

Диклофенак в лечении болевых синдромов

Боль – одна из самых распространенных жалоб пациентов, именно она заставляет пациента обратиться за медицинской помощью. Значимую медико-социальную проблему составляет боль, сопровождающая патологию опорно-двигательного аппарата.

Терапия пациента с заболеванием опорно-двигательного аппарата должна носить комплексный характер, при этом анальгетики представляют средства первого выбора. Устранение боли как симптома само по себе не замедляет прогрессирования основного заболевания, вместе с тем правильно подобранная патогенетическая терапия без обезболивания дает длительный, но отсроченный во времени эффект. Следует помнить, что для пациента качество обезболивания – залог приверженности к дальнейшему лечению.

Одними из наиболее часто назначаемых обезболивающих средств являются нестероидные противовоспалительные препараты (НПВП). В основе механизма действия данной группы препаратов лежит подавление активности фермента циклооксигеназы (ЦОГ), который осуществляет биотрансформацию арахидоновой кислоты в простагландины (ПГ), простаглицин и тромбосан. Наряду с медиаторной ролью ПГ могут быть модуляторами воспаления, угнетая агрегацию тромбоцитов и таким образом способствуя высвобождению из них через систему циклических нуклеотидов гистамина и серотонина. В процессе исследования ЦОГ установлено, что в различных тканях действие фермента неоднородно и существуют изоформы данного фермента. Это открытие привело к формулированию гипотезы о том, что ЦОГ-1 – фермент, выполняющий в организме важные физиологические функции, а ЦОГ-2 (экспрессируемый макрофагами,

синовиоцитами, фибробластами, гладкой сосудистой мускулатурой, хондроцитами и эндотелиальными клетками после индукции их цитокинами или факторами роста) ответственен за течение воспалительных процессов. Согласно данной концепции, ингибирование ЦОГ-2 рассматривается как один из ведущих механизмов противовоспалительной активности НПВП, а ингибирование ЦОГ-1 – развития побочных эффектов (поражения желудочно-кишечного тракта, нарушения агрегации тромбоцитов, функции почек, негативного влияния на систему кровообращения). Вслед за открытием изоформ ЦОГ последовала разработка НПВП, влияющих преимущественно на ЦОГ-2, т. е. обладающих селективностью (мелоксикам, рофекоксиб, цефекоксиб, этодолак). Предполагалось, что новые селективные средства, не влияющие на ЦОГ-1 и потенциально более безопасные, вытеснят традиционные НПВП (диклофенак, индометацин, фенилбутазон, ибупрофен, напроксен). Казалось бы, проблема безопасного и эффективного обезболивания решена, однако на практике картина получилась несколько иной.

Торможение ЦОГ-2 при боли, связанной с воспалением, является доказанным анальгетическим механизмом НПВП, но, по-видимому, не единственным. В частности, его оказывается недостаточно, чтобы объяснить действие НПВП на некоторых моделях острой боли. Расхождение между противовоспалительными и анальгетическими эффектами НПВП предполагает наличие

других механизмов анальгезии. В подтверждение этого тезиса получены сообщения о подавлении неселективными НПВП афферентных болевых сигналов, центральном антиноцицептивном действии. Недавно получены доказательства другого альтернативного анальгетического механизма действия неселективных НПВП. Периферический антиноцицептивный эффект данной группы может быть результатом активации некоторых типов K^+ -каналов мембраны нейрона, что может вызывать гиперполяризацию периферических терминалей первичных афферентов. Установлен тот факт, что анионные свойства НПВП позволяют им проникать в бислою фосфолипидных мембран иммунокомпетентных клеток и непосредственно влиять на взаимодействие белков, предотвращая клеточную активацию на ранних стадиях воспаления.

Таким образом, применение как селективных, так и неселективных НПВП остается оправданным при соблюдении принципов рационального назначения. Стоит подчеркнуть, что разные нозологии требуют различных подходов к купированию боли. Выбор препарата, его дозы и способ введения должны определяться строго индивидуально, с учетом интенсивности алгии, клинико-лабораторных показателей и сопутствующей патологии (суммарного риска возможных осложнений при назначении того или иного НПВП). Интервал между введениями определяют по степени тяжести боли, фармакокинетическим особенностям действия препаратов и их лекарственной формы. С учетом этих принципов становится понятно, что препарат выбора должен соответствовать ряду требований:

- обеспечивать высокую эффективность и характеризоваться оптимальным соотношением противовоспалительного и анальгетического действия;
- быть сравнительно безопасным для пациента;
- обеспечивать быстрое наступление эффекта и быстрое выведение из организма;
- иметь доступные и удобные для пациента формы введения (инъекционные, пероральные, местные).

Диклофенак признан одним из наиболее эффективных НПВП, золотым стандартом, соответствующим вышеуказанным требованиям. Препарат широко используется в хирургии, травматологии и спортивной медицине (при поражении опорно-двигательного аппарата, повреждении мягких тканей, в постоперационном обезболивании), неврологии (для лечения боли в спине, туннельных синдромов, мигрени), гинекологии, онкологии; лекарственная форма диклофенака в виде капель применяется в офтальмологии.

Помимо ингибирования простагландинов, диклофенак, как было показано в экспериментальном исследовании, способен сдерживать миграцию лейкоцитов в очаг воспаления. Отмечено влияние этого НПВП на баланс цитокинов в пользу интерлейкина-10, что способствует замедлению секреции противовоспалительных факторов. Уменьшение выработки свободных радикалов под влиянием диклофенака натрия может рассматриваться как фактор, снижающий активность воспалительного процесса и ограничивающий его повреждающее действие на ткани. Диклофенак обладает также мощным анальгетическим потенциалом, который проявляется в центральном и периферическом антиноцицептивном воздействии. Центральная анальгетическая активность диклофенака натрия опосредована, по-видимому, опиоидными рецепторами, о чем свидетельствует то, что этот эффект блокируется налоксоном. Значительный интерес для клинициста представляет локальное антиноцицептивное действие диклофенака. Локальный эффект связан не только с подавлением простагландинов, поскольку на экспериментальных моделях местное применение индометацина и цефекоксиба не позволяло достичь

значимого анальгетического действия. Периферический антиноцицептивный эффект диклофенака связывают с активацией нескольких типов калиевых каналов, происходящей с участием NO и циклического гуанозинмонофосфата. Таким образом, диклофенак способен воздействовать на различные звенья патогенеза болевого синдрома. Его высокая противовоспалительная и анальгетическая эффективность по сравнению с таковой других НПВП позволяет использовать данный препарат у больных с различными по интенсивности алгическими синдромами, а быстрота наступления обезболивающего действия (при внутримышечном введении эффект наступает через 10-20 мин) служит основанием для назначения диклофенака для купирования острой боли.

Неоспоримым преимуществом препарата является многообразие лекарственных форм, что позволяет индивидуально подбирать дозы и способы применения у разных пациентов. Сегодня в Украине доступны препараты диклофенака Олфен™ – серия, которая включает 6 лекарственных форм:

- Олфен™-100 Ректокапс (ректокапсулы, 100 мг, № 5);
- Олфен™-100 СР Дипокапс (капсулы пролонгированного действия, 100 мг, № 20);
- Олфен™-50 Лактаб (таблетки, покрытые оболочкой, 50 мг, № 20);
- Олфен™-75 (раствор для инъекций);
- Олфен™ Гель (гель, 10 мг/г, туба 20 г и 50 г);
- Олфен™ Трансдермальный пластырь (140 мг в упаковке № 2, № 5, № 10).

Формы препарата для местного использования (гель, пластырь) в ряде случаев могут заменить средства общей терапии или сократить их использование, что особенно важно при наличии противопоказаний к лекарственным препаратам общего действия или их плохой переносимости.

Накоплен положительный опыт в использовании локальных форм диклофенака как за пределами Украины (H.G. Predel et al., 2004; M.H. Gschwend et al., 2005), так и в отечественных клиниках. На базе отдела клинической физиологии и патологии опорно-двигательного аппарата Института геронтологии НАМН Украины наблюдали эффективность и безопасность применения трансдермального пластыря Олфен™ в лечении боли в нижней части спины у пациентов старших возрастных групп. Применение препарата привело к уменьшению выраженности болевого синдрома, улучшению функции позвоночника и повышению уровня физической активности. Его эффективность была сопоставима с таковой у пероральной формы диклофенака натрия при значительно более высоком профиле безопасности. На базе ННЦ «Институт кардиологии им. Н.Д. Стражеско» НАМН Украины успешно проведено исследование эффективности трансдермального пластыря Олфен™ в 2 группах пациентов с остеоартрозом и плечелопаточным периартритом на фоне остеохондроза. В обеих группах местная терапия сопровождалась высокой эффективностью и безопасностью: ни одного случая возникновения системных или местных нежелательных реакций зарегистрировано не было.

Таким образом, назначение НПВП для лечения болевых синдромов должно проводиться при соблюдении принципов рациональной терапии. Подбор препарата осуществляют индивидуально, учитывая суммарный риск возможных осложнений. Минимизировать вероятность побочных реакций позволяют местные лекарственные формы препаратов. Формы препарата Олфен™ для местного использования – трансдермальный пластырь и гель – доказали свою эффективность в клинической практике, позволяют снизить риск возникновения побочных реакций и удобны в использовании.

Подготовила Мария Маковецкая



Современные возможности лечения боли





ОЛФЕН™
диклофенак

Лекарственные формы препарата ОЛФЕН™

Информация о лекарственном средстве ОЛФЕН™. Олфен™-75. Состав: действующее вещество: 2 мл раствора (1 ампула) содержит: диклофенак натрия 75 мг и лидокаина гидрохлорида 20 мг. **Лекарственная форма:** Раствор для инъекций. **Показания:** Препарат назначают в виде внутримышечных инъекций при следующих состояниях: обострение воспалительных или дегенеративных форм ревматизма: ревматоидный артрит, анкилозирующий спондилит, остеоартрит, спондилоартрит, вертебральные болевые синдромы, внесуставной ревматизм; почечная и печеночная колики; боль, воспаление и отечность после травмы и хирургических вмешательств. **Олфен™-100 Ректокапс. Состав:** действующее вещество: диклофенак. 1 капсула ректальная содержит диклофенак натрия 100 мг. **Лекарственная форма:** Капсулы ректальные. **Показания:** Воспалительные и дегенеративные формы ревматизма: хронический полиартрит, ювенильный ревматоидный артрит, анкилозирующий спондилит, остеоартрит, в том числе спондилоартроз, болевой цервикальный синдром. Ревматические заболевания внесуставных тканей. Посттравматические и послеоперационные болевые синдромы, которые сопровождаются воспалением и отеком, в частности после стоматологических и ортопедических операций. Боль и/или воспаление при гинекологических заболеваниях: первичная дисменорея, аднексит. Приступы мигрени. Острые приступы подagra. Как вспомогательное лечение при острых воспалительных инфекционных заболеваниях уха, носа и горла, сопровождающихся болевым синдромом, например, при фарингите и тонзиллите, отите. **Олфен™-100 СР Дипокапс. Состав:** действующее вещество: диклофенак. 1 капсула пролонгированного действия содержит диклофенак натрия 100 мг. **Лекарственная форма:** Капсулы пролонгированного действия. **Показания:** Воспалительные и дегенеративные формы ревматизма: хронический полиартрит, ювенильный ревматоидный артрит, анкилозирующий спондилит, остеоартрит, в том числе спондилоартроз, болевой цервикальный синдром. Ревматические заболевания внесуставных тканей. Посттравматические и послеоперационные болевые синдромы, которые сопровождаются воспалением и отеком, в частности после стоматологических и ортопедических операций. Боль и/или воспаление при гинекологических заболеваниях: первичная дисменорея, аднексит. **Олфен™-50 Лактаб. Состав:** действующее вещество: диклофенак. 1 таблетка кишечнорастворимая содержит диклофенак натрия 50 мг. **Лекарственная форма:** Таблетки кишечнорастворимые. **Показания:** Воспалительные и дегенеративные формы ревматизма: хронический полиартрит, ювенильный ревматоидный артрит, анкилозирующий спондилит, остеоартрит, в том числе спондилоартроз, болевой цервикальный синдром. Ревматические заболевания внесуставных тканей. Посттравматические и послеоперационные болевые синдромы, которые сопровождаются воспалением и отеком, в частности после стоматологических и ортопедических операций. Боль и/или воспаление при гинекологических заболеваниях: первичная дисменорея, аднексит. Острые приступы подagra. Как вспомогательное лечение при острых воспалительных инфекционных заболеваниях уха, носа и горла, сопровождающихся болевым синдромом, например, при фарингите и тонзиллите, отите. **Олфен™ Гель. Состав:** действующее вещество: диклофенак. 1 г геля содержит диклофенак натрия 10 мг. **Лекарственная форма:** Гель. **Показания:** Симптоматическое лечение боли, воспаления и отеков: повреждение мягких тканей: травмы сухожилий, связок, мышц и суставов (последствие вывиха, растяжения, синяков, спортивные травмы); локализованные формы ревматизма мягких тканей: тендонит (в т.ч. «теннисный локоть»), бурсит, плечевой синдром и периартропатия; локализованные формы дегенеративного ревматизма (остеоартрит периферических суставов и позвоночника). **Олфен™, трансдермальный пластырь. Состав:** действующее вещество: 1 пластырь содержит диклофенак натрия 140 мг/12 часов на 140 см². **Лекарственная форма:** Пластырь трансдермальный. **Показания:** Местное лечение: воспаление сухожилий, связок, мышц и суставов травматической этиологии, например, при растяжениях связок и сухожилий, вывихах, ушибах; локализованные формы ревматизма мягких тканей и суставов. **Побочные реакции:** головная боль, абдоминальная боль, зуд, сыпь на месте нанесения. **Упаковка и место нахождения производителя:** Мерка ГмбХ, Лодзин-Меркерштрассе 3, 89143 Вальдхайден, Германия. Р. С. МЗ Украины: №№ UA/5122/01/01, UA/5124/01/01, UA/5125/01/01, UA/5123/01/01 от 18.08.11, UA/0646/02/01 от 11.11.11, UA/5930/01/01 от 15.12.11. Полная информация и полный перечень возможных побочных реакций указаны в инструкциях по медицинскому применению препаратов. ООО «ТЕВА УКРАИНА», ул. Физкультурна, 30-в, офис 200, 03680, г. Киев. Тел.: +38 044 594 70 80, факс: +38 044 594 70 81, www.teva.ua. Информация для использования в профессиональной деятельности медицинскими и фармацевтическими работниками. Утверждено в печать: май 2013.