

奥赛利定在围手术期多模式镇痛的研究进展

陆红文

广西壮族自治区人民医院, 中国·广西 南宁 530000

摘要: 奥赛利定作为 G 蛋白偏向性 μ -阿片受体激动剂, 可优先激活 G 蛋白通路产生镇痛效应, 同时减弱 β -arrestin 信号通路介导的不良反应, 为围手术期多模式镇痛提供新选择。奥赛利定相较于传统阿片类药物不良反应发生率更低, 能够更好地适配围手术期多模式镇痛策略, 契合加速康复外科 (ERAS) 诊疗理念。本文综述奥赛利定的药理特征、作用机制及其在多模式镇痛中的应用进展, 为其在临床术后疼痛管理中的应用提供用药依据。

关键词: 奥赛利定; 围手术期; 多模式镇痛

Advances in Opioid-Sparing Multimodal Analgesia in the Perioperative Period

Lu Hongwen

Guangxi Zhuang Autonomous Region People's Hospital, China Guangxi Naning 530000

Abstract: Oxalidine, as a G protein biased μ -opioid receptor agonist, can preferentially activate the G protein pathway to produce analgesic effects, while reducing adverse reactions mediated by the β -arrestin signaling pathway, providing a new option for perioperative multimodal analgesia. Compared to traditional opioid drugs, oxalidine has a lower incidence of adverse reactions and can better adapt to multimodal analgesia strategies during the perioperative period, which is in line with the principles of Enhanced Recovery Surgery (ERAS) diagnosis and treatment. This article reviews the pharmacological characteristics, mechanism of action, and application progress of oxalidine in multimodal analgesia, providing a medication basis for its application in clinical postoperative pain management.

Keywords: Oxalidine; Perioperative period; Multi mode analgesia

0 引言

围手术期中重度急性疼痛会诱发强烈应激反应, 延缓术后康复, 多模式镇痛是主流管理方案。传统阿片药易引发呼吸抑制、恶心呕吐及成瘾等不良反应, 镇痛与安全性难以兼顾。奥赛利定作为新型偏向性 μ 受体激动剂, 可实现强效镇痛与副作用分离, 适配快速康复理念^[1-2]。本文梳理其药理机制及临床优势, 提出优化策略, 展望其发展前景, 为临床规范化用药提供参考。

1 奥赛利定的药理特征与镇痛机制

1.1 药理特征

奥赛利定属于临床上新型的阿片类镇痛药物, 主要运用于围手术期中到重度急性疼痛的处理, 是近些年多模式镇痛中重要的核心用药^[3]。相较于传统的均衡型 μ 受体激动剂, 本品对 μ 受体的选择性更高, 在靶向镇痛方面的特异性更强; 静脉给药后一般 1~2 min 起效, 6~12 min 达到镇痛峰值, 消除半衰期为 1.3~3 h^[4], 可以快速建立起

平稳镇痛效果, 适合术后 PCA 按需给药。药物主要通过 CYP3A4、CYP2D6 酶系代谢, 代谢后生成的产物没有药理活性, 体内蓄积的风险低。

1.2 镇痛机制

奥赛利定镇痛核心靶点为中枢脊髓和脑区的痛觉调控区域 μ 阿片受体, 通过调节痛觉传导通路阻断伤害性信号向上传递, 药物与 MOR 特异性结合后, 更倾向于启动抑制性 G 蛋白信号通路, 抑制腺苷酸环化酶并降低胞内 cAMP 水平, 阻滞 P 物质、谷氨酸等疼痛相关神经递质的释放。本品属于功能性偏向配体, 其 G 蛋白激活效力明显高于吗啡, 但对 β -arrestin-2 蛋白的募集能力仅为吗啡的 14%, 可大幅弱化 β -arrestin-2 介导的受体脱敏、内化级联反应, 而 β -arrestin-2 通路是传统阿片类药物引起呼吸抑制、恶心呕吐及便秘的主要原因之一, 奥赛利定通过通路偏向性实现强效镇痛与不良反应分离, 信号激活的专一性更高, 镇痛表现更突出, 围术期使用的安全性更优。

2 奥赛利定在围手术期多模式镇痛的临床优势

2.1 镇痛效果强效稳定，适配围手术期急性疼痛管理

奥赛利定为 G 蛋白偏向性的受体激动剂，其镇痛效价强度约为吗啡的 5 倍，具有起效快、镇痛强度高、药效平稳等主要优势。该药采取静脉给药后能够快速起效，其镇痛维持时间优于常规阿片类药物，并且作用靶点专一。临床对照研究显示，患者在术后早期的静息 NRS 疼痛评分可以被控制在 2 分左右，显著低于吗啡对照组，疼痛缓解的应答率更优。在多模式镇痛方案里，本品能够迅速控制术后爆发痛，有效弥补非甾体类药物镇痛强度不足的问题，持续降低患者围手术期的整体疼痛水平。

邬薇薇、李元海研究发现奥赛利定 0.3mg/kg 复合氟比洛芬酯 150mg 用于后路腰椎开放性手术患者 PCIA 中可提供优质的镇痛效果，减轻炎症反应，提高术后舒适度，促进患者术后快速康复^[5]。龙师琼、张玲研究发现奥赛利定联合 TAPB 对腹腔镜结直肠癌根治术患者术后镇痛和抗炎治疗具有较好的临床疗效，能够有效减轻患者的疼痛程度，降低患者的血清炎症因子水平，从而缓解术后炎症反应，促进康复^[6]。张亚娜^[7]等研究发现奥赛利定联合髂筋膜间隙阻滞用于老年股骨粗隆间骨折术，能减轻疼痛及炎症反应，减少不良反应，有助于术后康复。蔡永亮^[8]等研究发现相较于舒芬太尼，奥赛利定静脉自控镇痛用于老年患者胸腔镜肺切除术后可明显降低咳嗽相关疼痛强度，减少补救镇痛需求，提升患者术后恢复质量，并降低恶心发生率，加速患者术后康复。何红霞^[9]等研究发现奥赛利定用于腹腔镜子宫切除术后，可以减少阿片类药物用量，减少不良反应的发生，有利于患者术后康复。

2.2 不良反应发生率低，围手术期用药安全性更高

相较于传统的均衡型 μ 受体激动剂，奥赛利定依托 G 蛋白偏向通路机制，在强效镇痛同时大幅度削弱 β -arrestin-2 介导的不良反应，围术期不良事件的发生率更低。Soergel^[10]等研究显示，与吗啡比较，奥赛利定引起的呼吸抑制时间短，且恢复速度快。奥赛利定的半衰期为 $(44.3 \pm 6.1) \text{ min}$ ，而吗啡为 $(214 \pm 27) \text{ min}$ 。本品在体内主要经肝脏代谢，并生成无活性产物，一般不存在体内蓄积的风险，因此即使在术后进行持续泵注，不良反应叠加的风险仍然处于可控范围。

2.3 适配多模式镇痛理念，促进患者快速康复

奥赛利定通路特异性强，药物兼容性佳，能够与各

类镇痛手段协同联用，是围术期多模式镇痛中理想的阿片类药物。多靶点联合镇痛可减少 30%–50% 阿片药物用量，降低剂量相关不良反应，减少大剂量阿片暴露潜在的耐受风险。其强效镇痛和低不良反应的双重优势，还可缩短患者术后卧床时间、减少肺部感染及肠梗阻等并发症发生率，与快速康复外科的核心目标十分契合。

3 优化奥赛利定围手术期多模式镇痛应用的主要策略

3.1 完善循证研究，建立标准化个体化用药方案

针对奥赛利定临床应用时间短、缺少统一用药规范的问题，应继续推进大样本、多中心的临床对照研究，不断补足不同术式、不同年龄段以及合并不同基础疾病患者的用药资料，通过系统的整理与分析，明确该药在各类手术中的镇痛效果、合适剂量、输注时长，以及与其他药物联合使用时的安全性^[11]。同时，临床上也应更强调个体化给药思路，结合患者体重、肝肾功能、手术创伤程度与疼痛耐受等差异，对奥赛利定的使用剂量作更准确的调整。

3.2 严格把控用药指征，强化不良反应监测管理

鉴于奥赛利定存在阿片类药物固有的不良反应风险，临床上需要严格地掌握用药指征，做好适用人群的筛选，对老年人、肝肾功能不全者、呼吸功能相对薄弱的高危患者应当考虑适当减量，并缩短用药时间。在围手术期的使用过程中，应建立更为完善的生命体征监测体系，连续观察患者的呼吸频率、血氧饱和度、意识状态以及胃肠道反应，对可能出现的头晕、恶心、呼吸抑制等不良反应做到尽早发现并尽早处理。同时，医护人员还需要系统了解该药的药理特点与应急处理流程，按照规范进行药物配置，控制泵注速度，并把握停药时机，通过加强全程监测与更细的管理，可以有效降低用药风险，保障围手术期患者的诊疗安全。

3.3 优化用药结构，降低医疗成本并推广基层应用

为缓解奥赛利定定价高、在基层推广不足的问题，临床上可以依托多模式镇痛的理念，采用“低剂量奥赛利定 + 非甾体药物 + 局部阻滞”的联合方案，通过多靶点的协同镇痛减少奥赛利定单独使用时的用量，在保证镇痛效果的前提下，也能有效地控制医疗费用。医疗机构还可结合药品集采等政策，调整并优化新药的采购渠道，逐步压低临床用药成本^[12]。其次，需要加强对基层医护人员的专项培训，普及奥赛利定的药理优势、给药方法以及适用范围，提升基层医院对新型镇痛药物的认识程度与实际应用能力。通过优化用药结构、降低治疗负担、完善基层宣教等措施，

可以逐渐扩大奥赛利定在临床中的适用范围，推动其在各级医院围手术期镇痛中的规范化应用^[13]。

4 奥赛利定在围手术期多模式镇痛中应用的未来展望

4.1 循证体系持续完善，实现精细化个体化镇痛

随着奥赛利定的临床研究逐步推进，未来将依托多中心、大样本临床试验，并在不同手术类型、不同年龄层次以及高危人群等方面，逐渐补足相关用药数据，完善现有循证医学体系。现阶段该药进入临床应用的时间仍偏短，标准化的用药方案也还尚未形成统一的共识，后续研究将重点探索个体化给药剂量的确定及合适的联合配伍方式，逐步形成权威的围手术期镇痛用药指南^[14]。结合患者体重、肝肾功能、基础疾病情况以及疼痛敏感度的差异等因素，可建立更精准的给药模型，从而逐步摆脱过去传统的给药模式^[15]。

4.2 适配快速康复理念，拓宽特殊人群应用场景

奥赛利定依靠其较强的选择性镇痛作用、不良反应少以及血流动力学稳定等特点，与快速康复外科的核心理念高度契合，未来将成为多模式镇痛体系中的核心药物。与传统阿片类药物相比，其呼吸抑制及恶心呕吐发生率更低，能够有效减轻手术带来的应激反应。未来的临床应用还可能进一步扩展到老年患者、肥胖患者、睡眠呼吸障碍人群以及心肺功能较弱等高危患者之中，以便更充分地体现其安全性优势^[16]。同时，该药对术后神经认知功能的影响较小，有助于降低老年患者发生术后认知障碍的风险，在高龄患者手术及胸腹部大手术中的使用比例预计会继续提高，临床适用场景更加全面广泛。

4.3 推动基层普及

现阶段奥赛利定使用成本相对较高，但伴随药品集采政策持续推进落地，未来有望推动该药物在基层医疗机构普及与规模化应用。与此同时，随着临床学术推广持续开展、基层医师用药经验逐步丰富以及规范化镇痛培训体系不断完善，基层医疗机构将逐步建立成熟的用药体系，熟练掌握奥赛利定在多模式镇痛策略中的联合配伍与临床实施方案。

5 结语

奥赛利定用于围手术期多模式镇痛时，具有镇痛强、不良反应少及契合快速康复的独特优势^[10]，但目前仍受到一些条件限制，包括循证数据不足、用药成本高及阿片类固有风险等。后续工作上，首先需要完善大样本的临床研究证据，其次推进低剂量的联合镇痛方案，同时加强基层

环节的用药培训与规范化使用。随着集采政策逐步落地，该药有望走向精细化、覆盖面更广的应用，并在舒适化医疗中成为关键的镇痛药物。

参考文献：

- [1] 郭磊, 姜文霞, 汪贺等. 奥赛利定静脉自控镇痛对老年胸腔镜肺癌切除术的有效性安全性[J]. 中国老年学杂志, 2025,45(14):3378-3381.
- [2] Ventriglia E, Rizzo A, Gomez JL, et al. Essential role of Pglycoprotein in the mechanism of action of oliceridine[J]. Neuropsychopharmacology, 2023, 48(5):831-842.
- [3] 苏娅萍. 奥赛利定的作用机制、药理作用以及临床应用[J]. 中国药物滥用防治杂志, 2024,30(4):583-586.
- [4] 王惠霞, 刘岩, 高成杰等. 奥赛利定在无痛诊疗中的研究进展[J]. 实用药物与临床, 2026,29(6):466-470.
- [5] 郭薇薇, 李元海. 奥赛利定静脉自控镇痛对后路腰椎开放性手术患者术后恢复质量的影响[J]. 临床麻醉学杂志, 2026,42(4):378-383.
- [6] 龙师琼, 张玲. 奥赛利定联合腹横肌平面阻滞对腹腔镜结直肠癌根治术患者术后镇痛与炎性反应的影响[J]. 药品评价, 2025,22(2):194-198.
- [7] 张亚娜, 王元, 刘小萌等. 奥赛利定联合髂筋膜间隙阻滞对老年股骨粗隆间骨折术后康复质量的影响[J]. 世界临床药物, 2026,47(2):143-148.
- [8] 蔡永亮, 孙合亮, 江逸豪等. 奥赛利定与舒芬太尼静脉自控镇痛对老年胸腔镜肺切除术后疼痛和恢复质量的比较研究[J]. 实用老年医学, 2026,40(6):607-612.
- [9] 何红霞, 陈鸣岐, 王冬红等. 奥赛利定与舒芬太尼在腹腔镜子宫切除术后镇痛的比较[J]. 锦州医科大学学报, 2026,47(1):42-46.
- [10] Soergel DG, Subach RA, Burnham N, et al. Biased agonism of the μ -opioid receptor by TRV130 increases analgesia: crossover study in healthy volunteers[J]. Pain, 2014, 155.
- [11] 刘茹. 奥赛利定注射液联合环泊酚用于腹腔镜手术的临床效果观察[J/OL]. 中国典型病例大全, 1-8[2026-07-30].
- [12] 袁沐兆, 马海平. 奥赛利定在围手术期镇痛中的研究进展[J]. 麻醉安全与质控, 2026,8(1):87-91.
- [13] 田焯晖, 费宏亮. 奥赛利定在腹腔镜肝血管瘤射频消融术围术期麻醉管理中的效果[J]. 智慧健康, 2025, 11(14):72-75.

[14] 余剑鹏, 刘颖, 陈诗怡等. 奥赛利定的临床应用进展[J]. 实用药物与临床, 2025,28(2):156-160.

[15] ZHUANG Y, WANG Y, et al. Molecular recognition of morphine by the human μ -opioid receptor[J]. Cell, 2022,185(23):4361-4375.

[16] 李格, 高宇杰, 刘文钢等. 奥赛利定或舒芬太尼在无痛苦胃镜检查中的应用效果[J]. 临床麻醉学杂志, 2024, 40(12):1259-1263.

作者简介: 陆红文 (1987.10-), 女, 壮族, 广西省南宁市, 硕士研究生, 主治医师, 麻醉科。