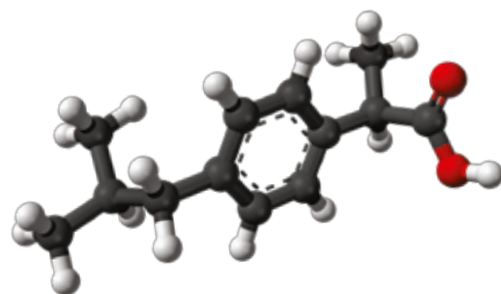


ИБУПРОФЕН: первые 50 лет

К празднованию 50-летнего юбилея со дня открытия ибупрофена профессор Ким Рейнсфорд, почетный профессор кафедры биомедицинских наук в университете Шеффилд Халлам (Великобритания) и всемирно известный специалист по ибупрофену, поделился своими мыслями о том, почему ибупрофен является достойным препаратом первого выбора для анальгезии



— КАКОВА ИСТОРИЯ ПОЯВЛЕНИЯ ИБУПРОФЕНА?

— Открытие и выход ибупрофена на рынок являются результатом тщательных и систематических научных исследований доктора (а впоследствии профессора) Стюарта Адамса. В этом году исполняется 50 лет с тех пор, как профессор С. Адамс начал исследования новой группы препаратов — пропионовых кислот, что и привело к открытию и патентованию ибупрофена. Будет также полезно вспомнить, что до 1962 года основным обезболивающим и антипиретическим препаратом был аспирин. Кроме того, были доступны еще два противовоспалительных средства — фенилбутазон и кортизон, но они характеризовались очень высокой токсичностью. Открытие «супераспирина», который заменил бы все эти препараты, представлялось уникальной возможностью, которая и была реализована в ибупрофене.

— ЧТО ЕЩЕ ИНТЕРЕСНОГО БЫЛО СВЯЗАНО С ОТКРЫТИЕМ ИБУПРОФЕНА?

— Сделанное открытие было результатом не только новой научной мысли. Интересно, что оно было сделано в ограниченных лабораторных условиях, если сравнивать с действующими сегодня стандартами. В то время было очень мало известно о механизмах развития воспаления и биохимических мишенях, которые могли быть использованы для действия препарата. Цель доктора С. Адамса сводилась

к тому, что новый препарат должен был иметь более высокий профиль безопасности и лучшую переносимость, чем аспирин, — он должен был стать «супераспирином». В то время многие терапевтические мишени и механизмы действия, о которых мы знаем сегодня, не были известны. Сделанное открытие было в значительной сте-

продолжали накапливаться, в 1969 г. препарат бы выведен на рынок Великобритании как средство для лечения ревматоидного артрита. В 1983 г., когда стало ясно, что препарат безопасен при назначении в суточных дозах до 1200 мг, он был одобрен Комитетом по безопасности лекарственных средств Великобритании для безрецептурного приме-

У ибупрофена высокий токсикологический барьер. Следовательно, препарат можно принимать в больших, нежели стандартно рекомендуется, дозах без каких-либо серьезных побочных эффектов и, что важно, без необратимых влияний на печень, как это случается при приеме парацетамола и диклофенака

пени интуитивным, что делает его особенно замечательным.

Во время работы над ибупрофеном доктор С. Адамс принял ряд правильных предварительных решений: например, не гнаться за созданием сильного препарата, а сделать акцент на более высоком профиле безопасности. И этот замысел выдержал проверку временем. Поскольку доказательства безопасности и эффективности ибупрофена

нения и стал первым неаспириновым НПВС, которому был присвоен статус ОТС-средства. Годом позже, в 1984 г., его одобрило Управление по контролю за качеством продуктов и лекарственных средств США в качестве ОТС-средства. С тех пор ибупрофен стал доступен более чем в 90 странах мира.





Стюарт Адамс (справа на снимке) с коллегами в начале 60-х годов

— ПОЧЕМУ ЭФФЕКТИВЕН ИБУПРОФЕН?

— Для этого необходимо понять, как он работает. Его основной эффект связан с блокадой работы ферментов под названием циклооксигеназы (ЦОГ), которые вовлечены в продукцию простагландинов как результат химического ответа организма на воспалительное повреждение при воспалительных заболеваниях и состояниях. Это же обстоятельство делает ибупрофен эффективным антипиретиком, поскольку появление лихорадки связано с накоплением простагландинов в головном мозге, а также с воспалением на периферии. Накоплены данные, подтверждающие эффективность ибупрофена в рецептурных и безрецептурных дозах в отношении стандартных показателей боли, сопровождающей воспаление. Еще важнее, что пациенты сами говорят нам об эффективности. Это подтверждается более чем 40-летним опытом применения данного препарата более чем в 90 странах мира.

— ЧТО ИЗВЕСТНО ОБ ЭФФЕКТИВНОСТИ ИБУПРОФЕНА ПО СРАВНЕНИЮ С ДРУГИМИ ПРОТИВОВОСПАЛИТЕЛЬНЫМИ/ОБЕЗБОЛИВАЮЩИМИ СРЕДСТВАМИ?

— В последние годы внимание большого числа мегаисследований было сфокусировано на клиническом применении более нового класса НПВС — коксибов, а также других традиционных НПВС (диклофенак-натрий, напроксен и др.). Во многих из этих исследований ибупрофен в рецептурных дозах использовался в качестве препарата сравнения, учитывая его хорошо подтвержденный профиль безопасности и эффективности. В этих исследованиях было показано, что безопасность и эффективность ибупрофена сравнима с таковой у более новых НПВС, особенно при длительном применении (более 6 месяцев).

При боли легкой и умеренной степени тяжести ибупрофен часто был эффективнее парацетамола и как анальгетик, и как антипиретик.

«В течение 5 лет после открытия ибупрофена появились и начали использоваться много новых нестероидных противовоспалительных средств (НПВС). «Соревнование» с новыми препаратами протекало достаточно интенсивно. Заслуживает внимания тот факт, что ибупрофен выдержал это «соревнование» и подтвердил свое место в качестве предпочитаемого НПВС, будучи достойным препаратом первого выбора для уменьшения выраженности боли легкой и умеренной степени тяжести», — отметил профессор Ким Рейнсфорд

— ЧТО ВЫ ДУМАЕТЕ О ПРОФИЛЕ БЕЗОПАСНОСТИ ИБУПРОФЕНА?

— Как отмечалось выше, доктор С. Адамс придерживался мнения, что переносимость препарата важнее его силы. Этот принцип сыграл для ибупрофена определяющую роль.

У ибупрофена высокий токсикологический барьер. Следовательно, препарат можно принимать в больших, нежели стандартно рекомендуется, дозах без каких-либо серьезных побочных эффектов и, что важно, без необратимых влияний на печень, как это случается при приеме парацетамола и диклофенака. Именно высокий профиль безопасности стал причиной того, что ибупрофен стал одним из первых рецептурных средств, которые были расценены как относительно безопасные для безрецептурного применения. Вследствие этого препарат стал широко применяться во всем мире. Нельзя сказать, что у ибупрофена нет побочных эффектов, но они встречаются реже по сравнению с таковыми у других обезболивающих средств.

— НАСКОЛЬКО ПРОФИЛЬ БЕЗОПАСНОСТИ ИБУПРОФЕНА СРАВНИМ С ТАКОВЫМ У ДРУГИХ ОБЕЗБОЛИВАЮЩИХ СРЕДСТВ?

— Накоплены данные, подтверждающие относительную безопасность применения ибупрофена как в рецептурных (2400 мг/день), так и безрецептурных (1200 мг/день) дозах. Именно по этой причине молекула ибупрофена «пережила вызов» со стороны появившихся позже парацетамола и коксибов.

На сегодняшний день накоплено большое количество данных, свидетельствующих о том, что при назначении рецептурных доз ибупрофена частота побочных эффектов со стороны пищеварительного тракта является одной из самых низких среди хорошо изученных НПВС (таких как напроксен, диклофенак, пироксикам и др.). А при назначении безрецептурных доз риск относительно низкий и сравним с парацетамолом. При назначении безрецептурных



доз ибупрофена также относительно мала вероятность развития почечных или сердечно-сосудистых осложнений.

Если сравнивать ибупрофен с парацетамолом, то в безрецептурных дозах ибупрофен имеет аналогичный профиль безопасности в отношении желудочно-кишечного тракта, за исключением одного важного преимущества: в безрецептурных дозах ибупрофен не увеличивает риск повреждения печени (особенно необратимого, наблюдаемого при приеме парацетамола, и иногда встречающихся реакций при приеме аспирина).

Применение ибупрофена в педиатрической практике показало, что препарат относительно безопасен, особенно по сравнению с парацетамолом. Он эффективен при лечении острой боли и лихорадки. В одном из последних клинических исследований применения антипиретиков у детей было показано, что между ибупрофеном и парацетамолом нет существенных различий по безопасности

Профессор К. Рейнсфорд: карьеря и ибупрофен



Профессор Ким Друммонд Рейнсфорд в течение сорока лет занимался научными исследованиями. Работал в шести странах мира на четырех континентах. Был организатором большого количества научно-исследовательских групп, занимающихся фармакологией воспалительных заболеваний. С 1992 г. до выхода в отставку в марте 2006 г. профессор Рейнсфорд был заведующим кафедрой биомедицинских наук и директором биомедицинского научно-исследовательского центра университета Шеффилд Халлам, г. Шеффилд, Великобритания. Научные интересы профессора Рейнсфорда сводятся главным образом к изучению воспаления, механизмов действия и побочных эффектов НПВС. Им было опубликовано более 180 оригинальных исследований, 25 монографий и более 200 обзоров. Он является также одним из основных консультантов международных биофармацевтических компаний. Второе издание исчерпывающей монографии профессора Рейнсфорда по ибупрофену готовится к публикации в 2012 г.


и эффективности при их назначении в целом здоровым необезвоженным детям с лихорадкой. Также было выявлено, что для ибупрофена характерно более длительное антипиретическое действие в отношении снижения повышенной температуры по сравнению с парацетамолом и более быстрое начало действия. При частом использовании анальгетиков всегда есть опасность повреждения почек, особенно у детей. Однако исследования показывают, ибупрофен имеет такой же профиль безопасности и эффективности, как и парацетамол.

— УЧИТЫВАЯ НИЗКУЮ ТОКСИЧНОСТЬ, ЭФФЕКТИВНОСТЬ И БЫСТРОЕ НАЧАЛО ДЕЙСТВИЯ, ДОЛЖЕН ЛИ ИБУПРОФЕН РАССМАТРИВАТЬСЯ КАК ОБЕЗБОЛИВАЮЩЕЕ СРЕДСТВО ПЕРВОГО ВЫБОРА?

— Как безрецептурное средство парацетамол используется около 30 лет в большинстве стран Европы и Северной Америки. Он, как ибупрофен, сначала был рецептурным препаратом. Парацетамол также имеет относительно хорошую репутацию. Однако в последние годы было обнаружено, что высокие дозы парацетамола вызывают побочные эффекты со стороны желудочно-кишечного тракта, особенно при комбинации с высокими дозами других НПВС при лечении ревматической боли. С моей точки зрения, положение о том, что парацетамол не вызывает осложнений со стороны желудка, требует дальнейшего уточнения.

— КАКОВО БУДУЩЕЕ ИБУПРОФЕНА?

С учетом вышесказанного я полагаю, что будущее за модернизацией лекарственных форм, доз и способов применения ибупрофена. Будут разработаны формы для более быстрого действия и, наоборот, с пролонгированным высвобождением. Это повысит эффективность и упростит способ приема. Я уверен, что усилия исследователей будут направлены на улучшение механизмов доставки местно действующих форм. Необходимо помнить, что боль является маркером воспаления. Противовоспалительное действие ибупрофена расширяет диапазон потенциальных показаний для его безрецептурного применения.



За 50 лет ибупрофен стал всемирно известным и широко используемым препаратом. Его бренд Нурофен® отличается высоким качеством, он получил всеобщее признание. Ибупрофен — прекрасное средство, которое выпускается в различных лекарственных формах для местного и системного применения

В настоящее время ибупрофен становится препаратом потенциального применения при ряде состояний, не упомянутых в инструкции, например, у недоношенных детей и/или новорожденных с низким весом. Растет количество данных о возможной роли ибупрофена как профилактического средства для предупреждения катаракты, болезней Альцгеймера и Паркинсона, для лечения колоректального рака. Однако для того чтобы обосновать целесообразность применения ибупрофена при всех перечисленных показаниях, необходимо проводить глубокие фундаментальные и более длительные клинические исследования.

ЛИТЕРАТУРА ДЛЯ ДАЛЬНЕЙШЕГО ЧТЕНИЯ
 Rainsford K.D. Fifty years since the discovery of ibuprofen// *Inflammopharmacol.* — 2011. — V. 19. — P. 293–297.
 Rainsford K.D. Ibuprofen: pharmacology, efficacy and safety// *Inflammopharmacol.* — 2009. — V. 17. — P. 275–342.

P.C. № UA/6313/02/02 от 26.06.2007; UA/6313/02/02 от 26.06.2007;
 UA/6313/02/02 от 26.06.2007; UA/6313/02/01 от 17.03.2009;
 UA/6313/01/01 от 23.06.2010