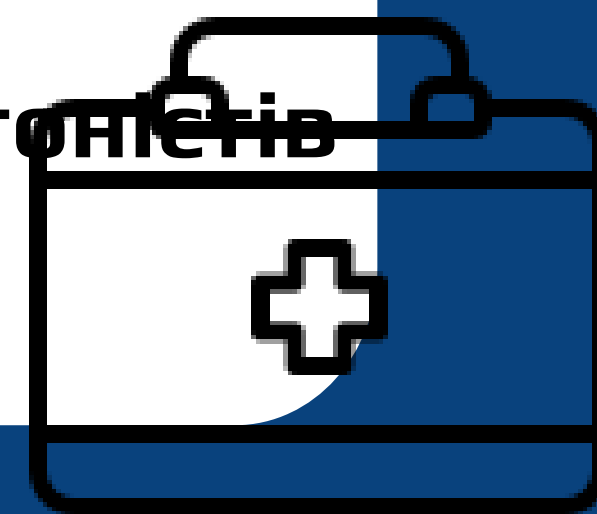


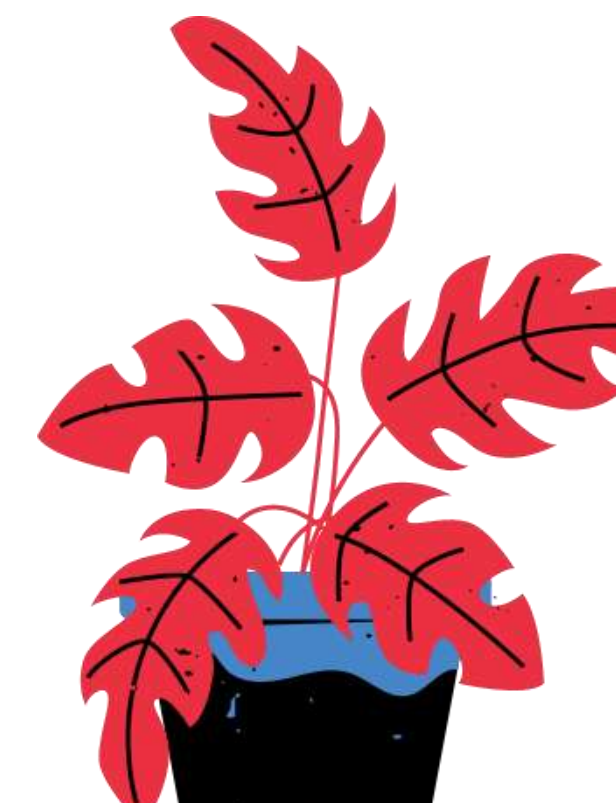


Бупренорфін – наркотичний анальгетик, похідний тебаїну, що має подвійну природу.

З одного боку, він активує μ - і δ -рецептори, але, водночас, зв'язується з κ -рецепторами і **блокує дію інших опіоїдів.**

Завдяки цьому він поєднує фармакологічні ефекти опіатних агоністів та антагоністів.





Максимальні рівні препарату в плазмі крові досягаються через **90-120 хвилин.**

Біодоступність: **30-35%** для сублінгвальних таблеток.



Біодоступність бупренорфіну при потраплянні через ШКТ є дуже низькою.

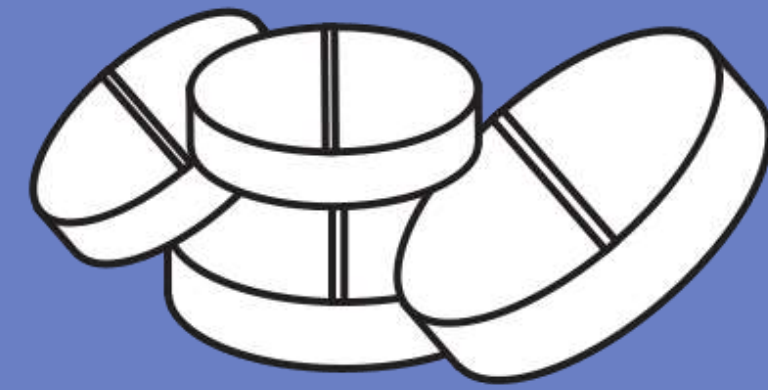


Біодоступність бупренорфіну при потраплянні через ШКТ є дуже низькою.

Метаболізується препарат здебільшого печінковим цитохромом 450 та ферментною системою у норбупренорфін та подальші метаболіти.

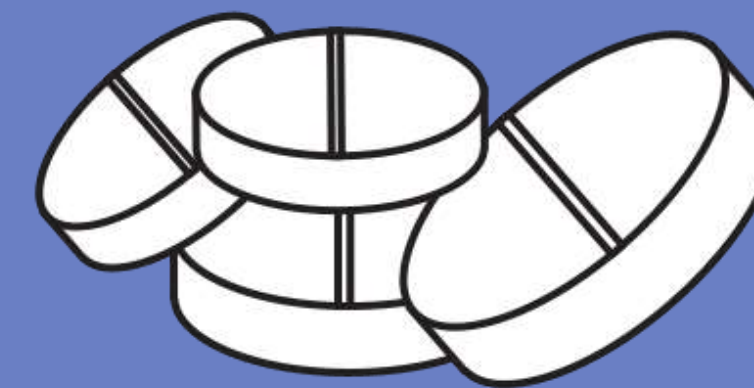


**Тривалість дії бупренорфіну є довшою. Період
напіввиведення з плазми: 24-37 год.**



Тривалість дії бупренорфіну є довшою. Період напіввиведення з плазми: **24-37 год.** Підвищення дози бупренорфіну не підсилює його дії, а лише продовжує її.

Правильно підібрана доза діє 24 години. Подвійна доза повинна продовжити дію препарату до 48 годин. Препарат можна застосовувати через день, або за схемою 4 рази на тиждень.



Бупренорфін має якості **часткового агоніста** μ -опіатних рецепторів і часткового антагоніста κ -рецепторів.



Бупренорфін має якості **часткового агоніста** μ -опіатних рецепторів і часткового антагоніста κ -рецепторів.

Він зв'язується з κ -рецепторами настільки міцно, що пригнічує дію інших агоністів.



Бупренорфін має якості **часткового агоніста** μ -опіатних рецепторів і часткового антагоніста κ -рецепторів.

Він зв'язується з κ -рецепторами настільки міцно, що пригнічує дію інших агоністів.

Його власна активність щодо μ - і δ -рецепторів є невисокою, а до κ -рецепторів – не виявляється взагалі.

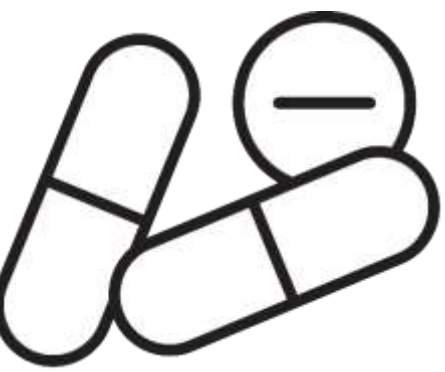


Бупренорфін частково є антагоністом
опіатних рецепторів.

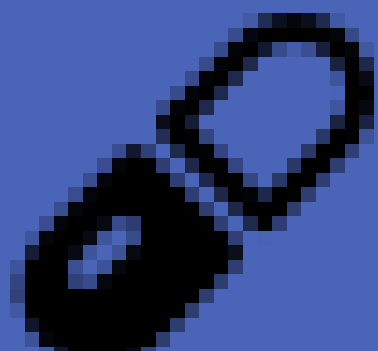
Бупренорфін частково є антагоністом
опіатних рецепторів.

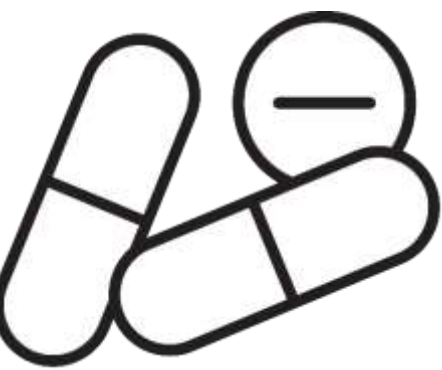
Основні клініко-
фармакологічні ефекти
агоністів:

- ейфорія,
- пригнічення дихання,
- сухість слизових оболонок



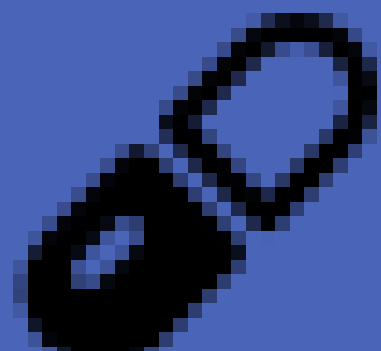
За підвищення дози агоністичні ефекти бупренорфіну збільшуються, але за досягнення певного порогу (**32 мг**) вони перестають рости, незважаючи на подальше збільшення дози.





За підвищення дози агоністичні ефекти бупренорфіну збільшуються, але за досягнення певного порогу (**32 мг**) вони перестають рости, незважаючи на подальше збільшення дози.

Тому **бупренорфін має низький ризик щодо передозування та виникнення побічних ефектів.**



Бупренорфін здатний витіснити з рецепторів повні агоністи та викликати **гострий преципітований синдром відміни.**



Бупренорфін здатний витіснити з рецепторів повні агоністи та викликати гострий преципітований синдром відміни.



Тому лікування рекомендують починати не раніше ніж **після 10-12 годин** після останнього прийому нелегального опіоїду, або через **24 години** після вживання метадону.



Відмінності між метадоном та бупренорфіном:

Бупренорфін

- щоденний прийом або прийом через день

Метадон

- щоденний прийом



Відмінності між метадоном та бупренорфіном:

Бупренорфін

- щоденний прийом або прийом через день
- менший потенціал зловживання

Метадон

- щоденний прийом
- більший потенціал зловживання



Відмінності між метадоном та бупренорфіном:

Бупренорфін

- щоденний прийом або прийом через день
- менший потенціал зловживання
- мені ризики передозування

Метадон

- щоденний прийом
- більший потенціал зловживання
- більші ризики передозування



Відмінності між метадоном та бупренорфіном:

Бупренорфін

- щоденний прийом або прийом через день
- менший потенціал зловживання
- мені ризики передозування
- ефективний для легкого та середнього ступеня залежності, та обмежена ефективність для сильної залежності

Метадон

- щоденний прийом
- більший потенціал зловживання
- більші ризики передозування
- ефективний для будь якого ступеня залежності та підходить для сильної залежності



Відмінності між метадоном та бупренорфіном:

Бупренорфін

- щоденний прийом або прийом через день
- менший потенціал зловживання
- мені ризики передозування
- ефективний для легкого та середнього ступеня залежності, та обмежена ефективність для сильної залежності
- менше утримання при лікуванні

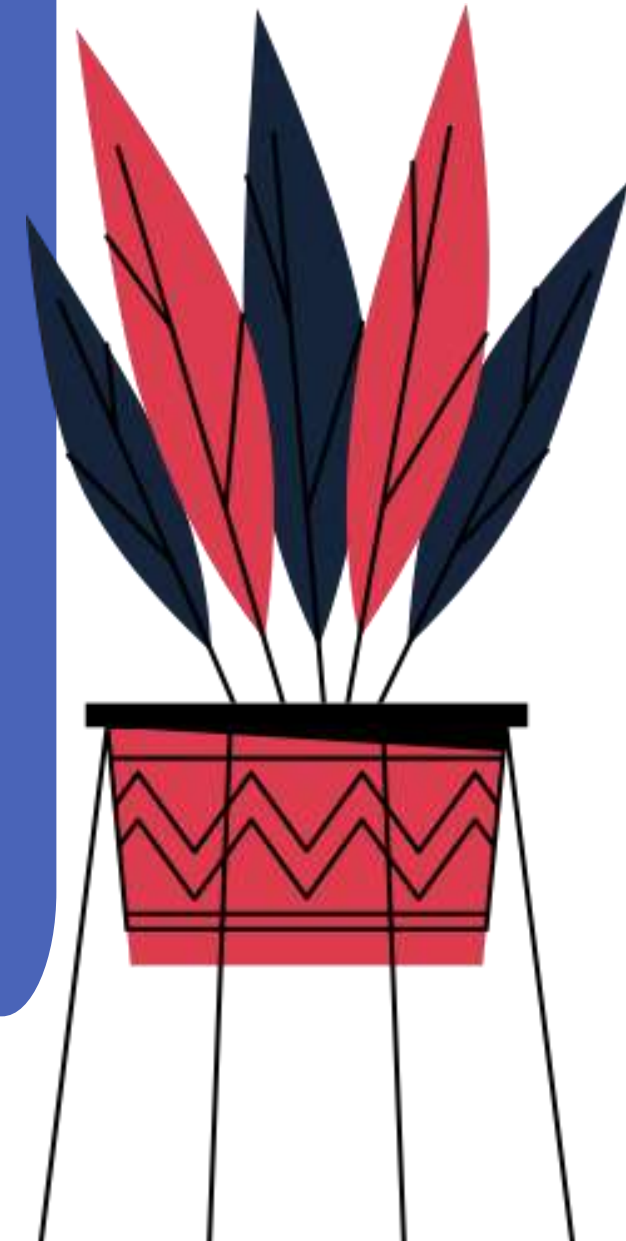
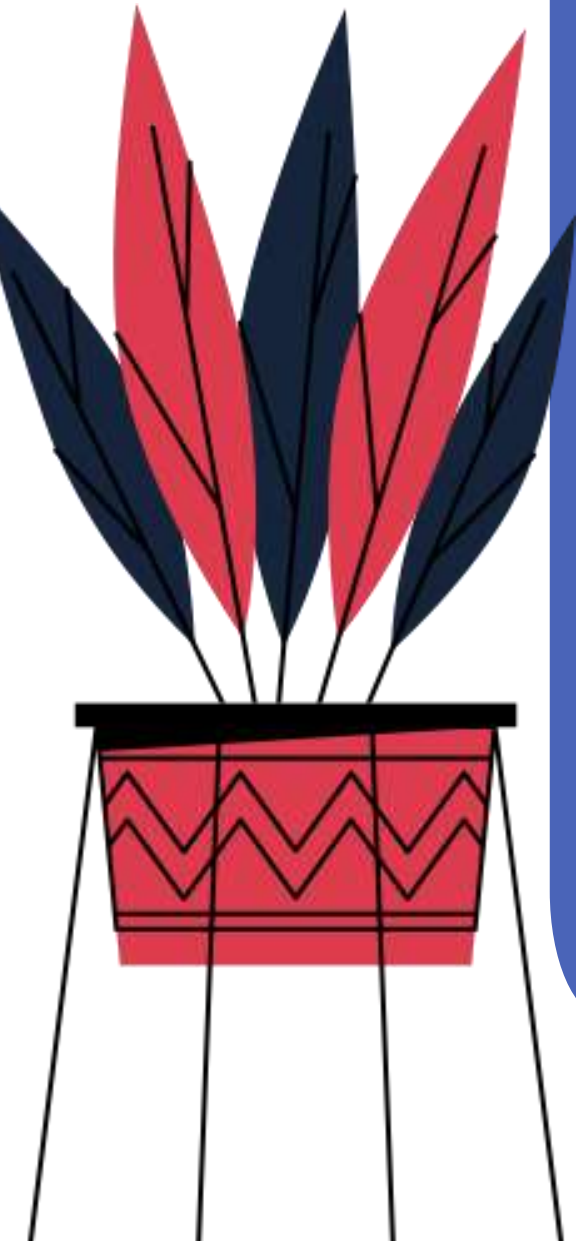
Метадон

- щоденний прийом
- більший потенціал зловживання
- більші ризики передозування
- ефективний для будь якого ступеня залежності та підходить для сильної залежності
- більше утримання в програмі



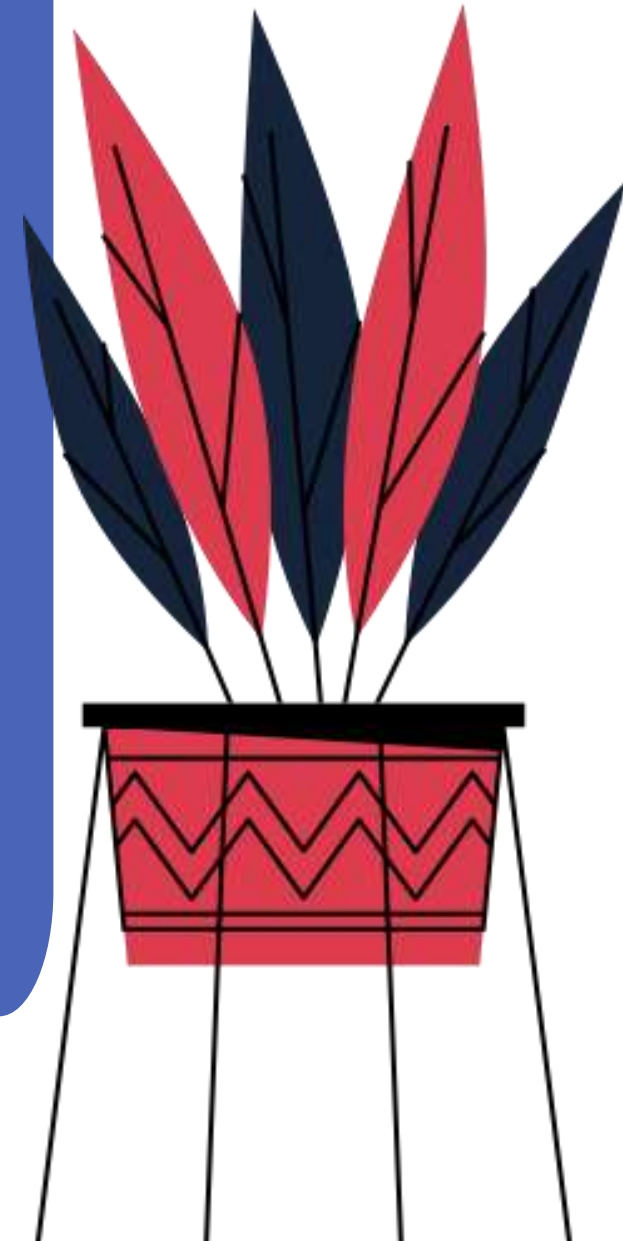
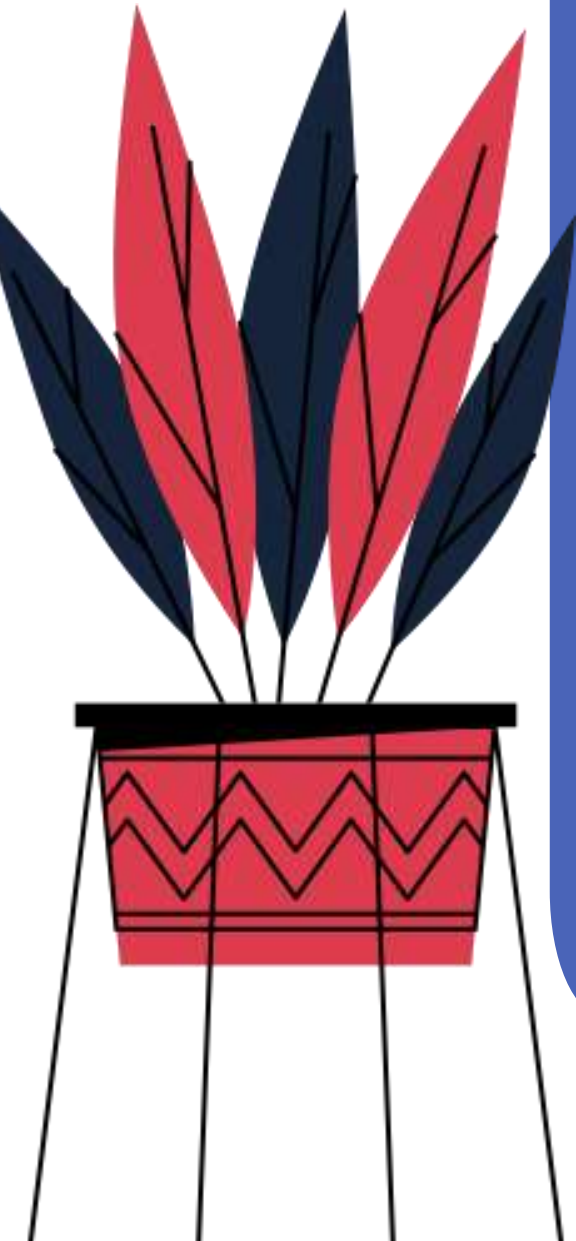
Підсумки:

- ❑ обидва препарати метадон та бупренорфін є **безпечними та ефективними лікарськими засобами;**



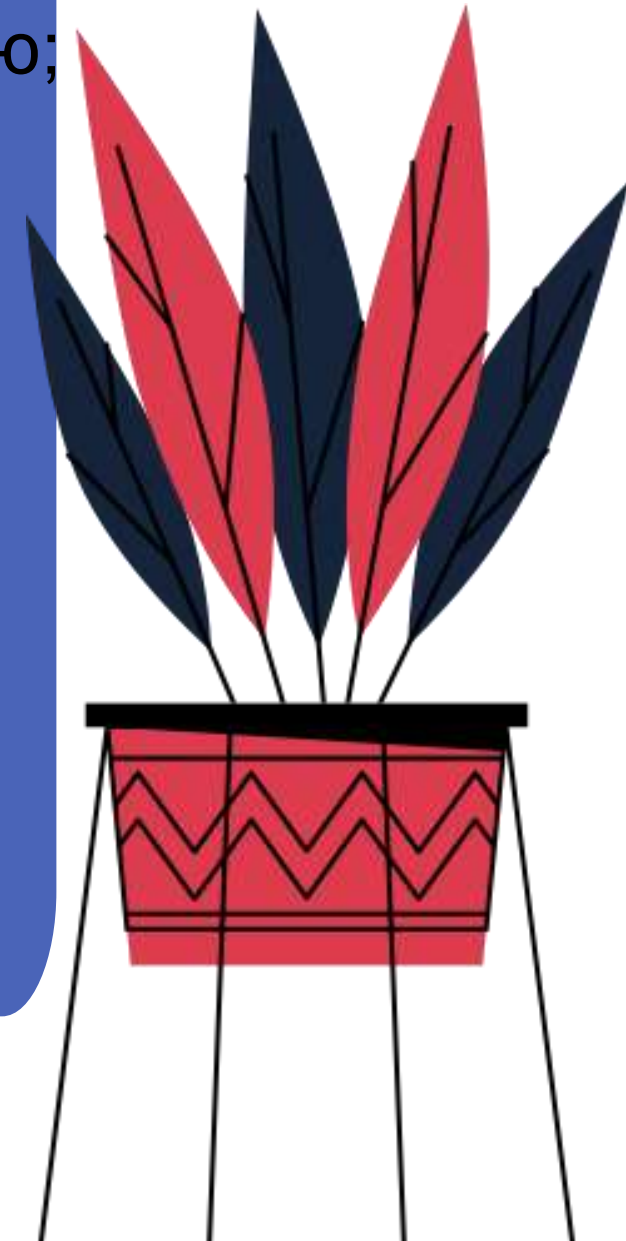
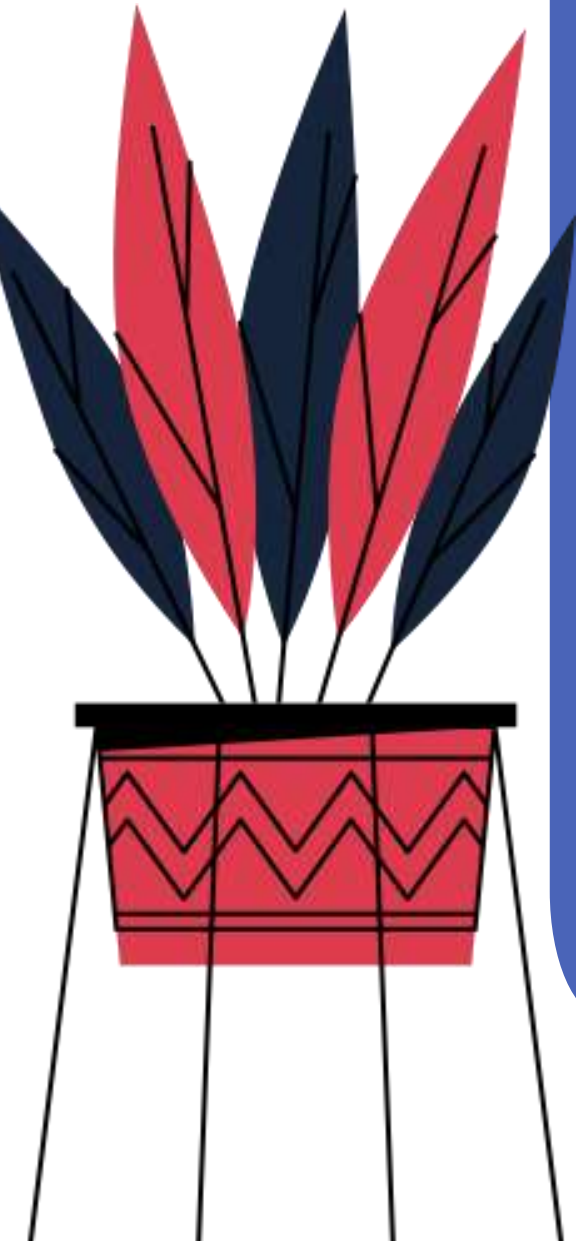
Підсумки:

- обидва препарати метадон та бупренорфін є **безпечними та ефективними лікарськими засобами**;
- рішення щодо призначення одного або іншого препарату має прийматись **індивідуально**;



Підсумки:

- ❑ обидва препарати метадон та бупренорфін є **безпечними та ефективними лікарськими засобами**;
- ❑ рішення щодо призначення одного або іншого препарату має прийматись **індивідуально**;
- ❑ особливості **метадону**: більш короткий порівняно з бупренорфіном період напіввиведення, необхідність щоденного прийому, більший потенціал зловживання та вищі ризики передозування, вищі показники утримання в лікуванні та кращий потенціал впливу для пацієнтів з сильною залежністю;



Підсумки:

- ❑ обидва препарати метадон та бупренорфін є **безпечними та ефективними лікарськими засобами**;
- ❑ рішення щодо призначення одного або іншого препарату має прийматись **індивідуально**;
- ❑ особливості **метадону**: більш короткий порівняно з бупренорфіном період напіввиведення, необхідність щоденного прийому, більший потенціал зловживання та вищі ризики передозування, вищі показники утримання в лікуванні та кращий потенціал впливу для пацієнтів з сильною залежністю;
- ❑ особливості **бупренорфіну**: можливість прийому через день, нижчі ризики передозування у результаті пролонгації дії препарату при збільшенні дози, менший потенціал зловживання, нижчі показники утримання в лікуванні та нижча ефективність для осіб з сильною залежністю.

