Научная статья
Original article
УДК 615.061

НЕСТЕРОИДНЫЕ ПРОТИВОВОСПАЛИТЕЛЬНЫЕ ПРЕПАРАТЫ

NONSTEROIDAL ANTI-INFLAMMATORY DRUGS

Хасаева Елизавета Исаевна, Студент Марийский государственный университет
Деулина Любовь Евгеньевна, Студент Марийский государственный университет

Khasaeva Elizaveta Isaevna, lyubadeu@mail.ru
Deulina Lyubov Evgenievna, lyubadeu@mail.ru

Аннотация. В данной статье рассматривается актуальная тема, как нестероидные противовоспалительные препараты. Нестероидные противовоспалительные препараты занимают лидирующие позиции по числу аптечных продаж. Это большая группа препаратов, широко используемая в практике самолечения. На Российском фармацевтическом рынке представлено более 210 наименований лекарственных препаратов данной группы. Около 80% всех НПВП отпускаются в аптеках без рецепта врача. Частота использования НПВП в клинической практике обусловлена спектром их фармакологических эффектов: обезболивающим, противовоспалительным, жаропонижающим. Статья посвящена механизмам развития воспаления, дана классификации препаратов группы НПВП, а также приведен анализ аптечных продаж данных препаратов.

Annotation. This article discusses the topical topic of nonsteroidal anti-inflammatory drugs. Nonsteroidal anti-inflammatory drugs occupy a leading position in the number of pharmacy sales. This is a large group of drugs widely used in the practice of self-medication. There are more than 210 names of medicines of this group on the Russian pharmaceutical market. About 80% of all NSAIDs are dispensed in pharmacies without a doctor's prescription. The frequency of use of NSAIDs in clinical practice is due to the spectrum of their pharmacological effects: analgesic, anti-inflammatory, antipyretic. The article is devoted to the mechanisms of inflammation development, the classification of drugs of the NSAID group is given, as well as the analysis of pharmacy sales of these drugs is given.

Ключевые слова: противовоспалительные препараты; воспаление; циклооксигеназа, простогландины; ингибиторы.

Keywords: anti-inflammatory drugs; inflammation; cyclooxygenase; prostaglandins; inhibitors.

Противовоспалительные препараты – группа лекарственных средств, обладающих жаропонижающим, противовоспалительным, анальгезирующим эффектами. Широко используемая группа препаратов, большинство представителей которой продаются без рецепта врача.

Воспаление – защитная реакция организма на повреждающие факторы. Роль воспаления:

- ограничение воспалительного очага от здоровых тканей;
- фиксация в очаге воспаления патогенного фактора и его уничтожение;
- удаление продуктов распада и восстановление целостности тканей;
- выработка антител в процессе воспаления.

Основной механизм действия нестероидных противовоспалительных препаратов заключается в действии циклооксигеназы на арахидоновую кислоту, в следствии чего тормозится синтез простогландинов. Известны 2 изоформы циклооксигеназы – ЦОГ-1 и ЦОГ-2. ЦОГ-1 является постоянной циклооксигеназой, а активность ЦОГ-2 повышается только при воспалении и

синтезирует большое количество простогландинов Е2 и I2, которые в очаге воспаления вызывают расширение сосудов, увеличение проницаемости сосудистой стенки и др. Все эти факторы приводят к развитию основных признаков воспаления. Поэтому с целью уменьшения выраженной воспалительной реакции применяют противовоспалительные средства.

Противовоспалительные средства делятся на 3 группы:

1) Стероидные противовоспалительные средства (глюкокортикоиды);

2) Нестероидные противовоспалительные средства:

1. Неселективные ингибиторы ЦОГ-1 и ЦОГ-2

а) необратимые ингибиторы ЦОГ (аспирин)

б) обратимые ингибиторы ЦОГ (ибупрофен, диклофенак натрия)

2. Селективные обратимые ингибиторы ЦОГ-2 (нимесулид, мелоксикам, целекоксиб)

3) Медленно действующие противоревматоидные средства:

1. Препараты золота: ауранофил, D-пеницилламин

2. 4-Аминохолины: хлорохин, гидроксихлорохин

Глюкокортикоиды ингибируют фосфолипазу А2, нарушая образование простогландинов. Кроме того, обладают иммуносупрессивным действием, поэтому их часто применяют при аутоиммуных заболеваниях, которые сопровождаются воспалением, например, системная красная волчанка, бронхиальная астма, экзема. При длительном применении данных препаратов могут возникнуть следующие побочные эффекты: снижение иммунитета, остеопороз, гипергликемию, ульцерогенное действие, психические нарушения, повышение артериального давления и т.д.

Противовоспалительное действие НПВС, в основном, обусловлено блокадой ЦОГ и последующим угнетением синтеза простагландинов Е2 и I2 в очаге воспаления.

Анальгетическое действие НПВС связано с блокадой синтеза простагландинов Е2 и I2 и уменьшением действия брадикинина на

ноцицепторы. Нестероидные противовоспалительные препараты наиболее эффективны при болях воспалительного характера.

Жаропонижающее действие НПВС также связано со способностью блокировать синтез простагландинов. При воспалении интерлейкин-1 стимулирует выработку простагландина Е2 в гипоталамусе, что приводит к лихорадке. Нарушение синтеза простагландина Е2 в ЦНС приводит к развитию жаропонижающего действия.

Неселективные ингибиторы ЦОГ-1 и ЦОГ-2 ингибируют обе изоформы ЦОГ, поэтому большой риск развития побочных эффектов при длительном применении, связанных с блокадой ЦОГ-1.

Побочные эффекты неселективных противовоспалительных препаратов: раздражение и изъявление слизистой оболочки желудка, ульцерогенной действие. Редкие (менее 5%) побочные эффекты: аллергические реакции, гепатотоксичность, нейротоксичность, лейкопения, тромбоцитопения.

Ацетилсалициловая кислота. Необратимо блокирует ЦОГ. Обладает большим сродством к ЦОГ-1, чем к ЦОГ-2. Быстро всасывается из желудка, максимальная концентрация достигается через 1-2 часа после применения. Используется как жаропонижающее и анальгетик в средних дозах. В высоких дозах используется как противовоспалительное. В настоящее время применяется как антиагрегант в дозах 100-150 мг в сутки. Специфические побочные эффекты: раздражение и изъявление слизистой оболочки желудка, аспириновая астма. Противопоказания: гиперчувствительность, возраст менее 5 лет, заболевания ЖКТ, бронхиальная астма, последний триместр беременности, кормление грудью.

Ибупрофен. Анальгетическое действие более выражено по сравнению с противовоспалительным. Анальгетическое действие развивается через 0,5 ч после применения, длительность действия 4-6 ч. Хорошо всасывается при приеме внутрь, период полувыведения составляет 2 часа. Побочные эффекты

у ибупрофена типичные для НПВС, но считается, что он более безопасный в применении.

Селективные ингибиторы ЦОГ-2 ингибируют преимущественно ЦОГ-2, поэтому противопоказания связанные с ингибированием ЦОГ-1 встречаются реже и возникают обычно при длительном применении.

Нимесулид. Обладает кислотными свойствами, поэтому не вызывает раздражение ткани. Максимальная концентрация достигается через 2-3 ч. Связывание с белками 97,5%, период полувыведения 3-6 ч. Применяется при бронхиальной астме, менструальных болях

Медленно действующие противоревматоидные средства. Препараты золота используются для лечения ревматоидного артрита. Механизм противовоспалительного действия препаратов золота не выяснено. Эти соединения угнетают активность макрофагов, а также уменьшают синтез медиаторов воспаления. Побочные эффекты: нарушения со стороны ЖКТ, угнетение кроветворения, нарушение функций почек, пигментация кожи.

Нами был проведен анализ продаж НПВП в аптечном пункте №9 АО «Марий Эл Фармация». Исследование показало, что лидером по числу проданных упаковок среди инъекционных препаратов стал амелотекс (45,5%), на втором месте стоит диклофенак (27,3%), чуть меньше продажи у мелоксикама (22,7%), а мовалис занимает только 4,5% (рисунок 1).

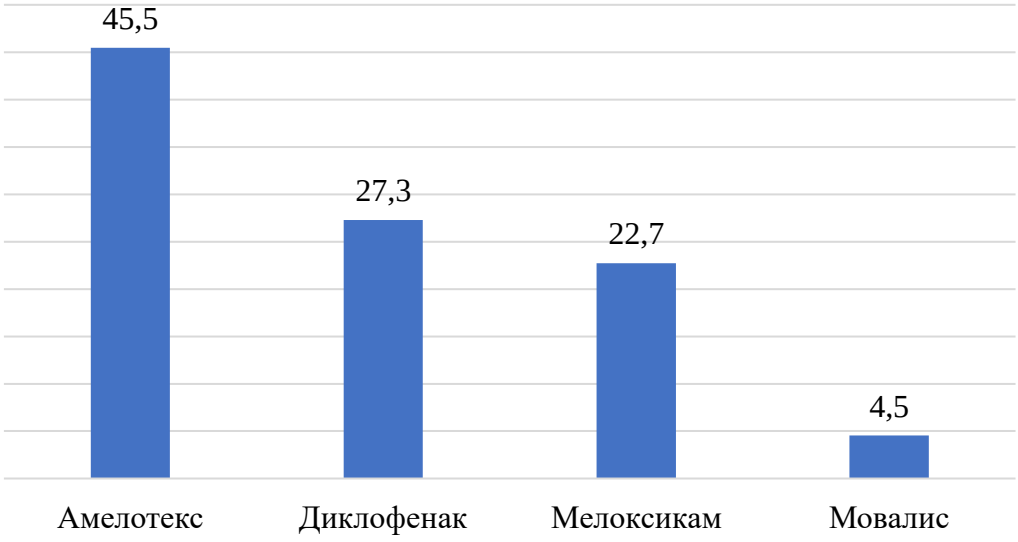

Рисунок 1. Продажи инъекционных форм НПВП, %

Источник: анализ авторов

Далее мы проанализировали продажи пероральных форм НПВП. Исследование показало, что наибольшим спросом пользуется ацетилсалициловая кислота (32,6%), нимесулид (21,7%), ибупрофен (17,4%), найз (10,9%). Доля продаж амелотекса и мовасина 6,5% и 5,4% соответственно. Продажи диклофенака и нимесила занимают незначительный процент (рисунок 2).

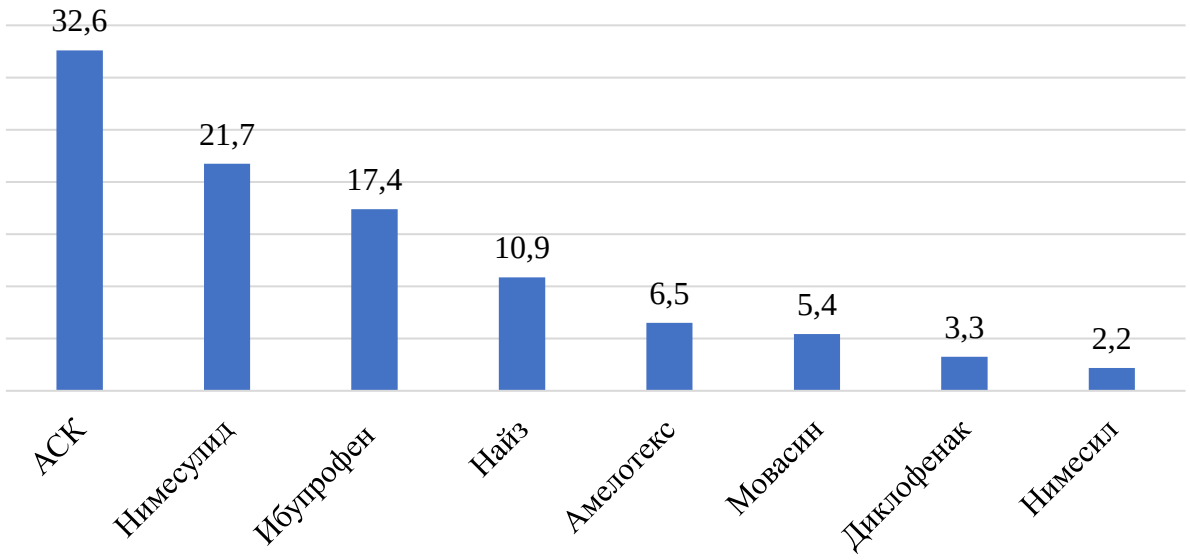

Рисунок 2. Продажи пероральных форм НПВП, %

Источник: анализ авторов

Выводы: таким образом, НПВС, пользующиеся наибольшим спросом, такие как ацетилсалициловая кислота, нимесулид, ибупрофен, применяются как анальгетики и жаропонижающие препараты, но имеют побочные эффекты в виде раздражения слизистой оболочки желудка, ульцерогенного действия и аллергических реакций. Из инъекционных препаратов предпочтение покупателей отдается амелотексу.

Литература

1. Лекции по фармакологии для высшего медицинского и фармацевтического образования // В.М. Брюханов, Я.Ф. Зверев, В.В. Лампатов, А.Ю. Жариков, О.С. Талалаева. — Барнаул: изд-во Спектр, 2014. — 560 с. ISBN 978-5-904061-47-0

2. Фармакология: учебник // под ред. А. А. Свистунова, В. В. Тарасова. — М.: Лаборатория знаний, 2017. — 768 с. ISBN 978-5-00101-032-6
3. Учебное пособие для студентов, интернов, педиатров (для аудиторной и внеаудиторной работы). — Благовещенск: 2016. С. 67-95.
4. Курс лекций по фармакологии в 2-х томах: Том 2; Пособие // М.Р. Конорев, И.И. Крапивко, Д.А. Рождественский. — Витебск: ВГМУ, 2013. — 250 с. ISBN 978-985-466-679-2
5. Фармакология // Под ред. Р.Н. Аляутдина. — 2-е изд., испр. — М.: ГЭОТАР-МЕД, 2004. — 592 с: ил. Компьютерная вёрстка С.А. Микрюкова. ISBN 5-9231-0441-5
6. Харкевич, Д. А. Фармакология // Д. А. Харкевич - Москва: ГЭОТАР-Медиа, 2017. — 760 с. - ISBN 978-5-9704-3884-8. - Текст: электронный // URL: https://www.rosmedlib.ru/book/ISBN9785970438848.html (дата обращения: 25.03.2022).
7. Белоусов Ю.Б., Моисеев В.С., Лепахин В.К. Клиническая фармакология и фармакотерапия: Руководство для врачей. — М.: Универсум, 1993. С. 259-280.
8. Нестероидные противовоспалительные препараты // Дятчина Л.И., Ханов А.Г. – М.: Инфра-М, 2014. – 80 с.
9. Особенности применения нестероидных противовоспалительных препаратов: учебное пособие для студентов / Д.В. Варганова, [И.А. Виноградова, Е.Е. Лоскутова, А.С. Лесонен, Ю.П. Матвеева, О.В. Жукова, В.Д. Юнаш, Т.А. Лотош]; М-во образования и науки Рос. Федерации, Федер. гос. бюджет. образоват. учреждение высш. образования Петрозавод. гос. ун-т. − Петрозаводск: Изд-во ПетрГУ, 2017. − 59 с.
10. Машковский, М. Д. Лекарственные средства: пособие для врачей / М. Д. Машковский, науч. ред.: С. Д. Южаков. – Изд. 15-е, перераб., испр. и доп. – Москва: Новая Волна, 2008. – 1206 с.

Literature

1. Lectures on pharmacology for higher medical and pharmaceutical education // V.M. Bryukhanov, Ya.F. Zverev, V.V. Lampatov, A.Yu. Zharikov, O.S. Talalaeva. — Barnaul: publishing house Spectrum, 2014. — 560 p. ISBN 978-5-904061-47-0
2. Pharmacology: textbook // edited by A. A. Svistunov, V. V. Tarasov. — M.: Laboratory of Knowledge, 2017. — 768 p. ISBN 978-5-00101-032-6
3. Textbook for students, interns, pediatricians (for classroom and extracurricular work). — Blagoveshchensk: 2016. pp. 67-95.
4. A course of lectures on pharmacology in 2 volumes: Volume 2; Manual // M.R. Konorev, I.I. Krapivko, D.A. Rozhdestvensky. — Vitebsk: VSMU, 2013. — 250 p. ISBN 978-985-466-679-2
5. Pharmacology // Edited by R.N. Alyautdin. — 2nd ed., ispr. — M.: GEOTAR-MED, 2004. — 592 p.: ill. Computer layout by S.A. Mikryukov. ISBN 5-9231-0441-5
6. Harkevich, D. A. Pharmacology // D. A. Harkevich - Moscow: GEOTAR-Media, 2017. — 760 p. - ISBN 978-5-9704-3884-8. - Text: electronic // URL: https://www.rosmedlib.ru/book/ISBN9785970438848.html (accessed: 03/25/2022).
7. Belousov Yu.B., Moiseev V.S., Lepakhin V.K. Clinical pharmacology and pharmacotherapy: A guide for doctors. — M.: Universum, 1993. pp. 259-280.
8. Nonsteroidal anti-inflammatory drugs // Dyatchina L.I., Khanov A.G. – M.: Infra-M, 2014. – 80 p.
9. Features of the use of nonsteroidal anti-inflammatory drugs: a textbook for students / D.V. Varganova, [I.A. Vinogradova, E.E. Loskutova, A.S. Lesonen, Yu.P. Matveeva, O.V. Zhukova, V.D. Yunash, T.A. Lotosh]; Ministry of Education and Science of the Russian Federation. Federation, Federal State budget. educated. the institution is higher. education Petrozavodsk State University. − Petrozavodsk: Publishing House of PetrSU, 2017. − 59 p.

10. Mashkovsky, M. D. Medicinal products: manual for doctors / M. D. Mashkovsky, scientific ed.: S. D. Yuzhakov. – Ed. 15th, reprint, ispr. and add. – Moscow: New Wave, 2008. – 1206 p.

© Хасаева Е.И., Деулина Л. Е., Научно-образовательный журнал для студентов и преподавателей «StudNet» №5/2022.

Для цитирования: Хасаева Е.И., Деулина Л. Е.НЕСТЕРОИДНЫЕ ПРОТИВОВОСПАЛИТЕЛЬНЫЕ ПРЕПАРАТЫ// Научно-образовательный журнал для студентов и преподавателей «StudNet» №5/2022