В Украине зарегистрирован новый уникальный анальгетик

В Украине официально зарегистрирован препарат Катадолон – принципиально новый для нашей страны ненаркотический анальгетик центрального действия, обладающий миорелаксирующим действием и предотвращающим хронизацию боли. Катадолон обладает уникальным механизмом действия и является первым представителем класса обезболивающих препаратов – селективных активаторов калиевых каналов нейронов (SNEPCO). В украинских аптеках препарат появится в последней декаде сентября.

В последние десятилетия в медицинской и фармакологической отрасли проводится все больше исследований, посвященных проблеме боли. Боль различной локализации относится к наиболее частым жалобам больных, с которыми сталкиваются врачи разных специальностей в своей повседневной практике. Поиск новых путей купирования боли является одной из важных задач медицинской науки и практики. В данном контексте появление в Украине анальгетика, обладающего новым механизмом воздействия, представляет большой интерес для врачей и расширяет возможности лечения.

Катадолон (флупиртина малеат) относится к неопиоидным анальгетикам центрального действия, не вызывает зависимости и привыкания. Осмысление механизма действия Катадолона – это, по сути, открытие нового принципа лечения боли. В основе действия флупиртина лежит активация потенциалнезависимых калиевых каналов, приводящая к стабилизации мембранного потенциала нейрона на уровне задних рогов спинного мозга, что блокирует проведение болевого импульса в ЦНС, предотвращает стимуляцию мотонейронов с развитием мышечного спазма. Препарат обладает выраженным анальгетическим действием, способностью нормализовать повышенный мышечный тонус, а также проявляет нейропротекторные свойства.

Обезболивающее действие флупиртина реализуется как за счет непрямого антагонизма по отношению к NMDA-рецепторам, так и посредством модуляции механизмов боли, связанных с влиянием на ГАМК-эргические системы. Благодаря селективному открытию калиевых каналов потенциал покоя нервной клетки стабилизируется, нейрон становится менее возбудимым, снижается активность NMDA-рецепторов, происходит блокада нейрональных ионных кальциевых каналов и снижение внутриклеточного тока ионов. Обезболивающий эффект реализуется вследствие подавления возбуждения нейрона в ответ на ноцицептивные стимулы.

Катадолон препятствует процессам хронизации боли, формированию болевой чувствительности и нарастанию ответа нейронов на повторные болевые стимулы. Такое действие предотвращает усиление боли и переход ее в хроническую форму, а при уже имеющемся хроническом болевом синдроме ведет к снижению его интенсивности. Кроме того, установлено модулирующее влияние флупиртина на восприятие боли через нисходящую норадренергическую систему.

Антиспастическое действие Катадолона на мышцы связано с блокированием передачи возбуждения на мотонейроны и промежуточные нейроны. Это влияние препарата проявляется при многих хронических заболеваниях, сопровождающихся болезненными мышечными спазмами (скелетно-мышечные боли в шее и спине, артропатии, тензионные головные боли, фибромиалгия). Немаловажно, что, нормализуя мышечный тонус, препарат не влияет на мышечную силу.

Нейропротекторные свойства препарата обусловлены защитой нервных структур от токсического воздействия высоких внутриклеточных концентраций ионов кальция. Данное свойство связано со способностью флупиртина вызывать блокаду нейрональных ионных кальциевых каналов и снижать внутриклеточный ток ионов кальция.

Высокая безопасность Катадолона связана с особенностями его воздействия и подтверждена в целом

ряде исследований. В отличие от традиционно применяемых обезболивающих средств (нестероидных противовоспалительных препаратов (НПВП), опиоидных анальгетиков) флупиртин не ингибирует циклооксигеназу, не оказывает опиоидного действия и не имеет соответствующих побочных эффектов. Результаты многолетнего использования препарата в средней дозе 300 мг/сут показали его хорошую переносимость, отсутствие привыкания и лекарственной зависимости. Побочные эффекты наблюдались у небольшого количества пациентов и проходили самостоятельно без необходимости отмены препарата или коррекции его дозы.

Побочные действия флупиртина, в том числе редко встречающиеся и единичные, были изучены в ходе контролируемого клинического исследования с участием 2775 человек, где 778 больных получали препарат более 4 нед, а 191 пациент – более 1 года. Кроме того, сведения о побочных эффектах получены при лечении более 1,5 млн больных в повседневной практике. Наиболее часто встречающимся побочным действием (с частотой свыше 10% случаев) было ощущение слабости, которое в большинстве случаев носило преходящий характер.

Научные исследования

Проведенные клинические исследования флупиртина продемонстрировали его высокую эффективность при лечении острой, подострой и хронической боли на моделях миофасциальной боли, мышечно-скелетной боли в шее и спине, а также головной боли напряжения (W.M. Hergmann et al., 1987; H. Riethmuller-Winzen, 1987). При использовании препарата в терапии острой и хронической боли, связанной с мышечным напряжением, показано существенное снижение интенсивности постоянной боли, боли при надавливании и мышечном напряжении (G. Muller-Schwefe, 2003). Отмечено выраженное улучшение качества жизни пациентов за счет снижения частоты нарушений сна, обусловленных болью, и уменьшения ограничений в повседневной жизни. Эффективность и переносимость терапии флупиртином врачами и пациентами оценивались как «хорошая» и «отличная» соответственно (частота побочных эффектов в этом исследовании составила <1%).

Оптимистичны результаты применения флупиртина у лиц с болью в нижней части спины (M. Van Tulder et al., 2006). Показано, что анальгетическая эффективность флупиртина в средних терапевтических дозах при хронической боли в нижней части спины сравнима с таковой для диклофенака натрия, являющегося стандартом в лечении боли данной локализации. Однако спектр побочных эффектов при применении сравнимых препаратов существенно различается: при использовании диклофенака наиболее часто встречаются осложнения со стороны верхних отделов желудочно-кишечного тракта, в то время как при применении флупиртина их частота не превышает 20% всех побочных явлений. Исследователи отмечают, что эффективность использования Катадолона выше при назначении препарата с первых дней развития болевого синдрома; время наступления анальгетического эффекта и его длительность в группах флупиртина и диклофенака натрия были практически одинаковыми.

Большой интерес представляют результаты исследования возможностей применения Катадолона с целью обезболивания в онкологической практике, где проблема рационального обезболивания является

одной из ключевых. Поздние стадии инкурабельного рака с метастазами, как правило, сопровождаются сильным болевым синдромом, который рассматривается в качестве независимого расстройства, требующего обязательного лечения.

В многоцентровом двойном слепом исследовании флупиртин сравнивали с трамадолом в лечении боли при раке (V. Luben et al., 1994). В рамках исследования пациенты получали 400-600 мг флупиртина (n=35) или 50 мг трамадола (n=36) ежедневно в течение 4 нед. Тяжесть боли оценивали 1 раз в неделю. В результате лечения интенсивность боли, исходно не отличающаяся в обеих группах, в группе флупиртина уменьшалась в большей степени, чем в группе трамадола. При оценке врачом общего состояния больных по окончании лечения результаты были «хорошими» и «очень хорошими» у 63% участников в группе флупиртина и у 46% пациентов в группе трамадола. Побочные эффекты наблюдались у 6% больных, получавших флупиртин, и у 19% пациентов, принимавших трамадол. Преимуществом флупиртина являлось отсутствие опиатзависимых побочных эффектов. Дополнительная эффективность флупиртина в отношении мышечной релаксации может быть особенно ценной у больных с миофасциальными нарушениями, где нежелательно назначение опиатных анальгетиков из-за их спазмогенного эффекта.

Потенциальная область применения

Максимального эффекта от Катадолона следует ожидать при болевых синдромах, патогенез которых в наибольшей мере соответствует свойствам препарата. Прежде всего это острые и хронические заболевания, при которых боли вызываются мышечным спазмом:

- боли при патологии опорно-двигательного аппарата, в частности шеи и спины;
- мышечные спазмы при заболеваниях суставов;
- головная боль напряжения;
- боль при злокачественных новообразованиях;
- посттравматическая боль;
- боль после травматологических/ортопедических операций и вмешательств;
- альгодисменорея.

Особенности действия Катадолона позволяют считать его препаратом выбора для лечения боли в спине, вызванной повышенным тонусом скелетной мускулатуры. Кроме того, большие перспективы открываются для использования препарата при любых болевых синдромах у лиц, имеющих противопоказания к применению НПВП. Так, флупиртин можно назначать на фоне язвенной болезни желудка, артериальной гипертензии и бронхиальной астмы.

Препарат применяется по назначению врача. Доступные лекарственные формы: Катадолон капсулы 100 мг и Катадолон ретард таблетки 400 мг. Дозы подбирают в зависимости от интенсивности боли и индивидуальной чувствительности больного к препарату. Начальная доза составляет 200 мг (2 капсулы) на ночь; средняя поддерживающая – по 1 капсуле 3-4 р/сут (в равные временные интервалы) или по 1 таблетке ретард 400 мг в сутки. Катадолон можно сочетать с НПВП, опиоидами, антидепрессантами. Следует избегать одновременного назначения флупиртина с лекарственными средствами, содержащими парацетамол и карбамазепин. Катадолон усиливает действие алкоголя, седативных средств и миорелаксантов.

Катадолон не относится к группе наркотических или психотропных средств.

Таким образом, в распоряжении украинских врачей появился новый перспективный препарат с уникальным механизмом действия, эффективность и безопасность которого доказаны в ходе многолетних исследований.

Подготовила **Катерина Котенко**

Р