

МЕСТНОЕ ПРИМЕНЕНИЕ АЦЕКЛОФЕНАКА В РЕВМАТОЛОГИИ

Василевский И.В.

Белорусский государственный медицинский университет,

г. Минск, Республика Беларусь

(Опубликовано: Конгресс с международным участием «Дни ревматологии в Санкт-Петербурге», сборник материалов.- СПб.: Изд-во «Человек и его здоровье», 2017.- С. 48 – 51.).

Цель исследования. Проанализировать литературные данные по современной инновационной технологии использования ацеклофенака в ревматологической практике в виде крема для местного применения.

Материал и методы исследования. Доступные библиографические источники по клинико-фармакологическому обоснованию использования лекарственного средства (ЛС) ацеклофенак как современного нестероидного противовоспалительного препарата с целью купирования болевого синдрома различной этиологии с акцентом на заболевания опорно-двигательного аппарата.

Результаты и обсуждение. Болевой синдром является ведущим клиническим проявлением многих заболеваний, связанных с поражением опорно-двигательного аппарата. Боль сопровождает около 70% всех известных заболеваний. Распространенность хронической боли в популяции колеблется от 2 до 49%. По данным ВОЗ, болевые синдромы составляют одну из ведущих причин (11,3 – 40%) обращений к врачу. Нестероидные противовоспалительные средства (НПВС) относятся к числу наиболее важных ЛС, особенно при лечении ревматических заболеваний и поражений опорно-двигательного аппарата. Это определяется уникальным сочетанием противовоспалительных, анальгетических, жаропонижающих и антитромботических свойств, перекрывающих почти весь спектр основных симптомов наиболее характерных для заболеваний ревматической природы. Как установлено, ключевым элементом механизма фармакологических эффектов НПВС является угнетение синтеза простагландинов (ПГ), обусловленное ингибированием фермента ЦОГ, основного фермента метаболизма арахидоновой кислоты (АК). Одним из побочных эффектов НПВС являя-

ется их возможное неблагоприятное воздействие на суставной хрящ, что особенно актуально при лечении больных с суставным синдромом (ревматоидный артрит, остеоартроз и др.). При различных локализациях остеоартроза (ОА) НПВС выступают в качестве обязательной составляющей программы комплексного лечения пациентов.

Значительным событием при лечении заболеваний опорно-двигательного аппарата и ряда других патологических состояний с синдромом болей является использование ацеклофенака. Ацеклофенак ингибирует экспрессию как ЦОГ-1, так и ЦОГ-2, преимущественный эффект показан в отношении ЦОГ-2, что позволяет препарату приблизиться к селективным ингибиторам ЦОГ-2. Многочисленные экспериментальные и клинические наблюдения показали, что в отличие от ряда широко применяемых в клинической практике НПВС ацеклофенак обладает хондропротективным действием, которое складывается из множества его биологических эффектов на метаболизм гиалинового хряща. На основании практического опыта академик Насонова В.А. с соавт. заключают – «Ацеклофенак вполне может претендовать на место лидера среди традиционных НПВС».

Создание инновационных технологий с целью получения высокоэффективных ЛС нового поколения, обладающих избирательным или пролонгированным действием с минимальными побочными эффектами — это стратегическое направление современной фармацевтики. Среди существующих различных лекарственных форм, применяемых в медицине, издавна используются мягкие лекарственные формы местного применения для профилактики и лечения различных заболеваний, включая поражения опорно-двигательного аппарата.

Мягкие лекарственные средства, включая кремы, являются сложными гетерогенными дисперсными системами и имеют специфические реологические свойства. Качество, эффективность и безопасность этих ЛС зависят от типа и состава основы-носителя, дисперсного состояния лекарственных веществ, эффективности консервантов, условий производства, хранения и т.п. Микронизация – это уменьшение размера частиц, осуществляемое для увеличения сте-

пени растворимости лекарственного вещества и площади всасывания. Микронизированная форма ЛС обеспечивает оптимальную биодоступность последнего, которая зависит от размера его частиц в суспензии, характера масел, входящих в состав в качестве вспомогательных веществ. Микронизация частиц лекарства позволяет увеличить площадь всасывания, степень проникновения препарата в десятки раз, при одновременном уменьшении дозы препарата (при этом, что очень важно с позиций клинической фармакологии, уменьшается риск развития нежелательных эффектов ЛС). Фармакокинетическое моделирование свидетельствует о том, что при использовании форм с дополнительными преимуществами во всасывании, в т.ч. микронизированных, не только возрастают время достижения насыщения препарата, накопление в зоне всасывания, но и существенно уменьшается время наступления эффекта.

В ревматологии стала активно использоваться инновационная форма ЛС ацеклофенак в виде крема под названием Аэртал крем (ОАО «Гедеон Рихтер», Венгрия). Форма выпуска: крем для наружного применения, 1,5%, белый однородный. Состав на 100 г крема: 1,5 г микронизированного ацеклофенака. Вспомогательные вещества: воск эмульсионный 10 г, парафин жидкий 4 г, метилпарагидроксибензоат 0,2 г, пропилпарагидроксибензоат 0,05 г, вода 84,25 г. Благодаря водной основе ЛС не оставляет следов и быстро впитывается.

Фармакокинетика крема ацеклофенак:

- всасывается из зоны нанесения, быстро достигая насыщения;
- накапливается в области всасывания, что способствует увеличению его противовоспалительной активности;
- постепенно поступает в системный кровоток в небольших концентрациях, в связи с чем риск нежелательных эффектов, в том числе, со стороны ЖКТ, минимизируется;
- после нанесения крем остается на коже в течение 8 часов;
- в верхних слоях кожи концентрация действующего вещества сохраняется более 16 часов, что обеспечивает постоянное поступление лекарственного средства в очаг воспаления;

- в системном кровотоке и биологических жидкостях метаболиты ацеклофенака не определяются, что свидетельствует об отсутствии системного действия, а следовательно - высокой безопасности препарата.

Показания к применению: 1) лечение всех типов локальной боли и воспаления вследствие любых повреждений опорно-двигательного аппарата, в том числе спортивные травмы; 2) уменьшение воспаления и боли при тендинитах, миозитах, люмбаго, кривошее, тендосиновитах, периартритах, ушибах. Режим дозирования: 1,5 – 2 г крема размером примерно с горошину (5-7 см поверхности кожи) наносить три раза в день легкими втирающими движениями.

Какие же преимущества имеет указанная лекарственная форма ацеклофенака? Благодаря микронизации субстанции ацеклофенака, Аэртал крем глубоко и быстро проникает в подлежащие ткани, создавая терапевтическую концентрацию в очаге воспаления и обеспечивая быстрое наступление противовоспалительной активности ЛС. Ацеклофенак – липофильная молекула, поэтому хорошо проникает через все слои кожного покрова. Отсутствие системного действия делает применение Аэртала крема безопасным. Благодаря водной основе, Аэртал крем не оставляет следов, быстро впитывается, легко наносится на кожу и не оставляет жирного блеска. Совместное применение Аэртала крема и Аэртала таблетки, благодаря аналогичной молекуле, позволяет усилить эффективность и повысить безопасность терапии.

Предложенный физиотерапевтический комплекс (фотоманнитотерапия и ультрафонофорез 1,5% крема Аэртал на область пораженных суставов) способствует повышению эффективности лечения, характеризуется хорошей переносимостью и может быть рекомендован для включения в схемы лечения пациентов с остеоартрозом (гонартрозом), в том числе и у пациентов пожилого возраста. Как правило, для указанных пациентов с хроническим болевым суставным синдромом с целью уменьшения риска развития нежелательных (побочных) эффектов предпочтительнее использование НПВС в виде геля, крема, мази. В связи с этим практический интерес представляет новая лекарственная форма микронизированного ацеклофенака в виде крема (1,5% крем Аэртал), которая

может использоваться для местного применения в области пораженных суставов как отдельно, так и совместно с воздействием на суставы лечебными физическими факторами.