

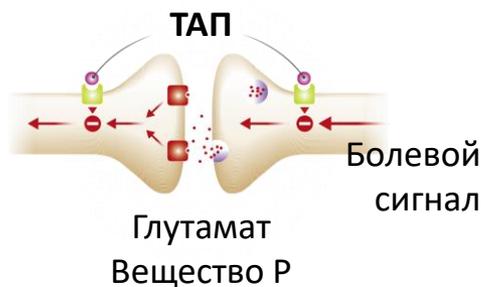
ТАПЕНТАДОЛ – НОВЫЙ АНАЛЬГЕТИК ЦЕНТРАЛЬНОГО ДЕЙСТВИЯ: 1 МОЛЕКУЛА – 2 ЭФФЕКТА*

Механизм действия тапентадола на спинальном уровне¹⁻³

MOR

(агонист мю-опиоидных рецепторов)¹

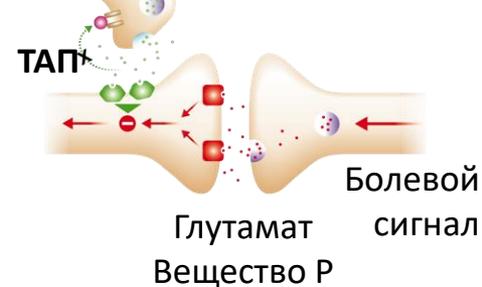
Восходящие пути



NRI

(ингибитор обратного захвата норадреналина)^{1,2}

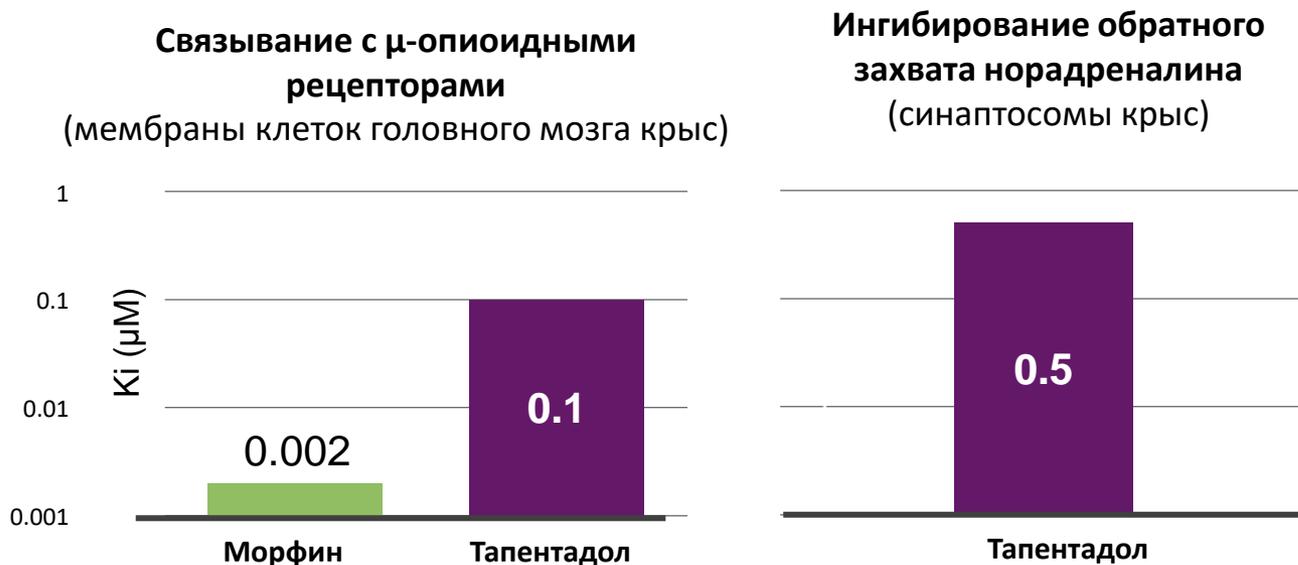
Нисходящие НА пути



Комплементарная MOR-NRI активность обеспечивает синергизм действия⁴

1. Tzschentke TM, et al. *Drugs Today* 2009;45 (7):483-96.
2. Benarroch E. *Neurology* 2008; 71:217-221.
3. Ossipov M et al. *J Clin Invest* 2010; 120(11): 3781-3787.
4. Schroder W et al. *JPET* 2011; 337: 312-320

Связывание с рецепторами. Тапентадол в сравнении с морфином.



- » **СТЕПЕНЬ СВЯЗЫВАНИЯ ТАПЕНТАДОЛА С МЮ-ОПИОИДНЫМИ РЕЦЕПТОРАМИ В 50 РАЗ МЕНЬШЕ, ЧЕМ У МОРФИНА***,
- » **НО АНАЛЬГЕТИЧЕСКАЯ АКТИВНОСТЬ ТАПЕНТАДОЛА НИЖЕ ТОЛЬКО В 2-3 РАЗА, БЛАГОДАРЯ НАЛИЧИЮ ВТОРОГО МЕХАНИЗМА ДЕЙСТВИЯ – ИНГИБИРОВАНИЕ ОБРАТНОГО ЗАХВАТА НОРАДРЕНАЛИНА***

*данные получены in vitro/in vivo

По материалам: Tzschentke TM et al. Drugs Future 2006;31:1053-61

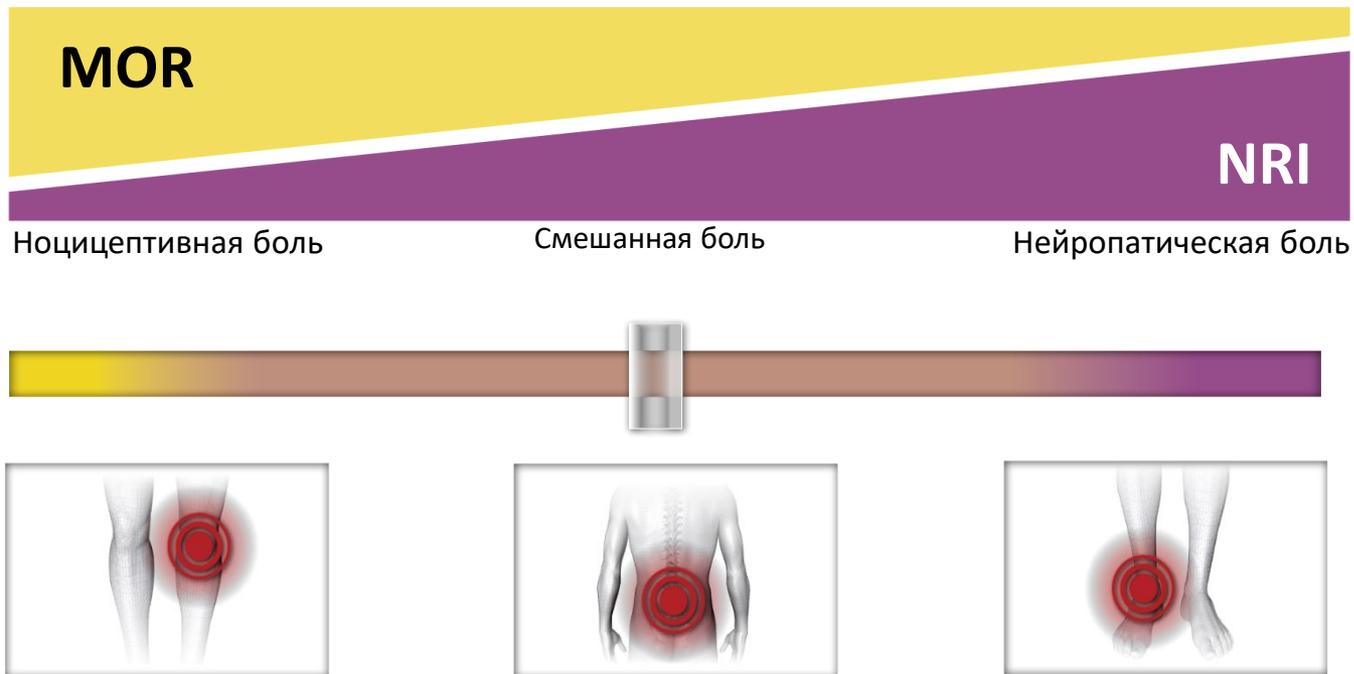
ТАПЕНТАДОЛ – СИЛЬНЫЙ АНАЛЬГЕТИК ПРИ ЛЮБОЙ БОЛИ

Уменьшает восходящий
болевой сигнал³



Увеличивает нисходящее
болевую модуляцию⁴

Хроническая боль



**Широкий спектр
анальгетической
эффективности при
различных видах
боли:**

- Остеоартрит
- Болевая диабетическая нейропатия
- Хроническая боль в спине, в т.ч. с нейропатическим компонентом
- Онкологическая боль

1. Afilalo M et al. Clin Drug Investig 2010; 30 (8): 489-505.
2. Schwartz S et al. CMRO 2011; 27(1): 151-62 (KF36).
3. Steigerwald I et al. CMRO 2012; 28(6):1-26.
4. Baron R et al. Pain Pract. 2016;16(5):580-99.

Фармакокинетический профиль тапентадола.



Не является пролекарством¹

- Активность не зависит от метаболической активации



Нет активных метаболитов¹

- Нет риска кумуляции



Низкий риск межлекарственного взаимодействия¹

- Основной путь метаболизма – глюкуронизация
- Не является индуктором или ингибитором системы CYP450
- Низкий уровень связывания с белками плазмы

**ТАПЕНТАДОЛ ИМЕЕТ ПРЕДСКАЗУЕМЫЙ ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЙ
ПРОФИЛЬ С НИЗКИМ ПОТЕНЦИАЛОМ МЕЖЛЕКАРСТВЕННОГО
ВЗАИМОДЕЙСТВИЯ**

1. В соответствии с инструкцией по применению препарата Палексия, таблетки пролонгированного действия.

Фармакокинетический профиль тапентадола - 2

таблетки, покрытые оболочкой, пролонгированного действия*

- Биодоступность – 32%.
- Максимальная концентрация в крови – между 3 и 6 часами.
- Равновесная концентрация достигается на 2 сутки.
- Тапентадол и его метаболиты экскретируются почти полностью (99%) почками.

- Можно принимать внутрь как до, так и после приема пищи.

**В соответствии с инструкцией по медицинскому применению препарата Палексия, таблетки пролонгированного действия.*

Применение тапентадола при нарушении функции печени и почек*

	Легкая недостаточность	Умеренная недостаточность	Выраженная недостаточность
<p>Нарушение функции почек</p> 	<p>Коррекция доз не требуется</p> 	<p>Коррекция доз не требуется</p> 	<p>Применение препарата не рекомендуется, поскольку отсутствует опыт применения препарата у данной группы пациентов.</p> 
<p>Нарушение функции печени</p> 	<p>Коррекция доз не требуется</p> 	<p>Начальная доза – 50 мг/сут. Дальнейшая терапия должна быть направлена на поддержание анальгетического эффекта с приемлемым уровнем переносимости.</p> 	<p>Применение препарата не рекомендуется, поскольку отсутствует опыт применения препарата у данной группы пациентов.</p> 

**В соответствии с инструкцией по медицинскому применению препарата Палексия, таблетки пролонгированного действия.*

Применение тапентадола у особых групп пациентов*



Рекомендованные дозы для пожилых пациентов с нормальной функцией печени и почек такие же, как и для пациентов среднего возраста с нормальной функцией почек и печени.



Противопоказан у детей до 18 лет.



Применение тапентадола во время беременности допустимо, только если потенциальная польза для матери превышает потенциальный риск для плода.



Не следует назначать в период грудного вскармливания.

**В соответствии с инструкцией по медицинскому применению препарата Палексия, таблетки пролонгированного действия.*

Тапентадол в России - ПАЛЕКСИЯ

- Палексия, таблетки **пролонгированного действия**, 50 мг*
- Показания к применению: **Хронический болевой синдром** средней и высокой степени тяжести. Препарат применяется лишь при болевом синдроме средней и сильной интенсивности, требующем назначения опиоидных анальгетиков.

Подбор оптимальной дозы Палексии ПД у пациентов, не принимающих опиоидные анальгетики:

- Следует начинать терапию с дозы 50 мг *2 р/сут.
- Равновесная концентрация тапентадола в крови достигается на 2 сутки приема препарата, поэтому, если адекватный контроль боли не достигнут, доза тапентадола может быть увеличена на 50мг*2 р/сут каждый 3 дня.
- Дозировки тапентадола более 500 мг/сут не исследовались, поэтому не рекомендуются.

**Ожидаются таблетки пролонгированного действия 100 мг, 150 мг до конца 2019г; таблетки короткого действия 50 мг в 2020г.*

За рубежом тапентадол доступен также в виде раствора для перорального приема.



Переключение на Палексию ПД с других опиоидных анальгетиков.

» Выбор стартовой дозы тапентадола

- При выборе первоначальной дозы тапентадола при переходе с других опиоидных анальгетиков следует принимать во внимание характеристика ранее назначавшегося препарата, частоту его приема и среднюю суточную дозу¹
- Как правило, пациенты, уже получающие опиоидную терапию и переходящие на другой опиоид, должны первоначально получать 50% -75% от эквивалентной дозы, чтобы снизить риск развития НЯ²
- Поскольку у тапентадола два механизма действия, только один из которых опиоидный, редукция должна составлять не более 30%⁴

» ОРИЕНТИРОВОЧНОЕ СООТНОШЕНИЕ ДОЗ⁴

Морфин (per os) : Тапентадол ПД ~ 1: 2.5

1. Инструкция по медицинскому применению препарата Палексия, таблетки пролонгированного действия
2. Bonica's Management of Pain. Editor John D. Loeser. 3rd edition 2001. Chapter "Cancer pain: Management" by Dermot R. Fitzgibbon, page 675.
3. Steigerwald I et al. Abstract presented at 10th ASRA Pain Meeting & Workshops, November 17-20, 2011, New Orleans, Louisiana
4. Kress H.G., Koch E.D., Kosturski H., Steup A., Karcher K., Lan ge B., Dogan C., Etropolski M.S., Eerdeken M.: Tapentadol prolonged release for managing moderate to severe, chronic malignant tumor-related pain. Pain Physician 2014, 17:3 29–343.