

doi: 10.21518/1561-5936-2020-1-2-3-42-46

Боль под контролем профессионалов

Ирина Широкова, Юлия Прожерина, к.б.н., «Ремедиум»

В России основная часть амбулаторного приема приходится на пациентов, у которых диагностируют патологии позвоночника и суставов, главным проявлением которых является боль [1]. Ведущее место в лечении болевого синдрома занимают нестероидные противовоспалительные препараты (НПВП), среди которых выделяют мелоксикам, хорошо знакомый россиянам под брендом Амелотекс®.

Ключевые слова: боль, мелоксикам, местные лекарственные формы

Pain kept at bay by skilled practitioners

Irina Shirokova, Julia Prozherina, PhD in biology, Remedium

In Russia, the main part of outpatient care is provided to the patients diagnosed with disorders affecting the spine and joints, which manifest themselves as pain [1]. Non-steroidal anti-inflammatory drugs (NSAIDs) play a major role in pain syndrome management. Meloxicam, which is well known to Russians under Amelotex® brand, stands out from the rest of NSAIDs.

Keywords: pain, meloxicam, local dosage forms

Боль – самая распространенная причина обращения больного к врачу. С ней связано около 90% всех заболеваний [2]. Боль не только снижает работоспособность, ухудшает эмоциональное состояние и качество жизни, но и может стать непереносимой, вызывая тяжелую депрессию и мысли о суициде.

В клинической практике встречается 4 основных типа боли: транзиторная, связанная с активацией ноцицепторов при отсутствии тканевого повреждения (и часто не являющаяся причиной обращения к врачу); острая, возникающая в результате тканевого повреждения и активации ноцицепторов; хроническая – онкологическая и неонкологическая [3]. Отдельного внимания заслуживает боль неонкологического характера, сопровождающая заболевания опорно-двигательной системы – остеоартроз и боль в нижней части спины. Боль является основным проявлением этих весьма распространенных нозологических форм, рациональная патогенетическая терапия которых еще не разработана [4].

В основе ее лечения лежит использование НПВП – важнейшего и наиболее популярного класса анальгетиков в нашей стране. Более 30 млн человек в мире ежедневно принимают НПВП, причем 40% этих

пациентов в возрасте старше 60 лет. По прогнозам, это количество будет только возрастать по мере общего старения населения развитых стран и, соответственно, увеличения распространенности таких патологий, как дегенеративные заболевания опорно-двигательного аппарата и ревматические поражения мягких тканей [5].

Основное действие НПВП тесно связано с блокадой фермента циклооксигеназы (ЦОГ-2), отвечающего за активный синтез простагландинов (ПГ) – главных медиаторов боли. В зависимости от селективности по отношению к ЦОГ-2 все НПВП разделяются на три группы: неселективные ингибиторы ЦОГ-1 и ЦОГ-2 (н-НПВП), селективные ингибиторы ЦОГ-2 и высокоселективные ингибиторы ЦОГ-2 (коксибы) (табл. 1). Благодаря селективности удается избежать подавления активности фермента ЦОГ-1, необходимого для поддержания защитных свойств слизистой оболочки желудочно-кишечного тракта (ЖКТ). Селективные ингибиторы ЦОГ-2, к которым относятся мелоксикам, лорноксикам, набуметон, нимесулид и теноксикам, характеризуются меньшим риском осложнений со стороны ЖКТ по сравнению с неселективными препаратами

и не вызывают осложнений со стороны сердечно-сосудистой системы, а значит, могут рекомендоваться многим пациентам [6].

Логично было бы считать, что высокоселективные ингибиторы ЦОГ-2 (коксибы) должны обладать еще более высоким профилем безопасности, чем селективные ингибиторы ЦОГ-2. Однако в исследованиях D. Layton с соавт. (2003) выяснилось, что риск осложнений со стороны сердечно-сосудистой системы, в частности тромбэмболических явлений, существенно выше на фоне применения коксибов, чем при лечении мелоксикамом. Объясняется это тем, что коксибы, обладающие способностью подавлять исключительно ЦОГ-2 (соотношение ингибирования ЦОГ-2/ЦОГ-1 приблизительно 200/1), угнетают синтез простагландина (анти-тромбогенного ПГ). При этом они не оказывают влияния на синтез тромбоксана A₂ (тромбогенного ПГ), образование которого регулируется ЦОГ-1. Как следствие, соотношение анти- и протромбогенных факторов существенно смещается в сторону последних [6].

Показательным примером является более чем 20-летнее применение в мировой клинической

ТАБЛИЦА 1. Классификация НПВП по степени селективности [6]

Группы НПВП	Ключевые МНН	Торговые наименования ¹
Неселективные ингибиторы (блокируют ЦОГ-1 и ЦОГ-2)	Амтолметин гуацил	Найзилат
	Ацетилсалициловая кислота	Аспирин, Аспикор, Ацекардол, КардиАСК, Тромбо АСС и др.
	Диклофенак	Вольтарен, Ортофен, Диклак, Диклоран, Наклофен и др.
	Ибупрофен	Долгит, Нурофен, Ибуфен, МИГ, Педея и др.
	Индометацин	Индометацин, Метиндол ретард и др.
	Кеторолак	Кетанов, Кеталгин, Кетолак, Кеторол и др.
	Кетопрофен	Кетонал, Пенталгин экстра-гель, Фастум, Быструмгель и др.
	Напроксен	Налгезин, Напроксен и др.
	Этодолак	Нобедолак
Селективные ингибиторы ЦОГ-2	Лорноксикам	Зорника, Ксефокам, Лорноксикам и др.
	Мелоксикам	Амелотекс, Би-ксикам, Мовалис, Мовасин и др.
	Нимесулид	Найз, Нимесил, Нимика, Пролид и др.
	Теноксикам	Артосан, Тексаред, Теноксикам
Высокоселективные ингибиторы ЦОГ-2 (коксибы)	Парекокиб	Династат
	Рофекоксиб	Виокс
	Целекоксиб	Дилакса, Ревмакокс, Целебрекс и др.
	Эторикоксиб	Аркоксиа, Бикситор, Костарокс, Риксия, Эторикоксиб и др.

Согласно ГРЛС: <https://grls.rosminzdrav.ru/>.

ТАБЛИЦА 2. Топ-5 МНН, назначаемых при заболеваниях опорно-двигательного аппарата, по итогам III кв. 2019 г.

Рейтинг	МНН (АТС-группы)	Назначения, тыс.	Доля назначений, %
1	Мелоксикам (M01AC06, M02AA)	3 956,5	8,9%
2	Нимесулид (M01AX17, M02AA)	2 702,6	6,1%
3	Диклофенак (M01AB05, M02AA15, S01BC03)	2 612,8	5,9%
4	Кетопрофен (A01AD11, M01AE03, M02AA10)	2 014,9	4,5%
5	Хондроитина сульфат (M01AX25, M02AX, M09AX02, БАД)	1 511,5	3,4%

Источник: PIndex, Synovate Comcon

практике селективного ЦОГ-2-ингибитора мелоксикама, который и до сегодняшнего дня остается весьма востребованным ЛС среди

группы НПВП. По своему обезболивающему эффекту он сопоставим с другими НПВП, назначаемыми при лечении болей в спине,

люмбосакральной радикулопатии, остеоартрозе, ревматоидном артрите, анкилозирующем спондилите и т.д., однако имеет более высокий профиль безопасности. Мелоксикам отличается хорошей переносимостью, значительно меньшее число осложнений со стороны ЖКТ в сравнении с н-НПВП. Это подтверждают результаты многочисленных рандомизированных клинических исследований [7]. Согласно клиническим рекомендациям по диагностике и лечению остеоартроза среди всех групп препаратов отдается предпочтение именно селективным НПВП. Отметим, что данная группа ЛП, ввиду высокого профиля безопасности, рекомендована в том числе людям старше 65 лет и имеющим сопутствующие заболевания [8].

Согласно данным Comcon Prindex, при заболеваниях опорно-двигательного аппарата врачи наиболее часто назначают селективные НПВП. При этом первое место по числу врачебных назначений занимает мелоксикам (табл. 2).

Мелоксикам выпускается в разных формах, включая местные формы. К слову, первым зарегистрированным в России монокомпонентным средством на основе мелоксикама для местного применения стал препарат Амелотекс® гель, появившийся на рынке в 2014 г. Вплоть до этого времени мировая номенклатура препаратов мелоксикама включала растворы для инъекций, таблетки и ректальные суппозитории, тогда как гели мелоксикама для кожного применения в ней отсутствовали. Публикации по сравнительной оценке анальгетического и противовоспалительного действия геля мелоксикама (Амелотекс® гель) и гелей диклофенака и пироксикама свидетельствуют о том, что мелоксикам, обладая крупными размерами молекул, устойчив в биологических средах, обладает более глубоким проникновением в подлежащие ткани и может задерживаться в мягких тканях на долгий срок, обеспечивая

длительный эффект, чему способствует более продолжительный период полувыведения [7].

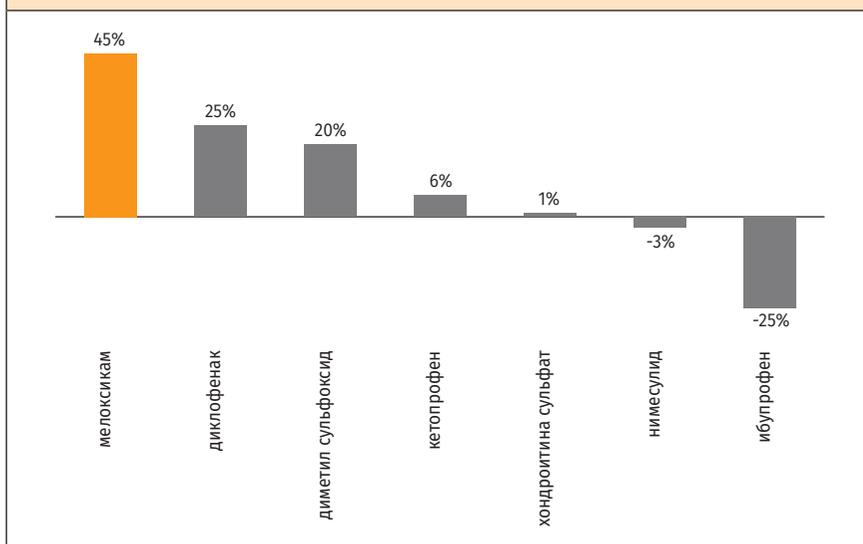
Как отмечает Андрей Евгеньевич Каратеев, заведующий лабораторией патофизиологии боли и клинического полиморфизма скелетно-мышечных заболеваний ФГБНУ НИИР им. В.А. Насоновой, в последние годы интерес к локальным формам НПВП заметно возрос. Пристальное внимание медицинской общественности к проблеме осложнений, связанных с использованием этой лекарственной группы, определяет необходимость поиска подходов к их более безопасному использованию. Очевидно, что у существенного контингента больных с тяжелой коморбидной патологией (например, у лиц с ИБС, перенесших кардиоваскулярные катастрофы) системное назначение НПВП может представлять серьезную и вполне реальную угрозу жизни. Единственным методом безопасного применения НПВП у этих пациентов может считаться только использование локальных форм. Именно поэтому Амелотекс® гель получил широкое признание среди врачей и находится в лидерах среди препаратов, рекомендуемых фармацевтами. Об этом свидетельствует стремительный рост его продаж.

По итогам 2019 г. мелоксикам продемонстрировал самый высокий прирост продаж в стоимостном выражении (+45% в руб., 2019 г. к 2018 г.) среди топ-7 наиболее востребованных однокомпонентных препаратов местного действия, применяемых при суставной и мышечной боли (рис. 1).

В качестве одного из ключевых драйверов сегмента мелоксикамов выступает препарат Амелотекс® гель. Начиная с 2014 г. объем его продаж стремительно растет. Так, по итогам 2019 г. было реализовано порядка 1,6 млн упаковок этого ЛП на сумму около 414 млн руб.

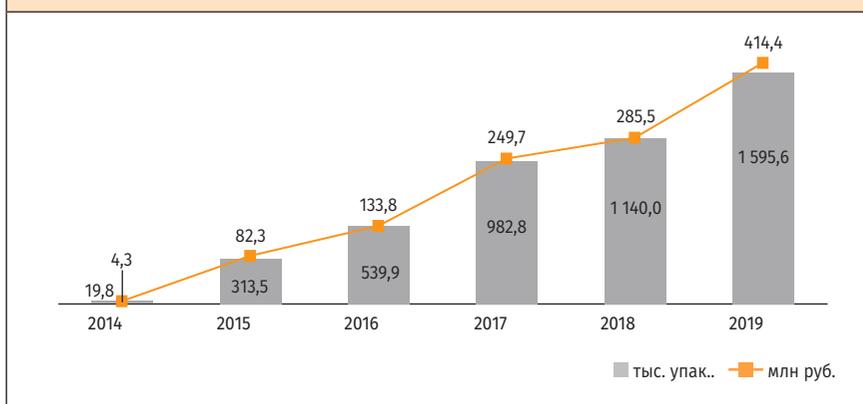
К слову, суммарный объем продаж Амелотекса по всем формам выпуска также устойчиво увеличивается.

РИСУНОК 1. Рейтинг приростов продаж в 2019 г. к 2018 г. среди топ-7 однокомпонентных топических препаратов для местного применения при суставной и мышечной боли, % руб.



Источник: розничный аудит IQVIA

РИСУНОК 2. Динамика продаж препарата Амелотекс® гель в России



Источник: розничный аудит IQVIA

Общий объем продаж бренда суммарно по всем сегментам рынка в 2019 г. составил 4,4 млн упаковок, или 1,3 млрд руб. в ценах конечного потребления, что существенно выше показателей предыдущих лет (рис. 2).

Появление препарата Амелотекс® гель существенно расширяет возможности анальгетической терапии, контроля острой и хронической боли. В зависимости от состояния пациента врачи в своих назначениях выбирают разные лекарственные формы – таблетки для приема внутрь, инъекционные

растворы, локальные формы (гели, кремы, мази) и др. Линейка бренда Амелотекс® включает разные формы выпуска (таблетки, суппозитории, инъекционные растворы, гель), что позволяет найти оптимальное решение для каждого пациента. Особое место занимают местные формы препарата. Амелотекс® гель может быть показан для «усиления» системного лечения и/или в тех случаях, когда системное назначение невозможно из-за наличия жестких противопоказаний к пероральному приему НПВП.

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ/REFERENCES

1. Заболевания опорно-двигательного аппарата: тактика лечения. 2017. Режим доступа: <https://www.provrach.ru/article/546-qqess7-zabolevaniya-oporno-dvigatel'nogo-apparata>.
2. Денисов И.Н., Кузнецова О.Ю., Моисеева И.Е. и др. Болевой синдром. Клинические рекомендации для врачей общей практики (семейных врачей). М.; СПб.; Ростов н/Д; 2014. 26 с. Режим доступа: <http://gpfm.ru/assets/image%20for%20events/bolevoysindrom.PDF>.
3. Самойлова Н.В., Загоруйко О.И., Гнездилов А.В., Медведева Л.А. Возможности лечения и реабилитации пациентов с болевым синдромом в многопрофильной хирургической клинике. Хирургия. 2013;(3):75–78. Режим доступа: https://www.researchgate.net/publication/236276317_Treatment_and_rehabilitation_of_patients_with_pain_syndrome_in_surgical_clinic.
Samoilova N.V., Zagorul'ko O.I., Gnezdilov A.V., Medvedeva L.A. Treatment and rehabilitation of patients with pain syndrome in surgical clinic. *Khirurgiya = Khirurgiia*. 2013;(3):75–78. (In Russ.) Available at: https://www.researchgate.net/publication/236276317_Treatment_and_rehabilitation_of_patients_with_pain_syndrome_in_surgical_clinic.
4. Каратеев А.Е. Анальгетическая терапия при заболеваниях опорно-двигательного аппарата: место мелоксикама. Трудный пациент. 2014;12(11):42–49. Режим доступа: <http://t-pacient.ru/articles/8491/>.
Karateev A.E. Analgesic Therapy for the Diseases of Musculoskeletal

System: Position of Meloxicam. *Trudnyy patsient = Difficult patient*. 2014;12(11):42–49. (In Russ.) Available at: <http://t-pacient.ru/articles/8491/>.

5. Журавлева М.В., Кулес В.Г., Прокофьев А.Б., Сереброва С.Ю., Городецкая Г.И., Бердникова Н.Г. Рациональное применение НПВП – баланс эффективности и безопасности (Обзор литературы). *Международный журнал прикладных и фундаментальных исследований*. 2016;(6–4):687–696. Режим доступа: <https://applied-research.ru/ru/article/view?id=9677>.
6. Мищенко Н. Мовалис в клинической практике: оптимальное соотношение эффективности и безопасности. *Здоровье Украины*. 2011;(1):34–35. Режим доступа: https://www.health-ua.com/pics/pdf/ZU_2011_Nevro_1/34-35.pdf.
7. Денисов Л.Н. Рациональная терапия болевого синдрома при заболеваниях опорно-двигательного аппарата. *Медицинский Совет*. 2017;(17):132–136. doi.org/10.21518/2079-701X-2017-17-132-136.
Denisov L.N. Reasonable therapy of pain syndromes of diseases of the musculoskeletal system. *Meditsinskiy sovet = Medical Council*. 2017;(17):132–136. (In Russ.) doi.org/10.21518/2079-701X-2017-17-132-136.
8. Денисов И.Н., Лесняк О.М., Попов А.А., Максимов Д.М., Солодовников А.Г. и др. Клинические рекомендации: диагностика, лечение и профилактика остеоартроза (остеоартрита) в общей врачебной практике. М.; СПб.; Казань; 2013. 29 с. Режим доступа: <http://gpfm.ru/assets/image%20for%20events/osteartroz.PDF>.



НАУЧНО-ПРАКТИЧЕСКАЯ КОНФЕРЕНЦИЯ «ЭКСПЕРТИЗА И РЕГИСТРАЦИЯ ЛЕКАРСТВЕННЫХ СРЕДСТВ В ЕАЭС» РЕГЛЕК – ЕАЭС 2020

20–22 апреля
2020
Москва

гостиница
«Холидей Инн Москва
Сокольники»



РегЛек – ЕАЭС
2020

В ПРОГРАММЕ КОНФЕРЕНЦИИ

20 апреля

Пленарное заседание

Секционные заседания

- Особенности организации проведения регуляторных процедур по правилам ЕАЭС в странах Союза. Организация информационного обмена
- Очистка промышленных линий по производству ЛС и пределы воздействия на здоровье
- Экспертиза материалов регистрационного досье в части оценки качества по процедурам ЕАЭС
- Особая продукция — особая регистрация
- Инспектирование в ЕАЭС: кого, когда, зачем и как

21 апреля

Пленарная дискуссия

- Корабль Союз — полет нормальный?

Секционные заседания

- Место инновационных (гибридных) ЛП в системе регистрации ЕАЭС
- Экспертные требования к оценке соотношения ожидаемой пользы к возможному риску применения препаратов: критический взгляд на анализируемое досье
- Надлежащая регуляторная практика ЕАЭС
- Формирование и использование информации о лекарственных препаратах: что нужно знать фармпроизводителю

Круглый стол

- Актуальные вопросы экспертизы и регистрации лекарственных средств

22 апреля

Пленарная дискуссия

- Выпуск в гражданский оборот ЛП: система заработала, есть ли проблемы

Секционные заседания

- Актуальное состояние применения правил и требований ЕАЭС при подаче электронного общего технического документа
- Различные подходы к маркировке ЛП на этапе технологического процесса
- Фармакопейная сессия
- Трансфер и валидация
- В центре проблемы: модуль № 3 регистрационного досье и приведение в соответствие с правилами Союза

Дополнительная информация на сайте www.fru.ru и по тел.: (495) 359-06-42, 359-53-38, e-mail: fru@fru.ru

Обращаем Ваше внимание, что Оргкомитет конференции оставляет за собой право вносить изменения в программу и состав докладчиков

РЕКЛАМА