

ПРОБЛЕМЫ ФАРМАКОЛОГИИ
PROBLEMS PHARMACOLOGY

Бурчинский С.Г.

**ФАРМАКОТЕРАПЕВТИЧЕСКИЕ АСПЕКТЫ ПРИМЕНЕНИЯ
ПРЕПАРАТА АДАПТОЛ**

S.G. Burchinskii

**PHARMACOTHERAPEUTIC ASPECTS OF APPLICATION OF THE DRUG
ADAPTOL**

Одной из наиболее актуальных проблем современной медицины, которая, к сожалению, еще не в полной мере осознана практическими врачами, является существенное изменение динамики различных патологических процессов, формирование принципиально новых патогенетических звеньев в их развитии, возникновение нового "портрета" многих заболеваний, хорошо знакомых на протяжении последних десятилетий. Изменение условий и ритма жизни, значительные психоэмоциональные перегрузки, частота хронических стрессовых ситуаций в сочетании с усложнением экологической обстановки и ослаблением иммунного ответа - все это является основой значительного распространения в современном мире, особенно в развитых странах, различных психовегетативных расстройств, психосоматической патологии, различных форм неврозов. Кроме того, патогенетические пути развития многих заболеваний, в том числе кардиологических и неврологических, стали более комплексными, все большую роль в генезе соматической патологии стали играть нарушения центральной регуляции вегетативных функций. К тому же значительно более актуальным стало понятие "предболезнь", когда, чаще всего в результате хронического стрессорного влияния, происходит ослабление адаптационно-компенсаторных реакций, и организм начинает действовать в "аварийном режиме", хотя еще и без клинических признаков развития конкретной патологии. Именно в этом состоянии адекватная фармакологическая коррекция способна предотвратить отрицательную динамику патологических изменений, нормализовать проявления типичного в настоящее время конфликта между организмом человека и окружающей средой. В результате в современной медицине сформировалась острая потребность в особом классе лекарственных средств - "нормализаторов" упомянутого конфликта адаптации, "биокорректоров" и стабилизаторов системы нейрогуморальной регуляции.

Основными требованиями к таким средствам являются следующие:

- 1) Наличие широкого спектра фармакотерапевтического действия, эффективное воздействие на различные системы организма.
- 2) Комплексный механизм действия, который обеспечивает в оптимальном случае сочетание адаптогенных, вегетостабилизирующих, стрессопротективных и ноотропных свойств.
- 3) Наличие, помимо лечебного и профилактического действия, способности предотвращать развитие патологии на этапе "предболезни".
- 4) Безопасность и хорошая переносимость.

Необходимо сразу отметить, что разработка такого ряда средств является сравнительно молодым направлением в фармакологии, и поэтому на мировом фармацевтическом рынке вышеупомянутым, достаточно жестким критериям отвечает весьма ограниченное количество препаратов. В еще меньшей мере данные средства представлены на Украине. Одним из наиболее известных и в то же время наиболее полно соответствующим вышеизложенным требованиям средством является препарат Адаптол производства компании "Олайнфарм" (Латвия).

Адаптол - препарат во многом уникальный, практически не имеющий аналогов ни с фармакологической, ни с клинико-фармакотерапевтической точек зрения. Вместе с тем потребность в препаратах именно такого типа действия, как Адаптол, в современной врачебной практике неуклонно возрастает. Попробуем проанализировать, в чем же заключается своеобразие этого препарата и его актуальность для сегодняшнего этапа развития медицины.

Адаптол - препарат, разработанный в бывшем СССР в содружестве ученых-химиков и врачей и внедренный в клиническую практику в 1979 г. Первоначально он был предложен как дневной транквилизатор с широким спектром анксиолитической активности. Однако за годы его клинического применения, а также в результате

глубоких экспериментальных исследований было выявлено значительное количество новых свойств данного препарата, что значительно расширило его фармакотерапевтические возможности.

По своей химической структуре *Адантол* является бициклическим производным мочевины, то есть, близок к природным метаболитам организма - мочеvine, а именно к пуринам. *Адантол* оказывает на организм комплексное, многостороннее воздействие, в котором ведущую роль играют его нейротропные свойства. Активно проникая через гематоэнцефалический барьер, *Адантол* воздействует на различные структурно-функциональные элементы нейронов, преимущественно гипоталамуса и лимбической системы. Именно в сочетании системного и клеточного механизмов в значительной степени заключается "секрет" действия этого препарата.

Среди основных нейромедиаторных эффектов *Адантола* - его центральное ГАМК-эргическое, серотонинэргическое и менее выраженное холинэргическое действие на фоне значительной адренолитической активности и антиглутаматэргического действия. Хотя конкретные нейрохимические механизмы этих эффектов остаются еще недостаточно выясненными, есть основания предположить наличие у *Адантола* прямого миметического эффекта в отношении ГАМК-рецепторов и М-холинорецепторов. В целом, под ГАМК-эргическим действием преимущественно подразумевается наличие у *Адантола* анксиолитических свойств, то есть его транквилизирующего эффекта, принципиально отличающегося, однако, от действия бензодиазепинов, о чем речь будет идти ниже. В то же время, если рассматривать его центральные эффекты в целом, можно в первую очередь заметить его нормализующее воздействие на баланс активности различных нейромедиаторных систем мозга, а именно - активирующее в отношении тормозного медиатора ГАМК, и ослабляющее в отношении возбуждающих нейротрансмиттеров – норадреналина и глутамата, а также нормализацию взаимоотношений адрено- и серотонинэргических воздействий. Именно дисбаланс в активности отмеченных нейромедиаторных систем (в соотношении возбуждающих и тормозных воздействий) лежит в основе таких распространенных расстройств, как тревожность, нейроциркуляторная дистония, различные неврозы. Кроме того, он также играет определенную роль в проявлениях коронарного спазма, аритмий, гипертонической болезни и т.п. Таким образом, в действии *Адантола* как "нормализатора" и "стабилизатора" наиболее важную роль играет его комплексное воздействие на систему взаимосвязей нейромедиаторных систем мозга.

Таковыми же разносторонними и разнообразными являются клеточные эффекты *Адантола*. Этот препарат сочетает в своем действии антигипоксические и мембраностабилизирующие свойства, активацию процессов энергообеспечения клетки, обмена глюкозы и тканевого дыхания. Возможно, определенную роль здесь играет структурное сходство *Адантола* с пуриновыми производными, у которых важное место в механизмах действия занимает стимуляция синтеза макроэргических фосфатов основного компонента энергетики клеточных реакций. Сочетание вышеупомянутых эффектов лежит в основе выявленных в эксперименте и клинике адаптогенных, стрессопротективных и ноотропных свойств *Адантола*.

Таким образом, *Адантол* имеет сложный и многообразный центральный механизм действия. Однако, не меньшую роль играет и его периферическая фармакологическая активность. Данный препарат увеличивает объемную скорость коронарного кровотока, усиливает сократительную функцию миокарда и повышает сердечный выброс, а также увеличивает поглощение миокардом кислорода, нормализует проницаемость сосудистой стенки, липидный спектр и баланс электролитов крови, то есть имеет широкий спектр действия, очень привлекательный с точки зрения кардиологии.

Как же отражаются рассмотренные фармакологические эффекты *Адантола* на возможностях клинического применения препарата?

Начать разговор об этом, наверное, имеет смысл с показания, непривычного для подавляющего большинства лекарственных средств - целесообразности его применения у здоровых людей. Однако, "здоровых", в данном контексте, с существенной оговоркой. Речь идет о возможности использования уникального свойства *Адантола* - его потенциала как адаптогена и "нормализатора" функций организма у лиц, находящихся под давлением продолжительной нервно-психической и/или физической нагрузки, то есть в условиях постоянно действующего стресса - довольно распространенной в наши дни ситуации. При этом у отмеченной категории людей отсутствие клинических признаков конкретного заболевания не определяет состояние их здоровья. Очень часто такой человек фактически уже находится в состоянии "предболезни", в фазе истощения адаптационно-компенсаторных возможностей организма. Именно у данной, довольно многочисленной категории наших сограждан, своевременный прием соответствующего адаптогена способен предупредить или, по меньшей мере, затормозить дальнейший срыв компенсаторных реакций и развитие конкретной

формы патологии. *Адаптол* является средством, сочетающим в себе как адаптогенные, так и стресспротективные свойства, что делает его применение показанным для указанного рода потребителей как фармакопрофилактического средства.

Наконец, здесь нельзя не вспомнить и о такой важной стороне действия *Адаптола*, как его ноотропное действие, которое в значительной степени определяется его антигипоксическими свойствами и способностью улучшать мозговой кровоток. Таким образом, именно комплексность воздействия, которая является наиболее важной стороной фармакологической активности данного препарата, определяет его ценность с клинической точки зрения. В результате *Адаптол* повышает физическую и психическую трудоспособность, умственную активность, улучшает эмоциональный спектр, память и динамику познавательных процессов, что вместе с его мягким транквилизирующим эффектом и устранением ощущения тревоги позволяет говорить о том, что *Адаптол* обладает оптимальными фармакотерапевтическими характеристиками как стресспротективного средства, так и ноотропа и "нормализатора" регуляторных функций головного мозга.

Тесно связана с вышеупомянутым показанием и целесообразность применения *Адаптола* как средства терапии различных синдромов, прямо или косвенно связанных со стрессорным влиянием. Многочисленными клиническими исследованиями показана его эффективность при нейрциркуляторной дистонии (НЦД). Как известно, ведущую роль в патогенезе данной формы патологии играет нарушение центральных механизмов регуляции вегетативных функций, прежде всего деятельности сердца и сосудистого тонуса, причем чаще встречается симпатотонический тип НЦД, связанный с центральным нейромедиаторным дисбалансом гиперактивацией катехоламинэргических воздействий. В действии *Адаптола*, как уже упоминалось, важное место принадлежит адренолитическим эффектам в сочетании с нормализующим влиянием на нейромедиаторный баланс в мозге. Именно этими свойствами *Адаптола* объясняется его высокая эффективность при НЦД как "вегетостабилизатора", в частности, имеет место нормализация сосудистого тонуса, что проявляется в умеренном снижении артериального давления, уменьшения субъективных болевых ощущений - кардиалгии, устранение повышенной нервной возбудимости, ощущения страха и тревоги.

В рамках всех вышеописанных показаний к применению *Адаптола* важными являются его свойства как транквилизатора. Целесообразно кратко остановиться на основных его преимущест-

вах в сравнении с классическими препаратами этой группы -бензодиазепиновыми производными.

Адаптол, в отличие от большинства бензодиазепинов, рассматривается как дневной транквилизатор. Он не оказывает миорелаксирующего эффекта, не угнетает сократительную функцию миокарда, не вызывает нежелательных центральных эффектов: угнетенности, вялости, сонливости, эмоционального безразличия. Его прием не накладывает ограничений на профессиональную и социальную деятельность человека (вождение автомобиля, работа со сложными системами, напряженная умственная деятельность) и, что очень важно, не вызывает привыкания, пристрастия и развития синдрома отмены. Кроме того, *Адаптолу* свойственны исключительно благоприятные характеристики безопасности. Он почти не проявляет побочных эффектов (изредка -аллергические реакции и диспепсические явления, проходящие при уменьшении дозы или отмене препарата), не проявляет токсического действия даже при значительной передозировке (до 1000 разовых доз) и, согласно экспериментальным данным, в 150 раз менее токсичен, чем Седуксен. Поэтому, эффективность *Адаптола* выше, чем бензодиазепинов в терапии НЦД, неврозов, кардиалгии различного генеза, а также при различных формах кардиологической патологии, что следует отметить особо.

Сочетание вегетостабилизирующих, антигипоксических и анальгетических свойств *Адаптола* способствовало изучению его применения в кардиологической практике. Препарат оказался достаточно эффективным при ишемической болезни сердца, в частности, проявлял выраженное антиангинальное действие, а также был эффективен при недостаточности кровообращения, аритмиях (особенно пароксизмальной тахикардии, предсердной и желудочковой экстрасистолии), миокардиодистрофии (особенно в климактерический период). Например, при стенокардии I и II функционального класса *Адаптол* рассматривается как самостоятельное лечебное средство, без необходимости сопутствующего приема нитроглицерина.

Однако, вышесказанным не исчерпывается спектр показаний к применению *Адаптола*. В неврологии и психиатрии он также применяется для улучшения переносимости нейролептиков и бензодиазепинов, для лечения больных с пароксизмами после закрытой черепно-мозговой травмы, в реабилитационный период после инсульта. В наркологии *Адаптол* используется для купирования абстинентных расстройств и для продления периодов ремиссии, в гинекологии - в комплексной терапии климактерических и менструальных расстройств, в стоматологии - как

эффективное средство, сочетающее транквилизирующее и анальгетическое действие.

Особо следует упомянуть о перспективах применения *Адаптола* при синдроме хронической усталости (СХУ) - сравнительно новой патологической форме, частота возникновения которой стремительно возрастает в последние годы. Несмотря на то, что ведущую роль в развитии СХУ приписывают нарушениям иммунной системы, нет сомнений в том, что важными звеньями патогенеза данного синдрома являются ослабление стойкости организма к стрессу, тревожно-невротические расстройства и ряд других проявлений, которые эффективно корректирует *Адаптол*. Поэтому следует считать целесообразным прием *Адаптола* в рамках комплексной терапии СХУ как адаптогена и мягкого транквилизатора.

Схема практического применения *Адаптола* довольно проста. Благодаря химической инертности препарата, отсутствию образования активных метаболитов, способности к кумуляции (выведению из организма в неизменном виде преимущественно с мочой 90% введенной дозы на протяжении суток) и клинически значимого взаимодействия с другими препаратами *Адаптол*

можно принимать независимо от приема пищи или сопутствующей фармакотерапии. Разовая доза препарата - 0,3 г (1 таблетка) 3 раза в день, при лечении наркотической зависимости, а применение его с целью улучшения переносимости нейролептиков и транквилизаторов - 0,6-0,9 г по 3 раза в день (до 3,6 г в сутки). Максимально допустимые дозы: разовая - 3 г, суточная - 10 г. Курс лечения - от нескольких дней до 2-3 мес.

Таким образом, *Адаптол*, прежде всего, характеризуется исключительно своеобразным спектром фармакологической активности и чрезвычайной широтой и разнообразием клинического применения. Особенно важным в практическом плане является сочетание в препарате эффективного терапевтического потенциала и фармакопрофилактических свойств, что является довольно редким явлением и весьма актуальной особенностью *Адаптола* среди лекарственных средств, представленных на фармацевтическом рынке Украины. Опираясь на имеющиеся сегодня сведения о возможностях и перспективах применения *Адаптола*, следует рекомендовать более широкое его применение в различных отраслях клинической медицины.