

•Нестероидные противовоспалительные препараты (НПВП)

•Выполнил: Хабибуллин М.Р гр.371.

Нестероидные противовоспалительные препараты (НПВП)

- НПВП относятся к числу самых распространенных лекарственных средств, применяемых в клинической практике
- НПВП незаменимы при заболеваниях, сопровождающихся воспалением, болями и лихорадкой

Нестероидные противовоспалительные препараты

- В мире ежегодно выписывается **60 млн** рецептов на НПВП
- В Европе НПВП назначают **82%** врачей общей практики и **84%** ревматологов
- НПВП используют у **20%** стационарных больных
- Наиболее частая причина применения НПВП - ***болевогой синдром***

Показания к назначению НПВП (1)

- Воспалительные и дегенеративные ревматические заболевания:
 - ревматоидный артрит;
 - анкилозирующий спондилит;
 - другие спондилоартриты;
 - остеоартроз;
 - межпозвонковый остеохондроз и деформирующий спондилит;
 - микрокристаллические артропатии (подагра)
 - диффузные заболевания соединительной ткани
- Боли в нижней части спины
- Ревматические заболевания мягких тканей

Показания к назначению НПВП (2)

- Кардиология (профилактика тромбозов, воспалительные кардиопатии, ИБС?, атеросклероз?)
- Посттравматические и послеоперационные болевые синдромы, сопровождающиеся воспалением и отеком
- Малая хирургия
- Заболевания, сопровождающиеся болевым синдромом и воспалением
- Заболевания, сопровождающиеся болевым синдромом
- Тяжелые приступы мигрени
- Критические дни у женщин
- Почечная и желчная колика
- Деменция Альцгеймеровского типа
- Онкология (колоректальный рак, профилактика метастазирования)

Нестероидные противовоспалительные препараты: история

- 1898 аспирин
- > 1940 фенилбутазон
- 1963 индометацин
- > 1980 ибупрофен, кетопрофен, напроксен, диклофенак
- > 1990 пироксикам, набуметон, нимесулид
- > 1995 мелоксикам, лорноксикам, ацеклофенак, целекоксиб, рофекоксиб (виокс)
- > 2000 вальдекоксиб (бекстра), паракоксиб, **эторикоксиб и др. коксибы**

Функциональная активность ЦОГ-1 и ЦОГ-2



Категории ингибиторов ЦОГ

- **Избирательное** ингибирование ЦОГ-1 (аспирин)
- **ЦОГ-2 неселективные** (все «стандарт-ные» НПВП, включая диклофенак, индометацин, напроксен, ибупрофен и т.д.)
- **Частично селективные ЦОГ-2** ингибиторы (мовалис)
- **Специфические ЦОГ-2** (эторикоксиб, целекоксиб, рофекоксиб)

НПВП: успех vs риск

успех

Уменьшение боли
(уровень интенсивности боли)

Снижение воспаления

Улучшение физической активности
(степень ФН,
неблагоприятные мех. факторы)

Улучшение качества жизни

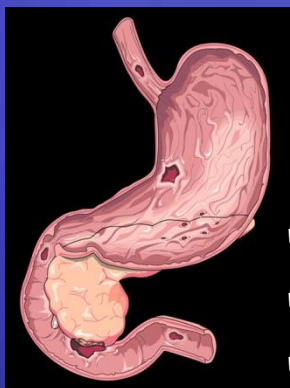


риск

Увеличение риска ЖКТ
(высокие дозы НПВП,
коморбидные, предшествующие
состояния, возраст)

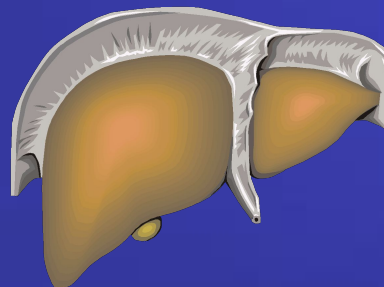
**КВ риск, связанный с НПВП/
ЦОГ-2 ингибиторами**
(возраст, ожирение, физическая,
активность, коморбидность)

Побочные эффекты НПВП



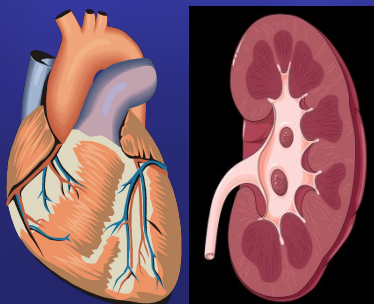
Желудочно-кишечные

- ✓ диспепсия
- ✓ язвы
- ✓ кровотечение/перфорация



Печеночные

- ✓ повреждение печеночных клеток

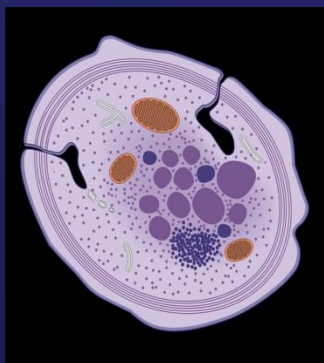


Кардио-ренальные

- ✓ артериальная гипертензия
- ✓ периферические отеки

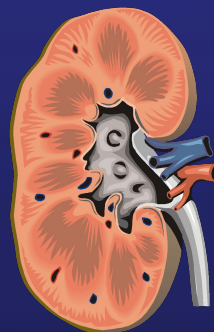
Тромбоцитарные

- ✓ нарушение агрегации
- ✓ повышение риска кровотечения



Почечные

- ✓ Снижение клубочковой фильтрации
- ✓ интерстициальный нефрит



Кожные

НПВС- что важно для выбора???

- Эффективность
- Удобство применения
- Доступность



АРКОКСИА (эторикоксиб): – новое средство от боли с улучшенными характеристиками

В клиническом исследовании оценки быстроты эффекта:

- Быстрый обезболивающий эффект уже через **24 минуты**
- Длительный обезболивающий эффект в течение **24 часов**



АРКОКСИА® (ЭТОРИКОКСИБ) ЗАРЕГИСТРИРОВАНА ДЛЯ ПРИМЕНЕНИЯ ПО ШИРОКОМУ СПЕКТРУ ПОКАЗАНИЙ¹

ПРИ БОЛИ И ВОСПАЛЕНИИ, ВЫЗВАННЫХ СЛЕДУЮЩИМИ СОСТОЯНИЯМИ

• ОСТЕОАРТРОЗ

60 мг
раз в день

- РЕВМАТОИДНЫЙ АРТРИТ
- АНКИЛОЗИРУЮЩИЙ СПОНДИЛИТ

90 мг
раз в день

- ОСТРЫЙ ПОДАГРИЧЕСКИЙ АРТРИТ

120 мг^а
раз в день

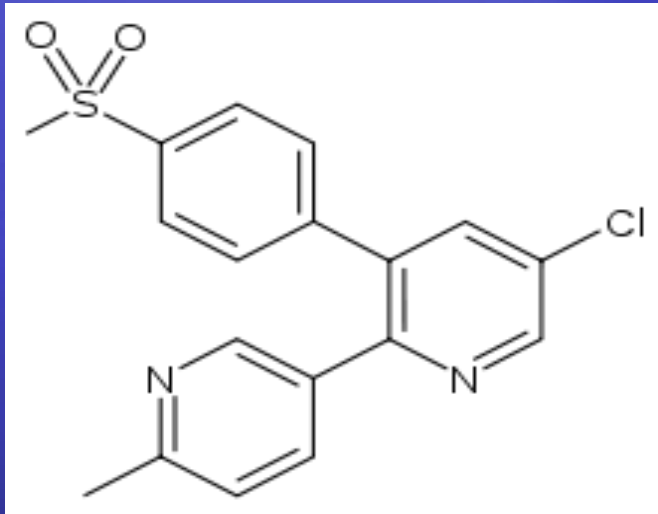
Приведенные дозы для каждого показания соответствуют максимально рекомендуемым суточным дозам¹.

^а Препарат АРКОКСИА 120 мг следует использовать только для купирования острой боли; длительность терапии при этом не должна превышать 8 суток¹.

Перед назначением препарата АРКОКСИА внимательно прочтите инструкцию по применению, в особенности разделы, посвященные противопоказаниям и мерам предосторожности.



Эторикоксиб: фармакология



**Самый селективный
ЦОГ-2 ингибитор:
Соотношение**

ЦОГ-1/ЦОГ-2 = 106

- Хорошо всасывается с высокой C_{max} , коротким T_{max} (примерно 1 час) и почти 100 % биодоступностью
- Линейная фармакокинетика: концентрация в плазме крови возрастает пропорционально принятой дозе
- $t_{1/2}$ приблизительно 24 часа
- Применение 1 раз в сутки

Matsumoto A., Cavanaugh P. Etoricoxib. *Drugs Today (Barc)*. 2004, 40(5): 395-414.

Martina S., Vesta K., Ripley T. Etoricoxib: a highly selective COX-2 inhibitor. *Ann Pharmacother.*, 2005, 39(5): 854-862.

Быстрый и длительный эффект

	T_{max} , часы	$t_{1/2}$
Эторикоксиб	1	22
Целебрекс	2–3	8–12
Диклофенак натрия	2–4	1–2,3
Ибупрофен	1–2	1,8–2
Мелоксикам	4,9–6	15–20
Напроксен	2–4	12–17
Индометацин	0,5–2	3–11
Нимесулид	2–3	2–5

АРКОКСИА (эторикоксиб): T_{max} и $t_{1/2}$

Аркоксия – самый высокоселективный к ЦОГ-2 препарат среди НПВС



*Сравнительная селективность НПВП:
ПК50 для подавления ЦОГ-1 и ЦОГ-2 в исследованиях
цельной крови человека¹*

Препарат	Индекс селективности к ЦОГ-2 по ПК50 ЦОГ-1/ЦОГ-2
Эторикоксиб	106
Целекоксиб	7,6
Нимесулид	7,3
Диклофенак	3,0
Мелоксикам	2,0
Индометацин	0,4
Ибупрофен	0,2

Примечание: ПК50 – подавляющая концентрация 50; все значения – средние ± станд. отклонение. Препараты расположены в порядке селективности в отношении ЦОГ-2

