

MUDr. Pavel Kostiuik, CSc.
 Edukafarm, Praha

Akutní bolest nás obvykle informuje o možném nebezpečí pro náš organismus. Vedle odstranění vyvolávající příčiny jsme však často nuceni bolest tlumit, neboť její podcenění negativně ovlivňuje řadu orgánových systémů a v konečném důsledku může vést i k přeměně akutní bolesti v bolest chronickou. Z těchto předpokladů vyplývá, že optimální analgetikum by nemocnému mělo poskytnout co možná nejrychlejší, účinnou úlevu od bolesti a současně by mělo být prosto nežádoucích účinků či potenciálu lékových interakcí. V širším kontextu stávající lékové politiky je třeba zdůraznit i požadavek na jeho nízkou cenu.

Ibuprofen lysinát v léčbě bolesti

Pacient má v současné době v rámci samoléčby na výběr mezi analgetiky/antipyretiky a nesteroidními antiflogistiky (NSA). Aktuální portfolio přípravků z těchto skupin zahrnuje různé lékové formy s obsahem těžce účinné látky, anebo účinná látka může být určitým způsobem modifikována, a to tak, aby co možná nejdříve bylo dosaženo odpovídajícího stupně analgezie. V běžné praxi je tak pro perorální aplikaci velmi často využívána forma suspenzí či effervescentních tablet apod., ve druhém případě jsou preferovány optické izomery (dexibuprofen, dexketoprofen aj.), soli účinných látek (ibuprofen lysinát či arginát), kombinace s cyklodextrinem (piroxicam beta-cyklodextrin) nebo také kombinace s jinou účinnou látkou, jako je např. guaifenesin – myorelaxans s anxiolytickými a expektoračními účinky. Ve volném prodeji jsou však i přípravky kombinující NSA s paracetamolem.

Třebaže mechanismus účinku nesteroidních antiflogistik byl v podstatě popsán již v 70. letech minulého století, dodnes zůstává předmětem debat např. u pyrazolonů. Základní mechanismus působení NSA spočívá v blokádě katalytické aktivity enzymů cyklooxygenáz (COX) 1 a 2, čímž se zabrání tvorbě prostaglandinů, které se uplatňují jako důležité modulatory bolesti. Dnes je známo, že každý druh bolesti je provázen více či méně zvýšenou expresí nejen COX-2, jak se předpokládalo v 80. a 90. letech, ale že v některých případech se zvyšuje i aktivita COX-1. Je tedy zřejmé, že není dost dobře možné upřednostňovat pouze specifické inhibitory COX-2, koxiby, na úkor nese-

lektivních NSA. Úloha COX-2 je přitom dominantní u zánětu, COX-1 např. u pooperační či neuropatické bolesti.

Využití neselektivních NSA přináší i riziko nežádoucích účinků, ze kterých je nejčastěji zmiňováno riziko gastrototoxicity. I v rámci této podskupiny je nejnižší pravděpodobnost těchto nežádoucích účinků vlastní již výše zmíněným pyrazolonům nebo ibuprofenu, což bylo opakovaně potvrzeno v řadě klinických studií či metaanalýz.¹

Ibuprofen je jako derivát kyseliny propionové využíván v léčbě mírné až středně silné bolesti či horečky, a to i u dětí (společně s paracetamolem je doporučován jako antipyretikum volby u dětí). Nově se na český farmaceutický trh dostává ve formě ibuprofen lysinátu. Navázaný aminokyselinový zbytek

vede u ibuprofen lysinátu k lepšímu vstřebání z trávicího ústrojí, a přispívá tak k dosažení vyšších plazmatických koncentrací oproti klasické ibuprofenové tabletě. Významné je však rovněž rychlejší dosažení plazmatických koncentrací, což je předpokladem pro dosažení rychlejší úlevy od bolesti.^{2,3}

První zkušenosti s touto formou ibuprofenu se datují již do konce 80. let, kdy byl úspěšně porovnáván s diklofenakem u osob s revmatoidní artritidou. V novější klinické studii byl ibuprofen lysinát porovnáván s analgeticky účinnou dávkou paracetamolu (1 g) u osob se středně závažnou až intenzivní bolestí zubů. V souboru celkem 240 osob sice obě léčiva vedla oproti placebu k signifikantní úlevě od bolesti, avšak ibuprofen se vyznačoval výrazně rychlejším nástupem účinku a obecně i celkově vyšší analgetickou odpovědí.⁴ Účinný byl také u pooperační bolesti, kdy poskytoval pacientům úlevu od bolesti do 20 minut.⁵

Ibuprofen lysinát, jehož účinnost byla prověřena v uvedených klinických studiích, představuje vítané rozšíření nabídky analgetických léčiv na českém farmaceutickém trhu.



Literatura

1. Henry D, Lim LL, Garcia Rodriguez LA, et al. Variability in risk of gastrointestinal complications with individual non-steroidal anti-inflammatory drugs: results of a collaborative meta-analysis. *Br Med J* 1996; 312:1563–1566.
2. Geisslinger G, Dietzel K, Bezler H, et al. Therapeutically relevant differences in the pharmacokinetic and pharmaceutical behavior of ibuprofen lysinate as compared to ibuprofen acid. *Int J Clin Pharmacol Ther Toxicol* 1989;27:324–328.
3. Martin W, Koselowske G, Toberich H, et al. Pharmacokinetics and absolute bioavailability of ibuprofen after oral administration of ibuprofen lysine in man. *Biopharm Drug Dispos* 1990;11:265–278.
4. Mehlich DR, Jasper RD, Brown P, et al. Comparative study of ibuprofen lysine and acetaminophen in patients with postoperative dental pain. *Clin Ther* 1995;17:852–860.
5. Voigt W. Postoperative monitoring of pain under ibuprofen lysinate. *Dtsch Zahnarzt Z* 1990;45:38–40.