

Диклофенак для ін'єкцій з метою купірування больових синдромів у практиці сімейного лікаря

Одна з найчастіших скарг, з якою регулярно пацієнти звертаються до терапевтів і лікарів загальної практики, – біль. Супроводжуючи значну кількість хвороб, патологічних станів і функціональних розладів організму, біль є головним симптомом, що порушує якість життя хворого та змушує звертатися по медичну допомогу, причому, як доводить практика, багато пацієнтів звертаються в медичні установи вже після невдалих спроб перемогти біль самостійно. В таких випадках лікар першого контакту зосереджується на етапах діагностичного пошуку та виборі адекватної терапії. Саме тому для лікаря важливо мати в арсеналі лікаських засобів такі аналгетики, які поєднували б швидкий початок дії та виражений знеболювальний ефект.

Нестероїдні протизапальні препарати (НПЗП) належать до числа найважливіших симптоматичних лікаських засобів, що застосовуються для лікування больового синдрому. Провідним механізмом дії НПЗП є пригнічення активності циклооксигенази (ЦОГ) – ферменту, який забезпечує біотрансформацію арахідонової кислоти в простагландини, простагліклін і тромбоксан. Описані механізми забезпечують унікальне поєднання протизапальних, анальгетичних і жарознижувальних властивостей цього класу препаратів. Незважаючи на широкий спектр існуючих сьогодні НПЗП, включно з новими селективними інгібіторами ЦОГ-2, найбільш популярним і широко застосовуваним препаратом продовжує залишатися диклофенак, котрий характеризується відмінним співвідношенням ефективності та безпеки.

Відомо, що більшість позитивних ефектів НПЗП (зменшення запалення, болю, лихоманки) пов'язують з інгібуванням ЦОГ-2, а розвиток побічних реакцій (головним чином у вигляді уражень шлунково-кишкового тракту – ШКТ) – з пригніченням синтезу ЦОГ-1 [4]. Утім, застосування високоселективних інгібіторів ЦОГ-2 асоціюється з ризиком тромбозів і серцево-судинних ускладнень. Це пов'язано з пригніченням утворення простаглікліну на фоні прийому селективних інгібіторів, який запобігає агрегації тромбоцитів, а також є вазодилататором [5]. Тож, обираючи між чи

іншим представником НПЗП, доцільно дотримуватися принципу «золотої середини».

Диклофенак належить до препаратів, що приблизно однаковою мірою пригнічують ЦОГ-1 і ЦОГ-2 (рис.). Це пояснює його високу безпеку стосовно розвитку ускладнень з боку ШКТ в порівнянні з традиційними НПЗП. Разом з тим відносна неселективність диклофенаку щодо ЦОГ-2 забезпечує нижчий ризик серцево-судинних ускладнень у порівнянні з високоселективними інгібіторами ЦОГ-2 коксибами [6].

Ще одним важливим питанням безпеки НПЗП є їхня здатність зв'язуватися з рецептором тромбоксану. У низці робіт було показано, що диклофенак більш виражено знижує утворення сироваткового тромбоксану В2 в порівнянні із селективними інгібіторами ЦОГ-2. Van Hecken і співавт. продемонстрували здатність диклофенаку пригнічувати агрегацію тромбоцитів у порівнянні з плацебо, натомість у таких представників селективних НПЗП, як мелоксикам і рофекоксиб, подібного ефекту не спостерігалося. Все це дозволяє припустити перевагу диклофенаку перед іншими НПЗП щодо більш низького ризику тромбоутворення та серцево-судинної безпеки [8].

Відомо, що, крім системних небажаних реакцій, деякі НПЗП (індометацин, напроксен й ібупрофен) можуть чинити несприятливу дію на суглобовий хрящ, котра полягає в пригніченні синтезу простагландинів і

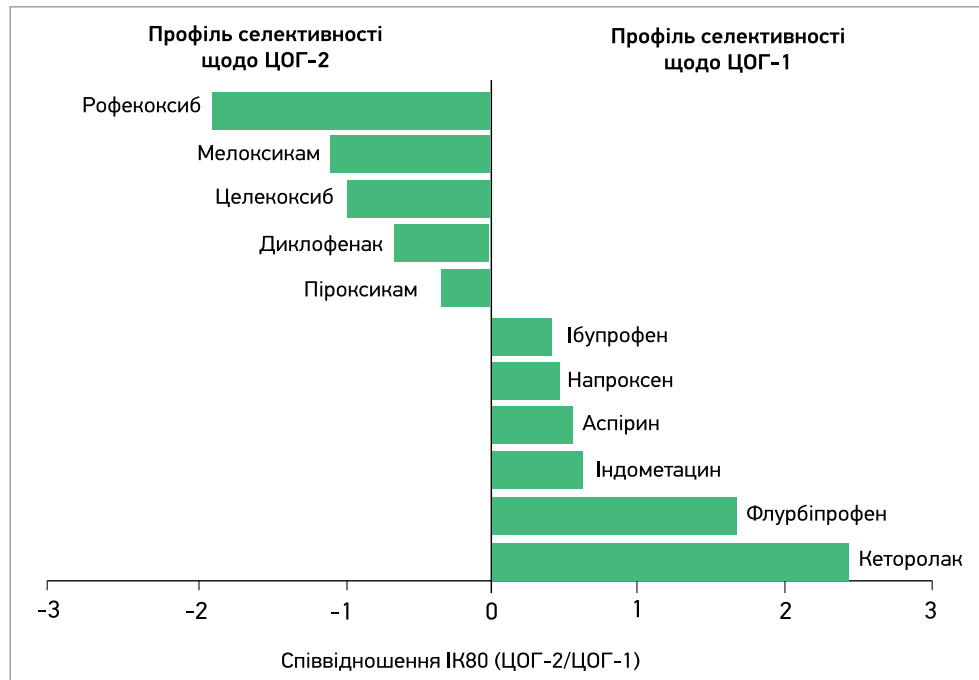


Рис. Профілі селективності різних НПЗП щодо ЦОГ-1 і ЦОГ-2

Примітка: ІК – інгібуюча концентрація.

проліферації хондроцитів. Це істотно обмежує призначення даних НПЗП у пацієнтів із захворюваннями суглобів, зокрема з остеоартрозом. Диклофенак належить до небагатьох НПЗП, котрі характеризуються метаболічно нейтральним впливом на суглобовий хрящ [10].

Сьогодні відомі й інші механізми дії диклофенаку, не пов'язані з інгібуванням простагландинів. Зокрема, було доведено, що препарат певною мірою може впливати на баланс цитокінів і перешкоджати міграції лейкоцитів у вогнище запалення. Окрім вираженої протизапальної активності, диклофенак натрію має потужний анальгетичний потенціал, не пов'язаний з його впливом на запалення зокрема:

- стимуляцією АТФ-чутливих калієвих каналів за допомогою сигнального шляху L-аргінін-оксид азоту (NO) – циклічний гуанозинмонофосфат (цГМФ);
- центральних ефектів: підвищення рівня β-ендорфінів у плазмі крові та пригнічення сигнального шляху N-метил-D-аспартат (NMDA).

Центральна анальгетична активність диклофенаку натрію опосередкована опіоїдними рецепторами через його вплив на обмін триптофану, що підтверджує блокада цього ефекту при застосуванні налксону. Припускають, що місцевий антиноцицептивний ефект диклофенаку пов'язаний не лише з пригніченням синтезу простагландинів, а й з активацією певних типів калієвих каналів.

Такий комплексний механізм робить цей препарат ефективним і одним з найзатребуваніших представників групи нестероїдних протизапальних засобів (НПЗП). Диклофенак натрію вперше був синтезований в 1964 р., після чого його почали широко використовувати в клінічній практиці. З моменту реєстрації препарату понад 1 млрд людей отримали лікування диклофенаком. Сьогодні диклофенак залишається найпопулярнішим препаратом серед НПЗП і посідає 8-е місце в топ-10 найбільш продаваних лікаських препаратів [1, 2].

За допомогою численних клінічних досліджень доведено, що за анальгетичною активністю диклофенак не поступається селективним інгібіторам ЦОГ-2 (еторикоксибу, целекоксибу, рофекоксибу) та неселективним НПЗП (ацеклофенаку, лорноксикаму, етодолаку, німесуліді), а також парацетамолу [11].

В медичній практиці диклофенак найчастіше призначають перорально, місцево (у вигляді гелю) та ректально (у вигляді супозиторіїв); ці способи введення вже довели свою ефективність. Водночас недооціненим залишається його парентеральне введення. Проте воно є доцільним у тих випадках, коли пацієнти не переносять або не можуть приймати пероральні НПЗП, а також тоді, коли потрібно, щоб знеболювальний ефект настав швидко.

Диклофенак входить до переліку життєво необхідних лікаських засобів. Статистика свідчить, що цей препарат протягом багатьох років залишається одним із лідерів за обсягами продажів. Диклофенак для ін'єкцій зарекомендував себе як препарат вибору в лікуванні гострого та хронічного больового синдрому при багатьох захворюваннях і функціональних порушеннях. З огляду на доступну вартість Клодифен виробництва компанії World Medicine можна вважати одним з оптимальних знеболювальних і протизапальних препаратів у практиці лікарів першого контакту (особливо сімейних лікарів).

Список літератури знаходиться в редакції.

Підготував Олександр Соловйов

Клодифен

Потужний знеболюючий, протизапальний та жарознижувачий ефекти

diclofenac

поза часом...



1-2 ампули в/м, в/в не більше 2 діб

Запобігає післяопераційному болю
Лікує гострий та хронічний біль
Зменшує симптоматику при травмах

КЛОДИФЕН. Показання. При внутрішньом'язовому введенні: запальних та дегенеративних форм ревматизму, ревматоїдного артриту, анкілозуючого спонділоартриту, спонділоартриту, вертебрального больового синдрому, несуглобового ревматизму; гострих нападів подагри; ниркової та білярної коліки; болю та набряку після травми і операції; тяжких нападів мігрень. При введенні у вигляді внутрішньовенних інфузій призначений для лікування або профілактики післяопераційного болю. **Протипоказання.** Підвищена чутливість до діючої речовини, натрію метабісульфату або до інших компонентів препарату; наявність кровотечі або перфорації травного тракту в анамнезі, пов'язаної з попереднім лікуванням нестероїдними протизапальними засобами (НПЗП); активна форма виразкової хвороби/кровотечі або рецидивуюча виразкова хвороба/кровотеча в анамнезі; III тримістр вагітності; період годування груддю; дитячий вік (до 18 років). **Побічні реакції.** Головний біль, запаморочення. Вертиго. Нудота, блювання, діарея, диспепсія, абдомінальний біль, метеоризм, анорексія. Збільшення рівня трансаміназ. Висипання, кропив'янка. **Категорія відпуску.** За рецептом. **Заявник.** УОРІД МЕДИЦИН ШАН САН. БЕ ТДЖ. А.Ш., Туреччина. **Виробник.** Мефар Іван Сан. А.Ш., Туреччина. ЗАТВЕРДЖЕНО Наказ МОЗ України №1635 від 07.09.2018 р. РПНЧ/А/16930/01/01. Інформація надана скорочено. З повною інформацією про препарат можна ознайомитися в інструкції для медичного застосування препарату. Інформація для медичних та фармацевтичних працівників, а також для розповсюдження в рамках спеціалізованих заходів з медичної тематики. Інформація про рецептурний лікаський засіб для професійної діяльності спеціалістів у галузі охорони здоров'я.

Питання та інформація щодо фармаконадзору за тел.: +38 097 693 71 18 / farmaconadzor@biaktina.ua

WORLD MEDICINE
Pharmaceutical Company

Тел.: +38 044 495 25 30 / e-mail: info@wm-marketing.com.ua

www.worldmedicine.ua