

В НАСТОЯЩЕЕ ВРЕМЯ, БОЛЬ РАССМАТРИВАЕТСЯ КАК ПРОБЛЕМА, ИМЕЮЩАЯ НЕ ТОЛЬКО МЕДИЦИНСКОЕ ЗНАЧЕНИЕ, НО И СОЦИАЛЬНО-ЭКОНОМИЧЕСКОЕ. ЛЕЧЕНИЕ БОЛИ ЯВЛЯЕТСЯ ОДНОЙ ИЗ НАИБОЛЕЕ ТРУДНЫХ ЗАДАЧ КЛИНИЧЕСКОЙ МЕДИЦИНЫ. НЕАДЕКВАТНОЕ ОБЕЗБОЛИВАНИЕ ЧАСТО ПРИВОДИТ К ЗАМЕДЛЕНИЮ ВЫЗДОРОВЛЕНИЯ, УВЕЛИЧЕНИЮ ФИНАНСОВЫХ ЗАТРАТ НА ЛЕЧЕНИЕ И УХУДШЕНИЮ ИСХОДА БОЛЕЗНИ, СНИЖЕНИЮ КАЧЕСТВА ЖИЗНИ, РАЗВИТИЮ КАРДИОВАСКУЛЯРНЫХ ОСЛОЖНЕНИЙ (АРТЕРИАЛЬНАЯ ГИПЕРТЕНЗИЯ, НАРУШЕНИЯ РИТМА СЕРДЦА И ДР.).

Ибупрофена аргинат: новое решение старых проблем при применении НПВП*

Д.А. Сычев,
д-р. мед. наук,

Н.В. Емельянов,

ММА им. И.М. Сеченова



Для уменьшения болевых ощущений в медицине, используют несколько классов лекарственных средств:

- “простые” анальгетики – нестероидные противовоспалительные препараты (НПВП), которые объединяются термином – ненаркотические анальгетики;
- реже, при сильных болях – центральные анальгетики (трамадол), включая опиоидные анальгетики.
- НПВП – наиболее широко используемые в клинической практике лекарственные средства. Их применение не сопровождается формированием зависимости.

Механизм действия НПВП состоит в их способности блокировать фермент циклооксигеназу-2 (ЦОГ-2) в очаге воспаления, снижая тем самым чувствительность нервных окончаний к медиаторам боли.

Однако, большинство НПВП блокируют не только ЦОГ-1 в очаге воспаления, но и ЦОГ-2 в “нормальных” клетках, тем самым, снижая синтез “полезных” простаноидов, что лежит в основе механизма развития нежелательных лекарственных реакций при применении НПВП. Так, блокируя ЦОГ-1 в слизистой желудка, НПВП вызывает образование эрозий и язв желудка (т.н. НПВП-гастропатии).

Эта особенность НПВП считается очень опасной (частота развития до 15% при длительном применении) т.к. может приводить к серьезным осложнениям, и, прежде всего – желудочно-кишечным кровотечениям.

Предпринималось несколько попыток повысить безопасность НПВП. Создание кишечнорастворимых лекарственных форм НПВП не привело к значительному снижению риска НПВП-гастропатий.

Присоединение к НПВП синтетического аналога мизорастола снижает риск НПВП-гастропатий, но часто осложняется развитием диареи, что резко снижает качество жизни больных и является причиной отказа от дальнейшего лечения.

Сочетание НПВП и ингибиторов протонной помпы (омепразол и др.) снижает риск НПВП-гастропатий, и рекомендуется больным с высоким риском их развития (язвенная болезнь и желудочно-кишечное кровотечение в анамнезе, старческий возраст и т.д.). Однако такое лечение достаточно дорого.

Низкой частотой развития НПВП-гастропатий отличаются препараты из группы селективных ингибиторов ЦОГ-2 (целекоксиб и рофекоксиб), однако результаты последних исследований показали, что длительное применение препаратов сопровождается увеличением риска инфаркта миокарда и сердечной недостаточности. Этот факт послужил причиной снятия с регистрации рофекоксиба и резкого ограничения в применении целекоксиба: он не рекомендован пациентам с высоким сердечно-сосудистым риском.

К ним относится большинство пациентов пожилого и старческого возраста, наиболее часто принимающих НПВП.

Описанные выше обстоятельства заставили искать новые подходы к повышению безопасности НПВП. В результате был разработан препарат ибупрофена аргинат. ибупрофен является хорошо известным и широко применяемым НПВП, чаще всего – в качестве анальгетика. Он является наиболее безопасным препаратом в отношении развития НПВП-гастропатий.

Разработка ибупрофена аргината, позволило повысить безопасность данного препарата как в отношении риска развития НПВП-гастропатий, так и сердечно-сосудистого риска. Это достигается

* Статья подготовлена при поддержке компании “Замбон С.П.А.”



благодаря уникальным эффектам аминокислоты L-аргинина. Большинство из них связано с тем, что она участвует в образовании оксида азота, который способствует протекции слизистой желудка и нормальному функционированию эндотелия сосудов. Ибупрофена аргинат оказывает незначительное воздействие на слизистую желудка по сравнению с другими НПВП. Можно ожидать, что и сердечно-сосудистый риск не увеличивается при применении этого препарата однако это требует дальнейших подтверждений.

Кроме того, добавление L-аргинина к ибупрофену способствует наступлению быстрого и сильного анальгетического эффекта. L-аргинин ускоряет всасывание ибупрофена, ускоряет время достижения его максимальной концентрации в плазме крови и увеличивает биодоступность. Следствием чего является быстрое наступление более выраженного обезболивающего эффекта.

Дополнительное доказательство увеличения биодоступности ибупрофена аргината по сравнению с ибупрофеном демонстрирует экспериментальное исследование, в ходе которого проведен анализ эффектов этих двух препаратов на вызванную каррагинином эдему у крыс. В неопубликованном отчете по противовоспалительному действию ибупрофена и ибупрофена аргината последний оказался столь же эффективен, сколь и только ибупрофен, но эффект от приема ибупрофена аргината достигался в гораздо более короткие сроки. Не мало важным является и тот факт, что такое малое время контакта ибупрофена со слизистой желудка способствует снижению побочных эффектов.

Предполагают, что более высокая биодоступность ибупрофена аргината и быстрое наступление максимальной концентрации в плазме крови может быть связано, с тем, что L-аргинин способствует быстрому растворению препарата в кишечнике. Кроме того, можно предположить, что ибупрофена аргинат, в отличие от ибупрофена, всасывается в кишечнике не только путем простой диффузии, но и с участием транспортера олигопептидов PEPT1 - именно за счет L-аргинина. Так, аналогичным образом, для валацикловира характерна более высокая биодоступность по сравнению с ацикловира именно за счет "добавления" аминокислоты валина в его молекулу, что способствует активному транспорту валацикловира с помощью PEPT1 в энтероциты.

С учетом того, что субстратами PEPT1 являются аргинин-содержащие олигопептиды, ибупрофена аргинат также может быть субстратом данного транспортера. Однако эта гипотеза относительно ибупрофена аргината требует экспериментального подтверждения.

В заключение можно сказать, что добавление L-аргинина увеличивает растворимость ибупрофена, не нарушая его химическую стабильность и эффективность; с другой стороны, помимо ускоренного начала действия ибупрофена, L-аргинин играет важную роль в профилактике развития НПВП-гастротоксичности, и, возможно, негативного воздействия на сердечно-сосудистую систему.

Таким образом, ибупрофена аргинат – эффективный быстродействующий и более безопасный (по сравнению с другими НПВП) препарат для лечения острой боли, воспалений различного генеза и локализации и лихорадочных состояний. Также данный препарат эффективен в тех случаях, где ранее высокое содержание ибупрофена достигалось за счет его парентерального введения: при мигрени, цефалгиях, коликах, резах, послеоперационных и неопластических болях.

ПОБЕДА над болью В ДВА счета!



Фаспик

Ибупрофен /эффективный
анальгетик/
+
L-аргинин /природная базовая
аминокислота/

Zambon

Представительство АО «Замбон С.П.А.» (Италия) в России:
119002, Москва, Глазовский пер., д. 7, оф. 17
Тел.: +7 (495) 933 38 32
www.zambon.ru

Реклама