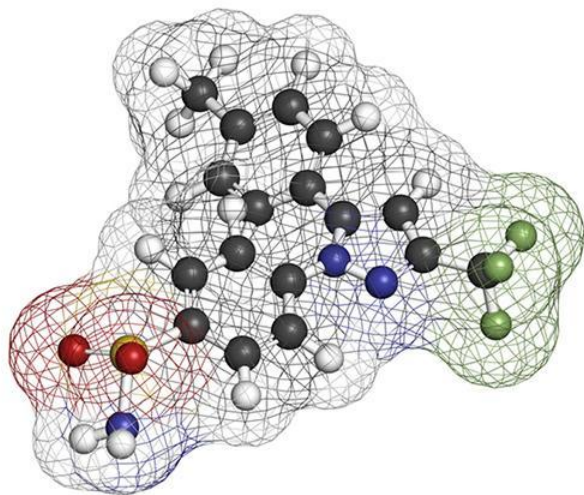




Южно-Казахстанская государственная
фармацевтическая академия

Кафедра фармакологии, фармакотерапии и
клинической фармакологии

Применение коксибов в клинической практике



Выполнила: Касымова Д..
Научный руководитель: Абуова Г.Т.

Шымкент 2016

Введение

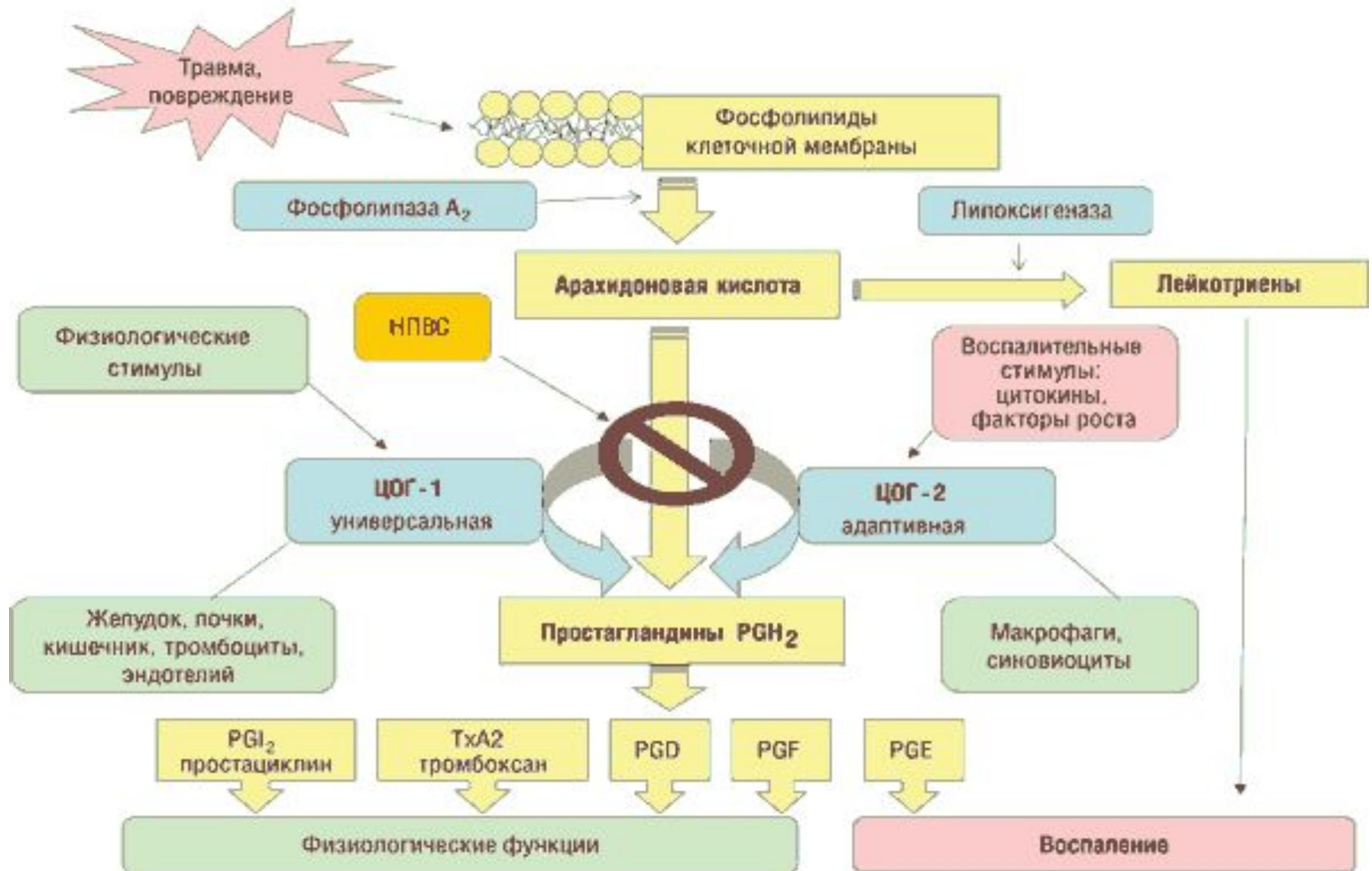
Коксибы - нестероидные противовоспалительные препараты, (*высокоселективные или специфические ингибиторы ЦОГ-2*)

Нестероидные противовоспалительные препараты (НПВП), благодаря их противовоспалительной, анальгетической и жаропонижающей активности, сегодня широко используются в терапии различных патологий, включая ревматические заболевания, лихорадки различного происхождения, хронические бурситы и тендовагиниты, травмы опорно-двигательного аппарата, ортопедические манипуляции, периодонтиты и др.

Фактором, лимитирующим использование НПВП

- высокая частота побочных эффектов даже при кратковременном или ситуативном их применении;
- применяются длительно в амбулаторном режиме;
- широко используются для самолечения

МЕХАНИЗМ ДЕЙСТВИЯ НПВП КОКСИБОВ



ЭВОЛЮЦИЯ НПВП:

от неселективных к специфическим ингибиторам ЦОГ-2

- ✓ селективные ингибиторы ЦОГ-2 (мелоксикам, нимесулид, набуметон);
- ✓ специфические ингибиторы ЦОГ-2 (коксибы: целекоксиб, рофекоксиб, вальдекоксиб, эторикоксиб, лумиракоксиб);
- ✓ селективные ингибиторы ЦОГ-1 (низкие дозы ацетилсалициловой кислоты)

Первые представители коксибов



Рофекоксиб

- Рофекоксиб — специфический ингибитор ЦОГ-2, обладает самым высоким показателем коэффициента— 0,004, что объясняется особенностями стереометрической структуры его молекулы способной проникать внутрь гидрофильной боковой полости молекулы ЦОГ-2 и тем самым неконкурентно блокировать активный центр этого изофермента



Показания к применению

Рофекоксиб назначается при следующих нарушениях ОДА:

- ☐ Ревматоидный артрит
- ☐ хронический периартрит;
- ☐ бурсит;
- ☐ тендинит;
- ☐ травмы связок, сухожилий и мышц.

Не менее эффективен препарат в случае возникновения различных болевых симптомов:

- ☐ остеохондроз;
- ☐ невралгия;
- ☐ неврит;
- ☐ люмбаго;
- ☐ зубная боль;
- ☐ корешковый синдром;
- ☐ пульпиты;
- ☐ миалгия.



РОФЕКОКСИБ ОБЛАДАЕТ СЛЕДУЮЩИМИ СВОЙСТВАМИ:

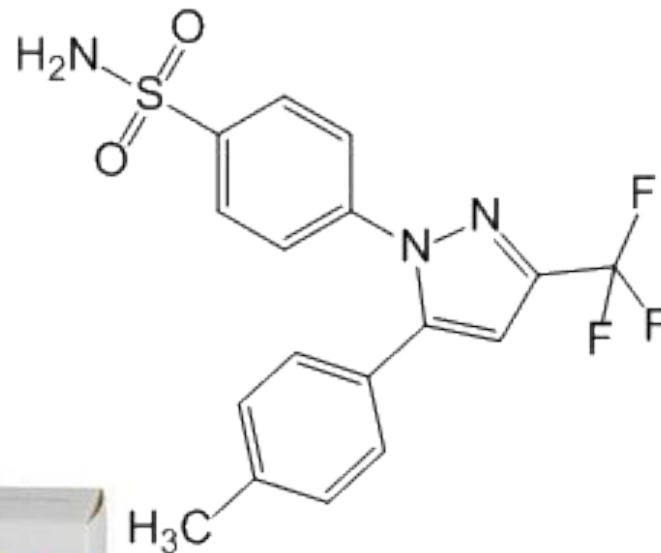
- — снижает интенсивность болевого синдрома при остеоартрозе и заболеваниях опорно-двигательной системы;
 - уменьшает отечность суставов;
 - обладает хондронейтральным действием;
 - имеет высокий профиль безопасности со стороны ЖКТ;
 - возможность безопасного приема в течение 6–12 мес.;
- проявление НПВП-гастропатий в результате приема рофекоксиба в течение 6 мес. составило 0,01 % на 100 пациентов в год (сопоставимо с таковым у лиц, не принимающих НПВП);
- возможность безопасного применения со стороны сердечно-сосудистой системы в течение 6–12 мес. в дозе 25 мг;
 - не изменяет функцию тромбоцитов;
 - пролонгированное действие — прием 1 раз/сут

Побочные эффекты

- Из побочных эффектов при приеме рофекоксиба наиболее вероятны (частота около 2%) изжога, дискомфорт в эпигастральной области, тошнота, диарея, артериальная гипертензия, отеки нижних конечностей, усиление симптомов застойной сердечной недостаточности; около 1% — повышение активности трансаминаз, рвота.
- Рофекоксиб способен повышать концентрацию метотрексата в плазме крови (в среднем на 23%). При одновременном применении рофекоксиба с антикоагулянтами возможно повышение протромбинового времени. Рифампицин, рифамицин снижают концентрацию рофекоксиба в плазме крови на 50%.

Целекоксиб

- Показаниями для назначения Целекоксиба являются:
- ревматоидный артрит;
- *анкилозирующий спондилоартрит*;
- остеоартроз;
- *сориатический артрит*.



Побочные эффекты

- Боль в животе, диарея, диспептические явления (метеоризм, тошнота), головокружение, головная боль, бессонница, воспалительные процессы верхних отделов дыхательных путей, кожный зуд, сыпь, периферические отеки.
- К нечастым (0,1–1%) — анемия, гипертензия, тахикардия, запор, отрыжка, гастрит, стоматит, рвота, повышение активности aminотрансфераз, нарушение функции печени, инфекции мочевых путей, нечеткость зрения, парестезии, депрессия, судороги, шум в ушах, повышенная утомляемость, кашель, одышка, крапивница.



Фармакокинетический профиль целекоксиба и рофекоксиба

Показатели	Целекоксиб	Рофекоксиб
Биодоступность при приеме внутрь, %	75	93
Связывание с белками плазмы крови, %	97	85
Tmax, ч	2–3	2–3
Период полувыведения, ч	10–12	17

Общепризнанными показаниями к применению коксибов в настоящее время являются остеоартрит и ревматоидный артрит. Улучшение качества жизни и физической активности пациентов с данной патологией при применении коксибов сопоставимо с эффектом таких широко применяемых НПВП, как напроксен и диклофенак, но при этом коксибы значительно превосходят указанные препараты по безопасности. Существенных отличий по клинической эффективности между целекоксибом и рофекоксибом не выявлено

Клиническое применение коксибов

Применение коксибов для послеоперационного обезболивания

- не отличается по эффективности от послеоперационного обезболивания
- снижение интенсивности послеоперационной боли
- селективных ингибиторов ЦОГ-2 позволяет сократить потребление морфина в среднем на 10 мг в сутки по сравнению с плацебо
- парекоксиб в комбинации с морфином на отдельных этапах превосходит комбинацию кеторолака с морфином по эффективности

- Препараты группы коксибов можно рассматривать как эффективное средство для лечения послеоперационной боли с доказанным анальгетическим и опиоидсберегающим эффектом. в составе мультимодальной анальгезии препараты этой группы могут улучшить качество обезболивания больных



Заключение

Таким образом, появление коксибов хотя и не совершило революции в современной ревматологии, тем не менее позволило значительно повысить безопасность фармакотерапии хронического воспалительного процесса и боли.

Продолжающиеся активные исследования по созданию новых коксибов и постоянно расширяющиеся показания к их применению свидетельствуют о том, что потенциальные возможности нового класса НПВП еще далеко не исчерпаны.

СПАСИБО
ЗА
ВНИМАНИЕ !

