

DOI: 10.32364/2225-2282-2025-*0

Локсопрофен — новая молекула нестероидных противовоспалительных препаратов на российском рынке

К.м.н. Г.Ю. Кнорринг

ФГБОУ ВО «Российский университет медицины» Минздрава России, Москва

РЕЗЮМЕ

В обзоре представлены сведения по фармакодинамике, фармакокинетике и клинической фармакологии нового для российского рынка нестероидного противовоспалительного препарата (НПВП) — локсопрофена. Рассмотрены данные публикаций и результаты экспериментальных исследований фармакологической активности локсопрофена. Представлены результаты исследований, в которых сравнивалась эффективность локсопрофена и других НПВП в качестве жаропонижающего средства при острых инфекциях верхних дыхательных путей, обезболивающего средства при заболеваниях опорно-двигательной системы. Особо отмечен приемлемый уровень безопасности локсопрофена, прежде всего, со стороны желудочно-кишечного тракта и сердечно-сосудистой системы, позволяющий использовать препарат у коморбидных пациентов.

Ключевые слова: нестероидные противовоспалительные препараты, НПВП, острые респираторные вирусные инфекции, ОРВИ, локсопрофен, производные пропионовой кислоты.

Для цитирования: Кнорринг Г.Ю. Локсопрофен — новая молекула нестероидных противовоспалительных препаратов на российском рынке. РМЖ. 2025;*:1–7. DOI: 10.32364/2225-2282-2025-*0

ABSTRACT

Loxoprofen — a new molecule of nonsteroidal anti-inflammatory drugs on the Russian market

G.Yu. Knorring

Russian University of Medicine, Moscow

The review presents data on the pharmacodynamics, pharmacokinetics, and clinical pharmacology of a novel nonsteroidal anti-inflammatory drug (NSAID) for the Russian market — loxoprofen. The review also summarizes information from published articles and results of experimental studies on the pharmacological activity of loxoprofen. Results of studies comparing the loxoprofen efficacy with other NSAIDs as an antipyretic agent in acute upper respiratory tract infections and as an analgesic in musculoskeletal disorders are discussed. Special attention is given to the acceptable safety profile of loxoprofen, particularly with respect to gastrointestinal and cardiovascular systems, which permits its use in patients with comorbidities.

Keywords: nonsteroidal anti-inflammatory drugs, NSAIDs, acute respiratory viral infections, ARVI, loxoprofen, propionic acid derivatives.

For citation: Knorring G.Yu. Loxoprofen — a new molecule of nonsteroidal anti-inflammatory drugs on the Russian market. RMJ. 2025;*:1–7. DOI: 10.32364/2225-2282-2025-*0

ВВЕДЕНИЕ

Локсопрофен — нестероидный противовоспалительный и анальгетический препарат, относящийся к ряду производных фенилпропионовой кислоты, в числе которых ибупрофен, напроксен, флуорбифен, кетопрофен, декскетопрофен и др. Данная группа известна и востребована благодаря высокой обезболивающей и жаропонижающей активности в сочетании с достаточным уровнем безопасности (особенно в плане сердечно-сосудистых рисков), наиболее широко применяется для купирования лихорадочного синдрома.

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛОКСОПРОФЕНА

Локсопрофен является производством (производным пропионовой кислоты), в результате метаболизма обретает активные фармакологические свойства: противовоспалительное, обезболивающее и жаропонижающее [1]. Показано, что активный метаболит (локсопрофен-транс-метаболит) *in vitro* ингибировал рекомбинантные человеческие

циклооксигеназу (ЦОГ) 1 и ЦОГ-2, тогда как локсопрофен практически неактивен против ЦОГ [2]. Анализ цельной крови человека также показал, что локсопрофен-SRS обладает профилем неселективного ингибитора ЦОГ. На животных моделях (крысы) пероральное введение локсопрофена снижало уровень простагландинов Е2 (PGE2) как в воспалительном экссудате, так и в ткани желудка со значениями медианной эффективной дозы (ED_{50}) 2,0 и 2,1 мг/кг соответственно. Кроме того, продукция тромбоксана В2 тромбоцитов также ингибировалась локсопрофеном (ED_{50} 0,34 мг/кг). При вызванном каррагинаном отеке лапы у крыс локсопрофен дозозависимо уменьшал отек, что сопровождалось снижением содержания PGE2 в воспалительном экссудате. Эти результаты свидетельствуют о том, что ингибирующая активность локсопрофена обусловлена его активным метаболитом (локсопрофен-транс-метаболит), демонстрирующим неселективное ингибирование ЦОГ [2].

В испытаниях на животных было подтверждено, что локсопрофен обладает аналогичным или более высоким противовоспалительным и обезболивающим действием,

Таблица 1. Ингибирующее действие НПВП на гипертермию у морских свинок [3]

Лекарственный препарат	Доза приема, мг/кг	п	Разница температуры тела (°С) через 1 и 2 ч после приема, M±SE	Коэффициент ингибирования, %	ID ₅₀ , мг/кг (95% ДИ)
Локсопрофен	0	15	1,31±0,09	—	0,76 (0,44-1,3)
	0,25	10	0,97±0,18	26,0	
	0,76	10	0,59±0,07	55,0	
	2,3	10	0,38±0,09	71,0	
Индометацин	0	15	1,36±0,09	—	9,5 (6,7-13,4)
	2,1	10	1,17±0,10	14,0	
	6,3	10	0,81±0,08	40,4	
	19	10	0,46±0,08	66,2	
Кетопрофен	0	14	1,49±0,08	—	1,5 (1,2-1,9)
	0,7	10	1,09±0,06	26,9	
	2,1	10	0,48±0,06	67,8	
	6,3	10	0,29±0,07	80,5	
Напроксен	0	14	1,55±0,07	—	1,0 (0,6-1,6)
	0,4	10	1,02±0,11	34,2	
	1,2	10	0,72±0,13	53,5	
	3,7	10	0,40±0,08	74,2	

Примечание. ID₅₀ — медианная ингибирующая доза.

чем другие нестероидные противовоспалительные препараты (НПВП) (индометацин, кетопрофен и др.); в частности, его жаропонижающее действие примерно в 10 раз превышает действие индометацина и в 2 раза — кетопрофена (табл. 1.).

Медианная эффективная доза локсопрофена при пероральном введении крысам составила 0,13 мг/кг в teste измерения болевой чувствительности по методу Рэндалла — Селитто (механическое давление на лапу). По обезболивающему эффекту локсопрофен в 10–20 раз превышал кетопрофен, напроксен и индометацин (табл. 2) [3].

В teste термической гипералгезии при воспалении ID₅₀ локсопрофена при пероральном введении крысам составила 0,76 мг/кг, что указывало на его анальгетическую активность, эквивалентную таковому напроксена, и в 3–5 раз более высокую, чем у кетопрофена и индометацина [3]. Кроме того, на модели хронического артрита у крыс он проявлял сильное анальгетическое действие (ED₅₀ 0,53 мг/кг). Эффект локсопрофена в 4–6 раз превысил обезболивающее действие индометацина, кетопрофена и напроксена [3].

При пероральном введении крысам локсопрофен демонстрировал противовоспалительное действие, практически эквивалентное таковому кетопрофена и напроксена, на моделях каррагинанового отека лапы (модель острого воспаления) и адьювантного артрита (модель хронического воспаления), а также обладал жаропонижающим действием, практически эквивалентным таковому кетопрофена и напроксена, и в 3 раза более высоким, чем у индометацина, на модели лихорадки, индуцированной дрожжами [3].

ФАРМАКОКИНЕТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

Абсорбция. В исследовании с участием 16 здоровых добровольцев-мужчин после однократного приема внутрь локсопрофена в дозе 60 мг проводился забор крови через 0, 0,25, 0,5, 1, 1,5, 2, 4 и 6 ч. Локсопрофен быстро абсорбировался и обнаруживался в крови в неизмененном виде, а также в форме транс-ОН метаболита (активный метаболит). Время достижения максимальной плазменной концентра-

Таблица 2. Аналгетический эффект локсопрофена и референтных препаратов у крыс (метод Рэндалла — Селитто) [3]

Лекарственный препарат	Доза, мг/кг	п	Доля животных с эффективным купированием боли на момент пикового эффекта, %	ED ₅₀ , мг/кг (95% ДИ)
Локсопрофен	0,05	10	0	0,13 (0,05-0,33)
	0,1	10	40	
	0,5	10	90	
	1,0	10	100	
Индометацин	1,0	10	20	2,8 (0,9-8,0)
	5,0	10	80	
	10,0	10	80	
Кетопрофен	0,3	10	20	1,3 (0,5-3,4)
	1,0	10	50	
	3,0	10	70	
	10,0	10	80	
Напроксен	1,0	10	30	2,6 (1,2-5,6)
	3,0	10	50	
	10,0	10	80	

ции составило приблизительно 30 мин для локсопрофена и 50 мин для его транс-ОН метаболита, при этом период полувыведения из плазмы крови для обеих форм составил в среднем 1 ч 15 мин (рис. 1) [4].

Фармакокинетические параметры локсопрофена и его транс-ОН метаболита после однократного приема лекарственного препарата внутрь в дозе 60 мг представлены в таблице 3 [4].

В исследовании с участием 5 здоровых добровольцев-мужчин после многократного приема внутрь локсопрофена в дозе 80 мг 3 р/сут в течение 5 дней не наблюдалось существенных различий плазменных концентраций со значениями, полученными после однократного приема, а также не наблюдалось кумуляции препарата [4].

Таблица 3. Фармакокинетические параметры локсопрофена и его транс-ОН метаболита [4]

Молекула	C_{max} , мкг/мл	t_{max} , ч	$t_{1/2}$, ч	AUC, мкг · ч/мл	Константа скорости абсорбции, ч ⁻¹	Константа скорости элиминации, ч ⁻¹
Локсопрофен	5,04±0,27	0,45±0,03	1,22±0,07	6,70±0,26	11,21±1,82	$\lambda_1=4,04\pm0,93$ $\lambda_2=0,59\pm0,04$
Транс-ОН метаболит	0,85±0,02	0,79±0,02	1,31±0,05	2,02±0,05	3,56±0,21	$\lambda_1=0,99\pm0,07$ $\lambda_2=0,54\pm0,02$

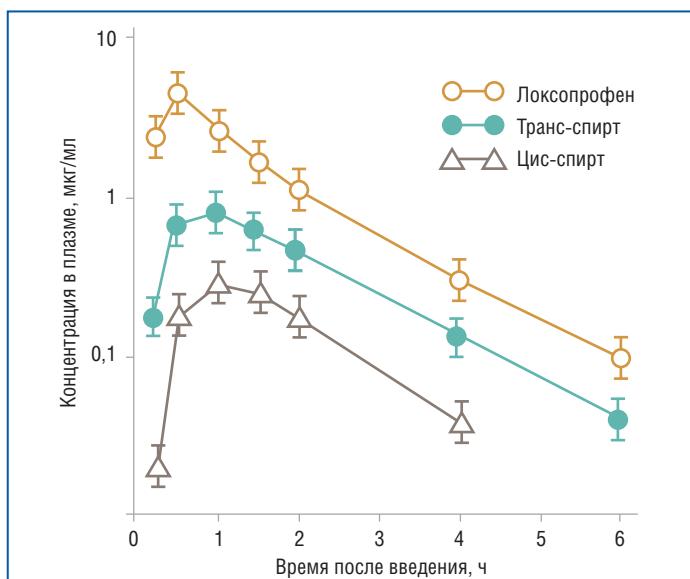


Рис. 1. Динамика концентрации в плазме крови локсопрофена и его метаболитов после однократного перорального приема локсопрофена натрия (60 мг) здоровыми добровольцами [4]

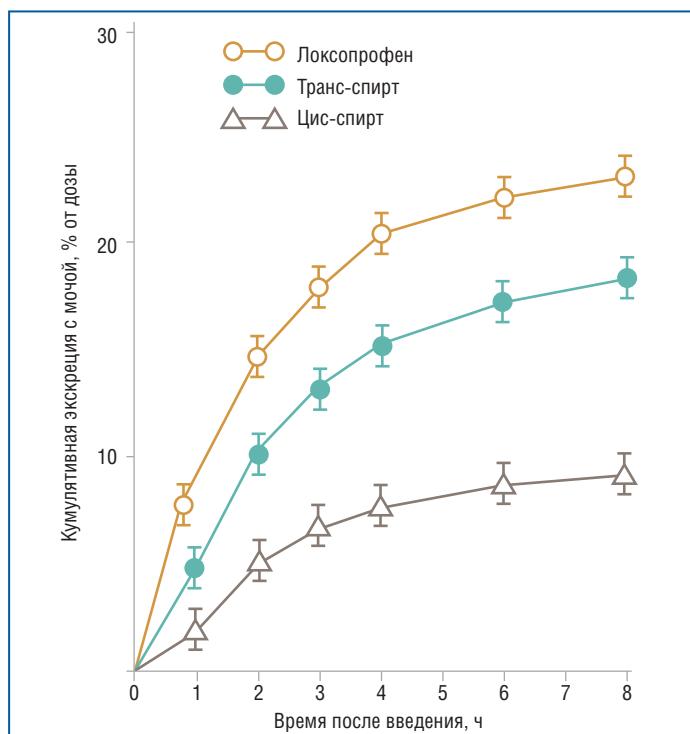


Рис. 2. Кумулятивная экскреция с мочой (свободного и конъюгированного) локсопрофена и его диастереомерных метаболитов после перорального приема локсопрофена натрия 60 мг здоровыми добровольцами [5]

Распределение. Скорость связывания локсопрофена с белками плазмы крови определяли у 5 здоровых добровольцев-мужчин через 1 ч после однократного приема внутрь локсопрофена в дозе 60 мг. Степень связывания локсопрофена и его транс-ОН метаболита с белками плазмы крови составила 97,0 и 92,8% соответственно [4].

Биотрансформация. В *in vitro* исследовании ингибирования метаболизма с использованием микросом печени человека локсопрофен не влиял на метаболизм различных препаратов, являющихся субстратами изоферментов цитохрома P450 (CYP 1A1/2, 2A6, 2B6, 2C8/9, 2C19, 2D6, 2E1 и 3A4), даже в концентрации, приблизительно в 10 раз превышавшей максимальную плазменную концентрацию (200 мкмоль/л) после однократного приема внутрь в дозе 60 мг здоровыми добровольцами-мужчинами. Таким образом, локсопрофен имеет низкие риски межлекарственного взаимодействия, что важно для коморбидных пациентов. Также при метаболизме локсопрофена не образуются токсичные метаболиты, как, например, при трансформации парацетамола (N-ацетил-р-бензохинонимин, обуславливающий риск развития нежелательных явлений (НЯ) в отношении печени) [5].

Элиминация. После однократного приема внутрь локсопрофена в дозе 60 мг 6 здоровыми добровольцами-мужчинами препарат быстро выводился с мочой, и большая часть выведенной с мочой дозы препарата приходилась на глюкуронидные конъюгаты неизмененного локсопрофена и его транс-ОН метаболита (рис. 2) [5].

Результаты сравнительных клинических исследований

Проведен ряд исследований, в которых сравнивали жаропонижающий и противовоспалительный эффекты локсопрофена и других НПВП, также в ряде работ была оценена безопасность локсопрофена.

В сравнительном исследовании [6] оценен жаропонижающий эффект локсопрофена и аспирина. В исследовании участвовало 20 пациентов 15–70 лет с острой инфекцией верхних дыхательных путей (ИВДП) с лихорадкой 37,5 °C и выше. Пациенты были разделены на 3 группы: 1-я группа принимала локсопрофен в дозе 40 мг однократно, 2-я — локсопрофен 60 мг однократно, 3-я — 500 мг аспирина однократно. В 1-й группе достоверное снижение температуры наблюдалось через 1 ч, во 2-й группе — через 30 мин, а в 3-й группе наблюдалась лишь тенденция к снижению температуры только через 1 ч. Кроме того, сравнение групп показало тенденцию к превосходству 2-й группы по сравнению с 1-й группой через 30 мин и через 1 ч, а также достоверное преимущество 2-й группы по сравнению с 3-й группой через 3 ч (рис. 3). Помимо этого, температура снизилась до 37,0 °C или менее к отметке 3 ч у 6 (85,7%) пациентов в 1-й группе, у 9 (100%)

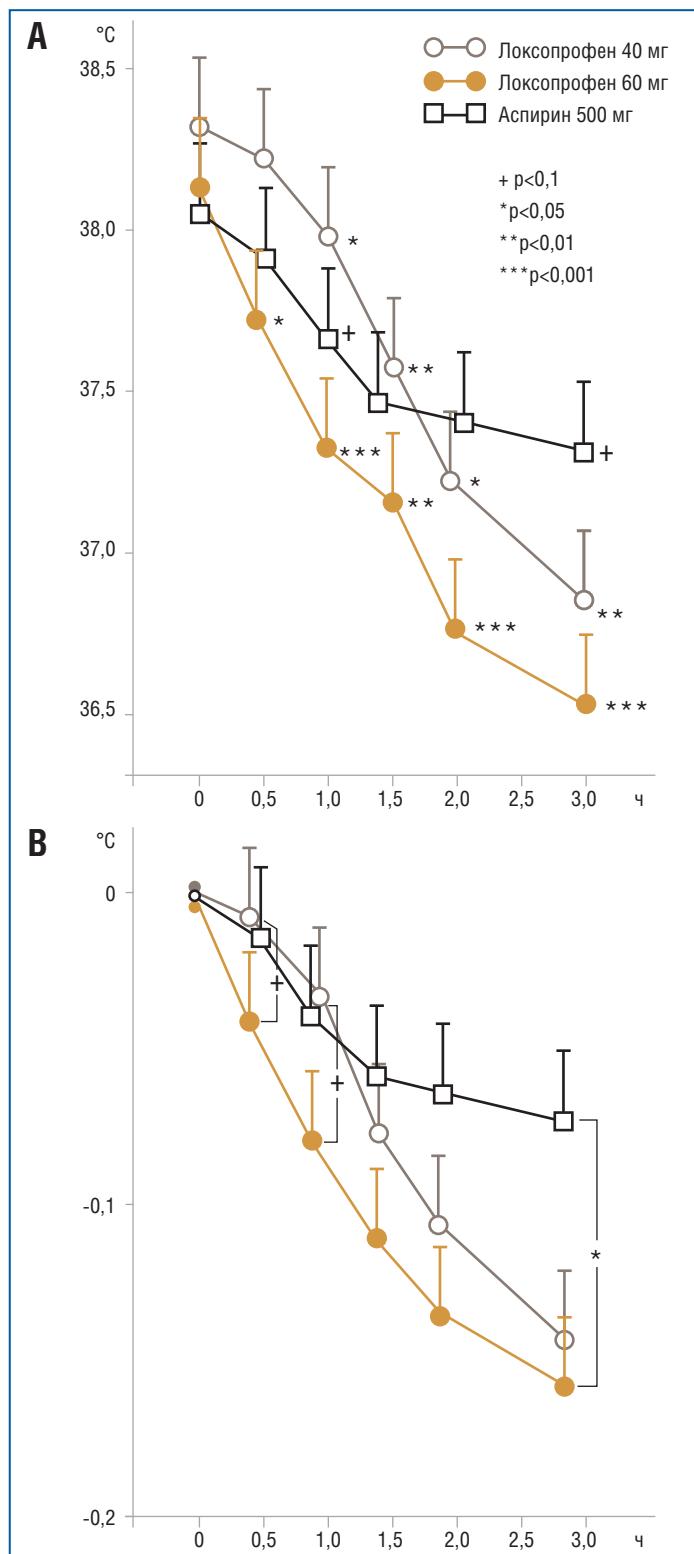


Рис. 3. Изменение температуры тела с течением времени: внутригрупповое (А) и межгрупповое (В) сравнение, $M \pm SE$

пациентов во 2-й группе и лишь у 1 (25,0%) пациента в 3-й группе.

Эти результаты подтверждают, что жаропонижающий эффект у пациентов, принимавших 40 мг и 60 мг локсопрофена, выше, чем в группе, принявшей 500 мг аспири-

на, а также тот факт, что при приеме локсопрофена этот эффект отмечается быстрее, поскольку в некоторых случаях температура снижалась до 37,0 °C или ниже уже через 1 ч после однократного приема [6]. В целом жаропонижающий эффект наблюдался во всех группах, однако сила действия препаратов снижалась в следующем порядке: локсопрофен 60 мг, локсопрофен 40 мг и аспирин 500 мг, причем группа локсопрофена 60 мг показала статистически значимо ($p<0,05$) больший жаропонижающий эффект, чем группа аспирина, особенно через 3 ч.

В двойном слепом сравнительном клиническом исследовании III фазы с участием пациентов с острой ИВДП локсопрофен в дозе 180 мг/сут назначали в течение 5 дней, а в качестве контрольного препарата применяли ибупрофен в дозе 600 мг/сут. У 76,5% (62/81) пациентов, получавших локсопрофен, наблюдалось итоговое общее улучшение или более выраженное улучшение, а у 90,1% (73/81) — незначительное или более выраженное улучшение¹.

В другом двойном слепом сравнительном клиническом исследовании III фазы также у пациентов с острой ИВДП в течение 3 дней назначали локсопрофен в дозе 180 мг/сут или ибупрофен в дозе 600 мг/сут (контрольный препарат). На фоне применения локсопрофена у 61,6% (69/112) пациентов наблюдали общее улучшение или более выраженное улучшение, а у 85,7% (96/112) — незначительное или несколько более выраженное улучшение. У 6,2% (8/130) пациентов в группе локсопрофена наблюдали НЯ, основными из которых были боль в эпигастрии — у 2,3% (3/130), вздутие живота и сонливость — у 1,5% (2/130).

Результаты двойного слепого сравнительного клинического исследования III фазы у пациентов с острой ИВДП, предусматривавшего однократное применение локсопрофена в дозе 60 или 120 мг/сут, показали, что у 75,8% (25/33) пациентов в группе 60 мг/сут отмечалось улучшение или более выраженное улучшение (с точки зрения жаропонижающего эффекта), у 100% (33/33) — незначительное или более выраженное улучшение. В группе 120 мг/сут улучшение или более выраженное улучшение наблюдали у 75,9% (22/29) обследованных, а незначительное или более выраженное улучшение — у 89,2% (26/29). На основании полученных данных исследователи сделали вывод о том, что оптимальной эффективной дозой для локсопрофена является 60 мг активного вещества, так как кратное увеличение дозы не сопровождается соответствующим ростом эффективности¹.

В исследовании эффективности локсопрофена при ОРВИ приняли участие 664 пациента (366 женщин), средний возраст которых составил 34 ± 12 лет [7]. Препарат применялся в течение как минимум 2 нед. Еженедельно пациентов обследовали с помощью визуальной аналоговой шкалы для определения спонтанной боли и одинофагии (боли при глотании) и шкалы Шахтеля для определения остальных симптомов. Средняя продолжительность заболевания составила $3,6 \pm 4,5$ дня, а средняя продолжительность лечения — $7,9 \pm 2,1$ дня. Оценка тяжести симптомов, проведенная до и после лечения, показала отличную динамику: значительное уменьшение выраженности боли (спонтанной и одиночной) было отмечено в 1-ю неделю лечения и сохранялось на протяжении всей терапии. То же самое наблюдалось и при симптомах по шкале Шахтеля (температура тела, цвет ротоглотки, энантемы, наличие и выраженность аденоидов). Итоговая оценка, про-

¹ Общая характеристика лекарственного препарата Скоролокс, 60 мг, таблетки, ЛП-№006440 от 26.11.2024. (Электронный ресурс.) URL: https://lk.regmed.ru/Register/EAEU_SmPC (дата обращения: 20.04.2025).

веденная исследователями и пациентами, показала улучшение более чем в 94% случаев. Переносимость была отличной, и только 46 (6,9%) пациентов сообщили о НЯ, большинство из которых (75,5%) были умеренной интенсивности. Результаты этого исследования подтверждают, что локсопрофен эффективен и обладает отличной переносимостью в качестве дополнительного средства для лечения ОРВИ при его ежедневном применении.

В сравнительных исследованиях показана хорошая антипищевая и анальгетическая активность локсопрофена и благоприятный профиль безопасности [8]. Локсопрофен хорошо зарекомендовал себя в качестве противовоспалительного и жаропонижающего средства — в ряде работ он используется в качестве референтного препарата [9]. В рамках мультицентрового двойного слепого исследования с активным контролем 181 пациент с ОРВИ и лихорадкой ($\geq 38,0$ °C) получал либо пелубипрофен (n=61), либо локсопрофен (n=69), либо составил группу контроля (n=61). Оба НПВП показали высокий уровень безопасности, сравнимую жаропонижающую активность и были эффективны у 97,5% пациентов [9].

БЕЗОПАСНОСТЬ ЛОКСОПРОФЕНА

Приведенные исследования показали приемлемый уровень безопасности локсопрофена. При цельная оценка безопасности препарата в уязвимой группе коморбидных возрастных пациентов проведена в ходе открытого многоцентрового исследования у 4024 пожилых (средний воз-

раст 72,5 года) пациентов с поясничной болью, связанной с рядом ревматических расстройств [10]. Локсопрофен назначали в дозе 180 мг/сут (60 мг 3 р/сут) в течение 8 нед. Эффективность оценивали объективными и субъективными методами. На 4-й неделе локсопрофен показал субъективное улучшение на 83, 30 и 24% у пациентов с легкой и умеренной, умеренной и сильной поясничной болью соответственно. Объективные и субъективные улучшения были значительными уже после 1-недельной терапии у пациентов с легкой и умеренной болью и через 4 нед. при любой интенсивности боли. Важно подчеркнуть, что частота НЯ в этой большой популяции исследования была крайне низкой (лишь у 2,2% пациентов), в основном они были слабо выраженными и проявлялись в отношении желудочно-кишечного тракта (ЖКТ). Таким образом, локсопрофен является хорошо переносимым НПВП при лечении поясничной боли у пожилых пациентов.

Сходные результаты были показаны и при противовоспалительной терапии гонартроза [11]. Двойное слепое рандомизированное параллельное контролируемое исследование ставило целью сравнить эффективность и безопасность использования локсопрофена и диклофенака при лечении гонартроза. В исследование были включены амбулаторные пациенты с гонартрозом 2-й или 3-й степени по классификации Келлгрена и Лоуренса в возрасте 30–60 лет с индексом массы тела <30 кг/м². Тридцать пациентов получали локсопрофен 60 мг 3 р/сут, а другие 30 пациентов — диклофенак 50 мг 3 р/сут. За 4 нед. терапии зарегистрировали НЯ со стороны ЖКТ у 3 (10%) пациентов

СКОРОЛОКС локсопрофен

Dr. Reddy's

Таблетки, 60мг №10

Для пациентов
с острыми инфекциями
верхних дыхательных
путей

Действует против жара,
боли и воспаления
в очаге инфекции²



СКОРОЛОКС — первый зарегистрированный локсопрофен на рынке РФ¹

1. По данным сайта www.grls.rosminzdrav.ru / Дата обращения: 08.04.2025

2. Общая характеристика лекарственного препарата (ОХЛП) Скоролокс, таблетки, ЛП-№006440 от 26.11.2024

РЕКЛАМА. ООО «Др. Редди с Лабораторис», 115035, г. Москва, Овчинниковская наб., д. 20, стр. 1.

Телефон: +7 495 783 29 01 Имеются противопоказания. Перед назначением ознакомьтесь с инструкцией по медицинскому применению. R1347472-25042025-HCP-SKR

Информация предназначена для медицинских и фармацевтических работников

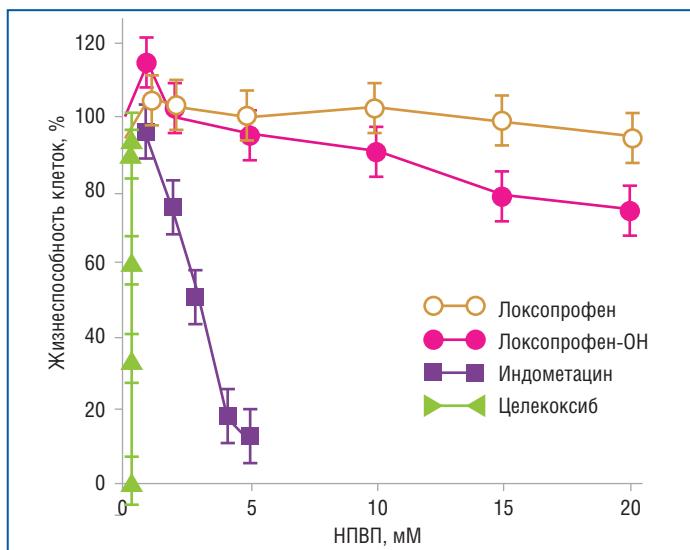


Рис. 4. Некротические проявления, вызванные НПВП, в первичной культуре клеток слизистой оболочки желудка [13]

из группы локсопрофена и у 12 (40%) участников, которые принимали диклофенак ($p<0,01$). Эпигастралгия была наиболее распространенным НЯ (1 случай в группе локсопрофена и 7 — в группе диклофенака). Одно серьезное НЯ, повлекшее прекращение участия в исследовании, — кишечное кровотечение — было зарегистрировано в группе диклофенака. Оценки переносимости были классифицированы как очень хорошие и хорошие у 96,7% в группе локсопрофена и у 79% в группе диклофенака ($p<0,05$). Терапия была прекращена у 1 (3,3%) пациента в группе локсопрофена из-за ухудшения основного заболевания и у 5 (16,7%) пациентов в группе диклофенака — у 4 из-за НЯ и у 1 пациента в связи с несоблюдением режима лечения. В группе локсопрофена исследователи дали общую оценку лечения как очень хорошую или хорошую в 80% случаев, в группе диклофенака — в 70%. Таким образом, использование локсопрофена 60 мг 3 р/сут при лечении гонартроза показало хорошую эффективность, аналогичную полученной при использовании диклофенака, в сочетании с отличной переносимостью и безопасностью, которая была выше, чем у диклофенака [11].

Подобные результаты были получены в работе [12]. В исследовании участвовало 40 пациентов с ОА коленного сустава, разделенных на 2 группы, получавших пероральный локсопрофен 60 мг 3 р/сут или ибупрофен с замедленным высвобождением 300 мг 2 р/сут в течение 4 нед. После 4 нед. лечения все параметры, включая активную боль в колене, время прохождения 15 м, возможности в повседневной жизни и самооценку пациента, значительно улучшились под действием обоих препаратов (ибупрофен и локсопрофен натрия). Но были отмечены более мягкие НЯ при использовании локсопрофена.

Безопасность локсопрофена оценена и в ряде экспериментальных работ, например, показана высокая безопасность локсопрофена по сравнению с индометацином и целекоксивом на модели индуцирования некроза и апоптоза в клетках слизистой оболочки желудка (рис. 4) [13].

Выявлена большая безопасность локсопрофена по сравнению с индометацином на модели индуцирования ишемии слизистой желудка (вплоть до геморрагических эрозий, которые развивались на фоне применения индометацина,

но не локсопрофена) [14]. A. Yanagawa et al. [15] в исследовании с участием 29 здоровых добровольцев установили, что частота НПВП-ассоциированной гастропатии была статистически значимо ниже при использовании пролекарств, включая локсопрофен натрия, чем на фоне применения диклофенака натрия ($p<0,05$). Следует отметить и благоприятный профиль безопасности всей группы производных производных пропионовой кислоты (ибупрофен, напроксен) в плане сердечно-сосудистых рисков, что, очевидно, будет востребовано при проведении терапии в старшей возрастной группе [16].

В 2024 г. компания «Др. Редди's» впервые зарегистрировала молекулу локсопрофена в России под торговым названием Скоролокс, таблетки 60 мг. Препарат является производным фенилпропионовой кислоты и предназначен для купирования лихорадочного и болевого синдромов при острых ИВДП, включая острую ИВДП с воспалением бронхов (острым бронхитом). Также он применяется в качестве противовоспалительного и обезболивающего средства при воспалительных и дегенеративных заболеваниях опорно-двигательного аппарата, зубной боли и в качестве обезболивающего средства при посттравматическом и послеоперационном болевом синдроме¹.

Выводы

1. Локсопрофен является инновационной молекулой на российском рынке, неселективным ингибитором ЦОГ, обладающим периферическим анальгезирующим, а также противовоспалительным и жаропонижающим действием.
2. В клинических и экспериментальных исследованиях показана сравнимая или большая эффективность локсопрофена по сравнению с эффективностью популярных НПВП (ибупрофен, диклофенак).
3. Локсопрофен является пролекарством, что снижает риски НЯ со стороны ЖКТ по сравнению с рядом других противовоспалительных средств.
4. Локсопрофен в исследовании *in vitro* с использованием микросом печени не влиял на метаболизм различных препаратов, являющихся субстратами изоферментов цитохрома P450, что позволяет говорить о низких рисках межлекарственных взаимодействий локсопрофена.
5. В клинических исследованиях отмечен благоприятный профиль безопасности локсопрофена.
6. Среди зарегистрированных в России НПВП для купирования лихорадочного синдрома преобладают производные пропионовой кислоты, которые также обладают и хорошим профилем переносимости для пациентов с сердечно-сосудистыми рисками.
7. Скоролокс (локсопрофен компании «Др. Редди's») может быть использован в качестве жаропонижающего и обезболивающего средства при острых ИВДП (включая острую ИВДП с острым бронхитом), а также в качестве препарата противовоспалительной терапии при ряде заболеваний опорно-двигательного аппарата, зубной боли.

Источник финансирования: статья подготовлена при поддержке компании ООО «Др. Редди's Лаборатории».

Список литературы Вы можете найти на сайте <http://www.rmj.ru>

Литература

1. Greig S.L., Garnock-Jones K.P. Loxoprofen: A Review in Pain and Inflammation. *Clin Drug Investig.* 2016;36(9):771–781. DOI: 10.1007/s40261-016-0440-9
2. Noguchi M., Kimoto A., Gierse J.K. et al. Enzymologic and pharmacologic profile of loxoprofen sodium and its metabolites. *Biol Pharm Bull.* 2005;28(11):2075–2079. DOI: 10.1248/bpb.28.2075
3. Misaka E., Yamaguchi T., Lizuka Y. et al. Anti-inflammatory, analgesic and antipyretic activities of sodium 2-[4-(2-oxocyclopentan-1-ylmethyl) phenyl] propionate dihydrate (CS-600). *Pharmacometrics.* 1981;21(5):753–771.
4. Naganuma H., Kawahara Y. High-performance liquid chromatographic determination of loxoprofen and its diastereomeric alcohol metabolites in biological fluids by fluorescence labelling with 4-bromomethyl-6,7-methylenedioxycoumarin. *J Chromatogr.* 1990;530(2):387–396. DOI: 10.1016/s0378-4347(00)82341-5
5. Brunz K., Renner B., Tiegs G. Acetaminophen/paracetamol: A history of errors, failures and false decisions. *Eur J Pain.* 2015;19(7):953–965. DOI: 10.1002/ejp.621
6. Akahoshi K., Yamamoto A. Antipyretic effect of the new anti-inflammatory analgesic CS-600 (loxoprofen sodium) — Comparison with aspirin. *Japanese pharmacology and therapeutics.* 1984;12(12):5691–5696 (in Japanese).
7. Marone S., Engelke F. Loxoprofen sodium as a complementary therapy of acute upper respiratory tract infections. A collaborative study. *Revista Brasileira De Medicina.* 2000;58:171–178.
8. Azuma A., Kudoh S., Lederman R. et al. Antipyretic and Analgesic Effects of Zaltoprofen for the Treatment of Acute Upper Respiratory Tract Infection: Verification of a Noninferiority Hypothesis Using Loxoprofen Sodium. *Pharmacology.* 2011;87(3-4):204–213. DOI: 10.1159/000324532
9. Jang A.S., Kim S.H., Lee S.P. et al. The Efficacy and Safety of Pelubiprofen in the Treatment of Acute Upper Respiratory Tract Infection: A Multicenter, Randomized, Double-Blind, Non-Inferiority Phase III Clinical Trial Compared to Loxoprofen. *J Clin Med.* 2025;14:1450. DOI: 10.3390/jcm14051450
10. Aoki T. Effectiveness and Safety of Loxoprofen in Elderly Patients with Lumbar Pain. *Drug Invest.* 1992;4:477–483. DOI: 10.1007/BF03259212
11. Lederman R., Guimaraes S., Verztsman J.F. SAT0054 Clinical efficacy and safety of loxoprofen sodium in the treatment of gonarthrosis. *Ann Rheum Dis.* 2001;60(Suppl 1):A168–9. DOI: 10.1136/annrheumdis-2001.429
12. Shi Y.Q., Han X.H. Clinical observation of loxoprofen sodium in treatment of patients with knee osteoarthritis. *Pharm Care Res.* 2004;4:46–48.
13. Yamakawa N., Suemasu S., Kimoto A. et al. Low direct cytotoxicity of loxoprofen on gastric mucosal cells. *Biol Pharm Bull.* 2010;33(3):398–403. DOI: 10.1248/bpb.33.398-8
14. Kawano S., Tsuji S., Hayashi N. et al. Effects of loxoprofen sodium, a newly synthesized non-steroidal anti-inflammatory drug, and indomethacin on gastric mucosal haemodynamics in the human. *J Gastroenterol Hepatol.* 1995;10(1):81–85. DOI: 10.1111/j.1440-1746.1995.tb01053.x
15. Yanagawa A., Fukumura T., Matsui H. et al. Possible mechanisms of gastroduodenal mucosal damage in volunteers treated with nonsteroidal antiinflammatory drugs — the usefulness of prodrugs. *J Rheumatol.* 1992;19(7):1075–1082
16. Varas-Lorenzo C., Riera-Guardia N., Calingaert B. et al. Myocardial infarction and individual nonsteroidal anti-inflammatory drugs meta-analysis of observational studies. *Pharmacoepidemiol Drug Saf.* 2013;22(6):559–570. DOI: 10.1002/pds.3437