Mechanismus účinku NSA

Projekt IVA 2016FaF/3140/79, ÚHFT FaF VFU Brno
Autoři:, Mgr. Jiří Procházka, Mgr. Karolína Sochorová
PharmDr. Bc. Hana Kotolová, Ph.D.,

FOSFOLIPIDY

Fosfolipáza A_2

Různé stimuly
např: adrenalin, angiotenzin II, trombin.

Kortikosteroidy
Např: kortizol působením na kortikoidní receptor vyvolá tvorbu lipokortinu, který inhibuje fosfolipázu A_2

Produkty oxidace

CYP 450

Arachidonová kyselina

Lipooxygenáza LO

Cyklooxygenáza COX

PGG_2

Leukotrieny

Zablokováním cyklooxygenázové cesty se zvýší aktivita lipooxygenázy ta syntetizuje leukotrieny, které u predisponovaných jedinců mohou vyvolat bronchokonstrikci až astmatický záchvat: ´´aspirinem indukované astma´´.

Prostaglandiny

PGH_2

Účinky konstitučně tvořených prostaglandinů (COX1).

- PGE snižují tvorbu HCl v žaludku a tvoří ochranný hlen.
- PGE_2 má význam pro udržení průtoku krve ledvinami.
- PGE_2 a PGF mají fyziologické účinky při porodu.
- PGA, PGE a PGI_2 snižují arteriální tlak.

Účinky indukovaně tvořených prostaglandinů (COX2)
(IL-1 a TNFα jsou citokíny zvyšující aktivitu COX2)

- PGE_1 a PGE_2 v hypotalamu nastavují vyšší tělesnou teplotu (horečka).
- Působí jako mediátory zánětu způsobují dilataci cév (zarudnutí), zvyšují tělesnou teplotu, zvyšují permeabilitu cév (vzniká otok), potencují trvání a intenzitu bolesti vyvolanou histaminem a bradykininem.

Působením NSA se snažíme zablokovat indukovaně tvořené prostaglandiny (COX2), abychom zmírnili zánět, bolest a horečku, avšak u neselektivních a preferenčních NSA dochází k blokádě i (COX1) která konstitučně vytváří prostaglandiny, které jsou pro tělo prospěšné.

Prostacyklin

PGI_2: vazodilatace, snižuje agregaci trombocytů

Tromboxan

Vazokonstrikce, zvyšuje agregaci trombocytů

NSA
Nesteroidní antiflogistika se dělí podle působení na jednotlivé izoformy COX

- **neselektivní** (např. ibuprofen, diklofenak).
- **preferenční pro COX2** (např. meloxikam, nimesulid).
- **selektivní COX2** (koxiby).

Zdroje: Lincová D., Základní a aplikovaná farmakologie, Copyright galén, 2002 ISBN 80-7262-168-8
Lüllmann H., Atlas farmakologie, Slovakofarma Grada, 1994 ISBN 80-7169-088-0
Martínková J., Farmakologie pro studenty zdravotnických oborů, Grada 2007, ISBN 978-80-247-1356-4