

КЕТОРОЛ ГЕЛЬ

кеторолаку трометамін 2 %

ПОТУЖНІСТЬ КЕТОРОЛАКУ, ПІДСИЛЕНА ПРОВІДНИКОМ¹



Гель 2 %. відпускається без рецепту. Перед застосуванням проконсультуйтеся з лікарем та ознайомтеся з інструкцією для медичного застосування. За додатковою інформацією звертайтеся за адресою: ТОВ "Др. Редді'с Лабораторіз", 03131, м. Київ, Столичне шосе, 103, БЦ "Європа", 11-й поверх, офіс 11 а. тел: (044) 492-31-74. www.drreddys.com. UA/2566/03/01. Затверджено наказом МОЗУ № 1116 від 20.09.2017 р. Реклама лікарського засобу, яка розміщується у спеціалізованих виданнях, призначених для медичних установ та лікарів або матеріалах, які розповсюджуються на спеціалізованих заходах на медичну тематику. Перед призначенням ознайомтеся з повним текстом інструкції до медичного застосування.

¹. Інструкція з медичного застосування препарату Кеторол Гель.
1KETG-29.09.17-RX1

Г.В. Зайченко, д.м.н., професор, кафедра фармакології Національного медичного університету ім. О.О. Богомольця, м. Київ; О.Я. Міщенко, д.фарм.н., професор, А.В. Березняков, д.фарм.н., Інститут підвищення кваліфікації спеціалістів фармації Національного фармацевтичного університету, м. Харків

Топічні нестероїдні протизапальні засоби: фармацевтичний та клініко-фармакологічний аспекти

Використання місцевих нестероїдних протизапальних засобів (НПЗЗ) для полегшення болю тривалий час залишалося дискусійним питанням у знеболювальній терапії. У деяких країнах Західної Європи ці препарати були доступними без рецепта протягом багатьох років, широко рекламувалися, а докази на користь їх використання вважалися адекватними. В інших регіонах світу НПЗЗ розглядалися як дещо ефективніші за плацебо, а їх лікувальна дія пояснювалася процесом втирання в ділянках ураження. У США застосування НПЗЗ у лікувальній практиці було обмежено до середини 2000-х років і дозволено FDA у 2007 р. В Англії 2013 року було виписано 5,2 млн рецептів з місцевими НПЗЗ [15]; переважно це препарати ібупрофену (2,45 млн), піроксикаму (1,18 млн) і диклофенаку (1,27 млн), що свідчить про їх широке використання.

Мета дослідження — проаналізувати дані літератури щодо доказів ефективності і безпечності різних лікарських форм НПЗЗ місцевої дії для лікування м'язово-суглобового болю (МСБ) та міжнародні клінічні рекомендації; асортимент НПЗЗ місцевої дії на фармацевтичному ринку України, обсяги їх продажів за 2015-2016 роки, визначити препарати-лідери та порівняти їх клініко-фармакологічні властивості.

Матеріали та методи

Було проведено цільовий пошук джерел інформації високої методологічної якості — систематичних оглядів, метааналізів щодо ефективності та безпечності НПЗЗ для місцевого застосування в терапії МСБ у базі даних Кокранівської бібліотеки (Cochrane Library), а також клінічних рекомендацій стосовно лікування МСБ у мережі Internet.

Результати та їх обговорення

За результатами пошуку було знайдено систематичний огляд, в якому проаналізовано дані 61 клінічного випробування. У цих дослідженнях брали участь 5311 дорослих пацієнтів (≥16 років) зі спортивними травмами, що супроводжувалися розтягнуттям м'язів, зв'язок і больовим синдромом. 1621 учасник отримував НПЗЗ місцевої дії, 3470 осіб — плацебо, 220 пацієнтів — пероральні НПЗЗ. Лікарський засіб (ЛЗ) наносили мінімум один раз у день. Результати терапії реєстрували тільки за відгуками пацієнтів клінічних досліджень. Критерієм ефективності була кількість хворих, які спостерігали зниження больового синдрому на ≥50%. Проведені дослідження продемонстрували максимальну ефективність диклофенаку, ібупрофену та кетопрофену у вигляді гелю [13]. Порівняння ефективності НПЗЗ місцевої дії — диклофенаку, ібупрофену і кетопрофену — за розрахованим показником НЧП (число хворих, яких потрібно пролікувати, щоб досягти ефективності) свідчить, що найбільш ефективним є гель диклофенаку (НЧП=1,8), менш дієвим — гель кетопрофену (НЧП=2,5), найменш результативним — ібупрофен у формі гелю (НЧП=3,9).

Сьогодні існують достовірні докази ефективності місцевих НПЗЗ у лікуванні гострого і хронічного скелетно-м'язового болю [7, 14, 15]. Аналіз наявності НПЗЗ місцевої дії в міжнародних клінічних рекомендаціях показав, що топічні НПЗЗ рекомендовані Американською асоціацією ортопедичної хірургії (AAOS), Міжнародною спілкою дослідження остеоартриту (OARSI) та іншими медичними асоціаціями. У Великій Британії Національний інститут клінічної майстерності (NICE) у своїй настанові з лікування остеоартриту у 2008 р. рекомендував місцеві НПЗЗ як препарати першої лінії терапії [6].

Керівні принципи лікування МСБ були розроблені лікарями на основі клінічних досліджень і дещо відрізняються. Наприклад, рекомендації AAOS і Американського геріатричного товариства (AGS) відображають точку зору фахівців в області ортопедичної хірургії та геріатрії, при цьому директиви EULAR і OARSI підкреслюють висновки експертів у галузі ревматології.

Група експертів з Американської колегії ревматологів (ACR) оновила клінічні рекомендації з лікування ревматоїдних захворювань і на сьогодні регламентує застосування топічних НПЗЗ замість пероральних препаратів, особливо в пацієнтів віком старше 75 років. Відомо, що небезпека побічних явищ у разі перорального прийому НПЗЗ збільшується зі зростанням віку пацієнта, при використанні високих доз, тривалому періоді лікування, наявності супутніх захворювань, а також спільному застосуванні деяких ЛЗ [11, 12]. Селективні інгібітори циклооксигенази-2 (ЦОГ-2) спочатку були безпечною альтернативою для пацієнтів з високим ризиком розвитку виразкової хвороби або шлунково-кишкової кровотечі. Однак на основі клінічних спостережень їх безпека виявилася сумнівною, оскільки ця група препаратів має виражений негативний вплив на серцево-судинну систему і нирки.

Слід звернути увагу, що НПЗЗ внесено до вітчизняного уніфікованого клінічного протоколу лікування ревматоїдного артриту без уточнення особливостей шляхів введення в організм хворого [5].

Таким чином, за результатами проведеного огляду встановлено, що НПЗЗ місцевої дії представлені в низці клінічних рекомендацій щодо лікування МСБ.

Сучасні лікарські форми НПЗЗ для місцевого застосування — креми, гелі, мазі — мають свої переваги і недоліки.

Встановлено, що більшість топічних НПЗЗ — це гелі, що пояснюється перевагами цієї лікарської форми: глибокою проникністю діючих речовин у тканини в місці нанесення та пролонгованістю дії. Диклофенак дієтиламином представлений у вигляді емульгелю. Це двокомпонентна форма, яка поєднує в собі ліпофільну (емульсія) і гідрофільну (гель) основи. Така комбінація сприяє швидкому всмоктуванню, хорошему проникненню в м'язи та навколосуглобові тканини, створенню високих концентрацій препарату. Інші лікарські форми для місцевого застосування поступаються гелям за кількістю найменувань. У вигляді крему випускаються кетопрофен, ібупрофен та ацеклофенак, у вигляді мазей — індометацин та фенілбутазон.

На українському фармацевтичному ринку НПЗЗ для місцевого застосування представлені 33 торговими найменуваннями (ТН) на основі 10 міжнародних найменувань (МНН). Серед них вітчизняні ЛЗ становлять 30%, закордонні — 70%. Найбільш чисельною є група ЛЗ, які містять диклофенак, — 13 ТН.

Загальний обсяг реалізації топічних НПЗЗ за 2016 рік становить 4,526 млн упаковок, що на 367 тис. більше, ніж у 2015 р. Це свідчить про те, що проблема терапії патологій опорно-рухового апарату і МСБ, як і раніше, актуальна. Згідно зі статистичними даними, суглобовий біль реєструється в середньому в 30% населення, серед осіб віком старше 40 років — у 50%, у категорії старше 70 років — у 90% випадків [9].

Аналіз структури споживання показав (рис.), що лідерами за обсягами реалізації на фармацевтичному ринку є ЛЗ на основі шести МНН (показники виражені в мільйонах упаковок):

1. Диклофенак — 2,303 (51% від загальної кількості реалізованих упаковок).
2. Німесулід — 0,884 (19,5%).
3. Кетопрофен — 0,687 (15%).
4. Ібупрофен — 0,272 (6%).
5. Індометацин — 0,205 (4,5%).
6. Кеторолак — 0,135 (3%).

Отже, на фармацевтичному ринку України представлено широкий асортимент топічних НПЗЗ, що дозволяє задовольняти потреби українських споживачів. Лідерами за обсягом реалізації є топічні НПЗЗ на основі диклофенаку, німесуліду, кетопрофену, ібупрофену, індометацину та кеторолаку.



Рис. Розподіл груп НПЗЗ місцевої дії залежно від обсягу продажів (%)

На наступному етапі були проаналізовані клініко-фармакологічні характеристики цих топічних НПЗЗ. Кожен із них має різну вираженість аналгетичної та протизапальної дії. Серед найбільш популярних топічних НПЗЗ аналгетична активність найбільш виражена в кеторолаку, кетопрофену та диклофенаку, а протизапальна — в індометацину, диклофенаку та німесуліді. Побічні ефекти в них часто схожі і здебільшого реалізуються у вигляді симптомів місцевого характеру. Лікарі повинні враховувати можливість розвитку системних побічних явищ при призначенні пацієнтам того або іншого засобу.

Серед препаратів-лідерів звертає на себе увагу Кеторолак 2% виробництва компанії Dr. Reddy's, діючою речовиною якого є кеторолак. Динаміка зростання продажів цього засобу на 11% у 2016 р. у порівнянні з 2015 р. свідчить не тільки про довіру до препарату з боку споживачів, але й про численні переваги.

Ефективність засобу посилюється диметилсульфоксидом (димексидом), який входить до складу препарату як допоміжна речовина і має помірну антисептичну, фібринолітичну, місцеву аналгетичну і протизапальну дію. Завдяки властивості проникати через шкіру диметилсульфоксид виконує функцію пенетранта (провідника) для діючої речовини до вогнища болю і запалення [3]. Таким чином, аналгетичний та протизапальний ефекти кеторолаку значно посилюються. За силою знеболювальної активності кеторолак перевершує більшу частину НПЗЗ, таких як диклофенак, ібупрофен, кетопрофен, він має також помірну протизапальну та жарознижувальну дію. У низці досліджень було продемонстровано, що цей препарат (ін'єкційна форма) за ефективністю не поступається морфіну та має більш високий профіль безпеки. При місцевому застосуванні викликає швидке зменшення інтенсивності / усунення болю в місці нанесення гелю, у тому числі болю в суглобах у спокої і під час руху, зменшує ранкову скутість і припухлість суглобів, сприяє збільшенню обсягу рухів.

Кеторолак 2% є безрецептурним ЛЗ і може бути рекомендований провізором/фармацевтом в аптеці як препарат для симптоматичної терапії, коли потрібне швидке і потужне знеболювання: при травмах, болях у м'язах та суглобах (забиття та запалення м'язів і тканин, у тому числі посттравматичного походження, ушкодження зв'язок). Також Кеторолак 2% забезпечує хороший результат у ситуаціях, пов'язаних з ревматичними захворюваннями: при бурситі, тендиніті, епіконділіті, синовіті. Препарату притаманна виражена і швидка аналгетична дія; на відміну від топічних НПЗЗ диклофенаку, німесуліду і кетопрофену кеторолак не має фотосенсибілізуючих властивостей. За рахунок топічного нанесення препарату у формі гелю діюча речовина потрапляє в зону ураження одразу, минаючи системний кровоток та інші органи і тканини. Це дозволяє застосовувати Кеторолак 2% у пацієнтів, яким протипоказане призначення системних НПЗЗ. Крім того, Кеторолак 2% може бути використаний як доповнення до системної протизапальної терапії, підсилюючи її ефективність, знижуючи необхідну дозу системного НПЗЗ і ризик виникнення побічних ефектів.

Кеторолак 2% (Dr. Reddy's Laboratories Ltd) є ефективним і безпечним знеболювальним засобом.

Висновки

Більшість топічних НПЗЗ представлені у вигляді гелю, що пояснюється низкою переваг цієї лікарської форми: кращою проникністю діючих речовин у тканини в місці нанесення та тривалою (пролонгованою) дією.

На українському фармацевтичному ринку НПЗЗ для місцевого застосування представлені 33 ТН на основі 10 МНН. Серед них ЛЗ вітчизняного та іноземного виробництва становлять 30 та 70% відповідно.

Довіру клініцистів та популярність серед пацієнтів здобув НПЗЗ для місцевого застосування Кеторолак 2% (Dr. Reddy's Laboratories Ltd), діючою речовиною якого є кеторолак — потужний ненаркотичний аналгетик.

Кеторолак 2% є ефективним і безпечним знеболювальним засобом при травмах, болях у м'язах та суглобах, ревматичних захворюваннях.

Препарату притаманні виражені і швидка аналгетична дія та відсутність фотосенсибілізуючих властивостей, що дозволяє рекомендувати його як засіб для симптоматичної терапії, коли потрібне швидке і потужне знеболювання.

Топічна форма препарату дозволяє доставити активну речовину безпосередньо до вогнища ураження, минаючи системний кровоток та інші органи і тканини.

Список літератури знаходиться в редакції.