

Opiater

Nikolaj Vinther

Overlege LAR
Spesialist i almenntmedisin

Oprindelse

- Opioiderne utvinnes fra valmueplanten.
- Den ubehandlede plantesaft kaldes råopium.
- Binder sig til opioid reseptorerne.
- Morfin og kodein er de mest kjente.
- Heroin er det mest kjente illegale rusmiddel i opioid familien.
- Der omsettes hvert år for ca. 1500 milliarder kr heroin (2004)

Historie

- Heroin blev fremstillet av den britiske kjemikeren Wright i 1874.
- Bayer AG registrede Heroin (fra heroisk) som varemerke og mellom 1898 til 1910 markedsførte det som en ikke avhengighetsskapende erstatning for morfin og som hostemedisin for barn.
- 1914 blev heroin forbudt i USA

Historie

- Opium er beskrevet brukt 300 f. kr. Blev brukt mot diarre og som sovemiddel.
- Opium blev brukt som “betalingsmiddel” omkring år 1800, da englænderne ville kjøpe porcelæn og silke i Kina.
- Kina forbød opium og prøvde at stoppe englænderne.
- Opiumskrigen – england vandt og fikk erstatning og Hongkong.

Egenskaper

- Fælles for opioiderne er at de har god fedtopløslighet og passerer lett til hjernen.
- Heroin er mere potent end morfin, og jo mere potent, jo lettere blir man avhengig.
- Spiser man opioder vil en del blive nedbrudt i magetarm kanalen, hvorfor det er mere populært at injisere eller røyke.

Egenskaper

- Reseptorer: My, delta og kappa.
- Aktiverer belønningssystemet.
- My er viktigst.

Agonister

- Fremkalder fysiologisk respons.
- Konkurrerer ligeverdigt om reseptorer. (har samme affinitet)
- Forskellig halveringstider.
- Metadon lang halveringstid. 1 gang pr døgn
- Heroin kort halveringstid. 3-5 gange pr døgn
- Morfin, kodein, Oxynorm, Dolcontin

Antagonister

- Blokerer reseptorer og gir ikke fysiologisk respons.
- Nalokson og naltrexon.
- Naltrexon har ca. 17 timers halveringstid.
- Nalokson har 60-90 min halveringstid.

Partielle antagonister

- Buprenorfin: Subutex og Suboxone.
- Høj affinitet.
- Agonister kommer ikke til.
- Ikke så kraftig fysiologisk effekt.
- Lang halveringstid.
- Mindre farligt end agonister.
- Agonist overfor reseptorer, “antagonist” overfor andre agonister. Blokerer kappa og delta.

Fysiologisk effekt

- Smertestillede effekt ved at blokere smertesignaler til og i hjernen.
- Euforisk virkning. Velvære, likegyldighet, tilfredshet og angstdempende.
- Euforien blir mindre intenst og man utvikler toleranse.
- Senere tas det for velvære, undgå at møte “virkeligheten” og modvirke abstinenser.

Bivirkninger

- Hemmer respirasjonen.
- Kvalme, svimmelhet, oppkast og hodepine.
- Nedsetter tarmens bevegelighet.
- Imodium.
- Påvirker det endokrine system.
- Nedsetter stofskifte.
- Senker testosteron – metadon.

Abstinenser

- Rendende nese, tåreflåd, gaper, hyperventilasjon, hyperthermi, mydriasis, oppkast, diare, angst.
- Morfin/heroin – starter etter 6-10 timer. Høyest etter 36-48 timer. Varer 5 dage til måneder.
- Metadon: Flere dage innen det når høyeste nivå.
- Craving kan vare ... resten av livet.