

Метадон

Опубликовано 8.8.2011.

Метадон – мощный синтетический опиоид. Применяется он в основном для утоления средней и тяжелой боли (таблетки Dolmed® 5 мг), а также при опиоидной заместительной терапии (напр. раствор Methadone Martindale Pharma® 2 мг/мл). Аналогично другим опиоидам, принимаемым для наркотического опьянения, метадон вызывает физическую и психическую зависимость.

Во всем мире метадон до сих пор является препаратом, широко применяемым в качестве сильного болеутоляющего средства. Применимость метадона для лечения зависимости от героина была впервые показана научным способом еще в 1965 году. Метадон является самым распространенным в Европе средством для опиоидной заместительной терапии. В Финляндии 40% пациентов, проходящих опиоидную заместительную терапию, получают метадон, что составляет более 700 пациентов. В Финляндии лиц, злоупотребляющих опиоидами, насчитывается ориентировочно 4–6 тыс. человек, и часто они употребляют разные препараты. О лицах, злоупотребляющих метадоном, точных цифр не имеется.

Механизм действия

Метадон действует в основном через μ -опиоидный рецептор центральной нервной системы. Метадон также способен предотвратить транспорт в клетку как серотонина, так и норадреналина. Предотвращение транспорта в клетку повышает эффективность болеутоляющего действия.

Метадон при приеме через рот впитывается быстро и хорошо, хотя встречаются значительные индивидуальные отклонения. Действие метадона начинается в течение 30–60 минут. Действие разовой дозы, применяемой для утоления боли, продолжается около 4 часов, но могут иметь место значительные индивидуальные отклонения. При постоянном употреблении средство действует дольше из-за накопления его в тканях; например, при опиоидной заместительной терапии метадон дается только раз в сутки. Ориентировочный срок полураспада составляет около суток. На вкус препарат – горький.

Влияния и вредные влияния

У лиц, не привыкших к опиоидам, метадон действует аналогично морфину. Метадон подавляет функцию центральной нервной системы, вызывая помутнение сознания и чувство удовольствия, чего и добиваются наркоманы. Тошнота, рвота и закупорка кишечника являются обычными вредными влияниями, как и отсутствие аппетита, сухость во рту, потливость и усталость. Также могут встречаться нарушения сексуальных функций, понижение АД, замедление сердцебиения и мышечные судороги. Кроме помутнения сознания, метадон может вызвать подавление дыхания, что считается одним из самых серьезных вредных влияний. Из-за воздействия на серотониновую систему употребление метадона увеличивает риск т.н. серотонинового синдрома.

При продолжительном употреблении организм привыкает к метадону, поэтому потребитель для достижения желаемого эффекта должен принимать все более значительные дозы. Организм привыкает также и к большинству вредных влияний, за исключением некоторых (закупорка кишечника и миоз, сужение зрачка глаза). При продолжительном употреблении метадон больше не вызывает чувства удовольствия, а, скорее всего, предотвращает появление абстинентного синдрома.

Абстинентный синдром

Быстрое прекращение продолжительного употребления метадона часто вызывает абстинентный синдром (таблица 1). Из-за длительного периода полураспада метадона абстинентный синдром выражен более слабо, чем при употреблении опиоидов кратковременного действия, но продолжается дольше. Симптомы появляются с задержкой и обостряются только на 4–6 день после прекращения приема. Обычно симптомы продолжаются в течение 10–12 суток, но могут продолжаться и дольше. Симптомы редко угрожают жизни.

Таблица 1. Основные симптомы абстинентного синдрома, вызванные опиоидами, в т.ч. метадоном.

Симптомы
Зевота, слабость, депрессия, жидкий стул, тошнота
Потливость, слюнотечение, слезливость, сильный насморк, чихание
Боли в мышцах, боли во внутренних органах, судороги кишечника, рвота
Беспокойство, нарушение сна, подавленность, дрожь, поведение, типичное для поиска наркотика
Отсутствие аппетита, уменьшение веса, расширение зрачков, частое сердцебиение, гусиная кожа
Повышение температуры тела, АД и частоты дыхания, чувство озноба

Злоупотребление и риск при передозировке

При продолжительном употреблении свойство метадона вызывать чувство удовольствия слабеет, но при внутривенном употреблении это свойство в некоторой мере сохраняется. При внутривенном приеме также достаточно меньшей дозы. По этим причинам метадон употребляется в качестве наркотика внутривенно. Внутривенное употребление легче вызывает зависимость. Метадон, являясь мощным опиоидом долговременного действия, считается особо опасным при внутривенном употреблении, но очень опасен также и при приеме через рот.

Дозы, применяемые при опиоидной заместительной терапии, являются смертельными для лиц, случайно употребляющих опиоиды, и опасными для опытных потребителей, особенно если в употреблении были перерывы. Для лиц, не привыкших к опиоидам, смертельная доза составляет порядка 50–100 мг. При внутривенном приеме эта доза меньше. При метадоновой заместительной терапии дневные дозы в начале курса при приеме через рот составляют 10–40 мг, а во время поддерживающей терапии – 60–120 мг. Если в ходе терапии будет пропущено несколько сеансов, последующие дозы должны быть уменьшены на 25–50 % с целью подготовки к уменьшению переносимости. К концу курса заместительной терапии дозы уменьшаются постепенно, например, на 2,5–5 мг в неделю.

Так как метадоновые препараты (таблетки, раствор), не предназначены для употребления внутривенно, в результате использования внутривенного способа в организм попадают вспомогательные вещества, которые могут закупорить кровеносные сосуды и вызывать различные инфекции. Возможны также глазные травмы.

Передозировку можно лечить налоксоном путем внутривенного вливания или внутримышечной инъекцией. Так как метадон обладает долговременным действием, налоксон, возможно, придется давать повторно, пока действие метадона не прекратится. В 2000-е годы в Финляндии случаи смерти, вызванные метадоном, увеличились во много раз. Часто в анамнезе указывается смешанное употребление ПАВ, особенно бензодиазепинов и алкоголя или других опиоидов.

Velî-Matti Surakka (Вели-Матти Суракка)
провизор

Основные источники ►

Corkery JM, Schifano F, Ghodse AH, Oyefeso A: The effect of methadone and its role in fatalities. Human Psychopharmacology: Clinical and Experimental 19(8): 565-576, 2004.

Davis MP: Methadone as a rescue for failed high-dose opiate therapy for catastrophic pain. Supportive Care in Cancer 8(2): 138-140, 2000.

European Monitoring Centre for Drugs and Drug Addiction (EMCDDA): Figure HSR-2. Estimated number of clients in opioid substitution treatment (OST) in EU 15–12, 1993–2008. Päivitetty viimeksi 4.1.2011.

Ferrari AS, Coccia CPR, Bertolini A, Sternieri E: Methadone – metabolism, pharmacokinetics and interactions. *Pharmacological Research* 50: 551-559, 2004.

Forsell M, Virtanen A, Jääskeläinen M, Alho H, Partanen A: Huuometilanne Suomessa 2010. Kansallinen huumevuosiraportti EMCDDA:lle. Terveyden ja hyvinvoinnin laitos, raportti 40/2010.

Gillman PK: Monoamine oxidase inhibitors, opioid analgesics and serotonin toxicity. *British Journal of Anaesthesia* 95(4): 434-441, 2005.

Hagelberg N, Pertovaara A: Opioidit. Kirjassa: Farmakologia ja toksikologia, ss. 343-362. 7. uudistettu painos. Toim. Koulu M, Tuomisto J, Kustannusosakeyhtiö Medicina, Kuopio 2007.

Hallinan R, Byrne A, Agho K, McMahon C, Tynan P, Attia J: Erectile Dysfunction in Men Receiving Methadone and Buprenorphine Maintenance Treatment. *The Journal of Sexual Medicine* 5: 684-692, 2008.

Inturrisi CE: Clinical Pharmacology of Opioids for Pain. *The Clinical Journal of Pain* 18(4): S3-S13, 2002.

Kalso E: Keskushermoston kautta vaikuttavat kipulääkkeet. Kirjassa: Lääketieteellinen farmakologia ja toksikologia, ss. 642-663. 3. uudistettu painos. Toim. Pelkonen O, Ruskoaho H., Kustannus Oy Duodecim, 2003.

Käypä hoito: Huumeongelman hoito. Suomalaisen Lääkäriseuran Duodecimin ja Päihdelääketieteen yhdistyksen asettama työryhmä, 2006.

Martindale: The Complete Drug Reference, 36 painos. Pharmaceutical Press, 2009.

Pharmaca Fennica 2011.

Ruuth P, Väänänen T: Päihdehuollon huumeasiakkaat 2008. Terveyden ja hyvinvoinnin laitos, tilastoraportti 14, 2009.

Surakka V-M: Metadoni-naloksoniyhdistelmävalmiste opioidikorvaushoidossa ja kliinisen tutkimuksen valmisteluprosessi. Pro gradu –tutkielma, proviisorin koulutusohjelma. Itä-Suomen yliopisto 2011.
https://epublications.uef.fi/pub/urn_nbn_fi_uef-20110078/.

Tacke U, Holopainen A, Kuoppasalmi K: Päihderiippuvuus. Kirjassa: Kliininen farmakologia ja lääkehoito, 2. uudistettu painos. Toimittanut: Neuvonen PJ, Backman JT, Himberg J-J, Huupponen R, Keränen T, Kivistö KT. Kandidaattikustannus Oy, 2011.

Uosukainen H: Buprenorfiini opioidikorvaushoidossa – kliininen selvitys naloksonin lisäämisen vaikutuksista ja komplianssin monitoroinnista elektronisen lääkepakkauksen avulla. Pro gradu –tutkielma, farmakologian laitos, Kuopion yliopisto 2009.

Uusi-Oukari M: Riippuvuus ja väärinkäyttö. Kirjassa: Farmakologia ja toksikologia, ss 419-446. 7. uudistettu painos. Toim. Koulu M, Tuomisto J, Kustannusosakeyhtiö Medicina, Kuopio 2007.

Vuori E, Ojanperä I, Nokua J, Ojansivu R-L: Oikeuskemiallisesti todetut myrkytyskuolemat Suomessa vuosina 2005-2007. *Suomen Lääkärilehti* 39(64): 3187-3195, 2009.

World Health Organization (WHO): Guidelines for the Psychosocially Assisted Pharmacological Treatment of Opioid Dependence, 2009. https://www.who.int/substance_abuse/publications/Opioid_dependence_guidelines.pdf.

link

Источник: <https://paihdelinkki.fi/ru/bank-informacii/informacionnye-izdaniya/medikamenty/metadon>