

Руководитель Департамента государственного контроля лекарственных
средств и медицинской техники МЗ РФ

Фармакологическим комитетом МЗ РФ

Протокол № 1 от 16 января 2003 г.

В.Е. Акимочкин

ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению препарата
ДИКЛОФЕНАК
Diclofenac

Регистрационный номер: раствор для инъекции - П №014940/02-2003
таблетки - П №0149/4001-2003

Торговое название препарата: Диклофенак

Международное непатентованное название (МНН): Диклофенак

Лекарственная форма: таблетки, покрытые кишечнорастворимой оболочкой,
раствор для инъекций

Состав:

таблетки: каждая таблетка содержит 25 мг или 50 мг активного вещества диклофенака, а также вспомогательные вещества: лактозу, кукурузный крахмал, динатриевую соль ЭДТА, натрия метабисульфит, магния стеарат, ~~содоплимер метакриловой кислоты, диэтилфталат, диоксид титана, красную окись железа, желтую окись железа.~~
раствор для инъекции: каждый мл раствора для инъекций содержит 25 мг диклофенака и вспомогательные вещества: бензиловый спирт, пропиленгликоль, метабисульфит натрия, гидроксид натрия, вода для инъекций.

Описание

Таблетки: круглые, двояковыпуклые таблетки, покрытые оболочкой; таблетки 50 мг - коричневатого-желтого цвета, таблетки 25 мг - красновато-желтого цвета.

Раствор для инъекций: прозрачный, бесцветный или слегка желтоватый раствор со слабым запахом спирта бензилового.

Фармакотерапевтическая группа

Нестероидный противовоспалительный препарат (НПВП).

Код АТХ: M01AB05

Фармакодинамика

Фармакологическое действие - противовоспалительное, анальгезирующее, жаропонижающее, антиагрегационное. Ингибирует циклооксигеназы 1 и 2, в результате чего блокируются реакции арахидонового каскада и нарушается синтез простагландинов, тромбоксана A_2 , простаглицлина, лейкотриенов и выброс лизосомальных ферментов; подавляет агрегацию тромбоцитов; при длительном применении оказывает десенсибилизирующее действие.

Фармакокинетика: Абсорбция - быстрая и полная, пища замедляет скорость абсорбции. После перорального приема 50 мг максимальная концентрация достигается через 2-3 ч и составляет 1,5 мкг/мл, биодоступность 50%. Концентрация в плазме находится в линейной зависимости от величины вводимой дозы.

Изменения фармакокинетики диклофенака на фоне многократного введения не отмечается. Не кумулирует при соблюдении ~~рекомендуемого интервала между приемами пищи.~~

Связь с белками плазмы - 95-98% (большая часть связывается с альбуминами). Проникает в синовиальную жидкость; Максимальная концентрация в синовиальной жидкости наблюдается на 2-4 ч позже, чем в плазме. Время полувыведения из синовиальной жидкости - 3-6 ч (концентрации активного вещества в синовиальной жидкости через 4-6 ч после введения препарата выше, чем в плазме, и остаются выше еще в течение 12ч).

Метаболизм: 50% активного вещества подвергается метаболизму во время "первого прохождения" через печень; Площадь под фармакокинетической кривой (AUC) в 2 раза меньше после перорального введения препарата, чем после парентерального введения такой же дозы. Метаболизм происходит в результате многократного или однократного гидроксирования и конъюгирования с глюкуроновой кислотой.

Фармакологическая активность метаболитов - меньше, чем диклофенака.

Системный клиренс составляет 260 мл/мин. Время полувыведения из плазмы - 1-2 ч. 60% введенной дозы выводится в виде метаболитов через почки; менее 1% выводится в неизменном виде, остальная часть дозы выводится в виде метаболитов с желчью.

У больных с выраженными нарушениями функции почек (клиренс креатинина менее 10 мл/мин) увеличивается выведение метаболитов с желчью, при этом увеличения их концентрации в крови не наблюдается.

У больных с хроническим гепатитом или компенсированным циррозом печени фармакокинетические параметры диклофенака такие же, как и у пациентов без заболеваний печени.

Показания к применению

- Воспалительные заболевания опорно-двигательного аппарата (ревматоидный артрит, псориатический, ювенильный хронический артрит, анкилозирующий спондилит; подагрический артрит), острый подагрический артрит.
- Дегенеративные заболевания опорно-двигательного аппарата (деформирующий остеоартроз, остеохондроз).
- Люмбаго, ишиас, невралгия, миалгия.
- Заболевания внесуставных тканей (тендовагинит, бурсит, ревматическое поражение мягких тканей).
- Посттравматические болевые синдромы, сопровождающиеся воспалением, послеоперационные боли, мигрень, почечная или желчная колика; первичная альгодисменорея, аднексит, проктит.
- Инфекционно-воспалительные заболевания ЛОР органов с выраженным болевым синдромом (фарингит, тонзиллит, отит), остаточные явления пневмонии.
- Лихорадочный синдром.

Противопоказания

Гиперчувствительность (в т.ч. к др. НПВП), эрозивно-язвенные поражения ЖКТ (в фазе обострения), "аспириновая" астма, нарушения кроветворения, беременность, младший детский возраст, период лактации. С осторожностью - индуцируемые острые печеночные порфирии, тяжелые нарушения функции печени и почек, сердечная недостаточность.

Способ применения и дозы

Внутри, не разжевывая, во время или после еды, взрослым - по 25-50 мг 2-3 раза в сутки. При достижении оптимального терапевтического эффекта дозу постепенно уменьшают и переходят на поддерживающее лечение в дозе 50 мг/сут.

Максимальная суточная доза - 150 мг.

Для детей старше 6 лет и подростков применяются только таблетки обычной продолжительности действия по 25 мг; суточная доза - 2 мг/кг массы тела ребенка. При ювенильном ревматоидном артрите суточная доза может быть увеличена до 3 мг/кг.

Таблетки следует принимать целиком, не разжевывая, натощак, с небольшим количеством жидкости.

В/в капельно. Максимальная суточная доза - 150 мг. Непосредственно перед в/в введением диклофенак (содержимое 1 ампулы - 75 мг) следует развести в 100-500 мл 0,9% раствора натрия хлорида или 5% раствора глюкозы (предварительно

добавив в инфузионные растворы раствор натрия бикарбоната 0,5 мл 8,4% или 1 мл 4,2% раствора), В зависимости от степени выраженности болевого синдрома инфузию осуществляют в течение 30-180 мин. С целью предотвращения послеоперационных болей проводят инфузию "ударной" дозой препарата (25-50 мг за 15-60 мин). В дальнейшем инфузию продолжают со скоростью 5 мг/ч (до достижения максимальной суточной дозы 150 мг). Для лечения острых состояний или купирования обострения хронического заболевания возможно также в/м (однократное) введение, дальнейшее лечение продолжают пероральным назначением диклофенака с учетом максимальной суточной дозы - 150 мг (в т.ч. и в день инъекции). Инъекционный раствор вводится глубоко в/м в течение не более 2 дней.

Побочное действие

Со стороны пищеварительной системы: гастралгия, тошнота, рвота, диарея, желудочная колика, диспепсия, метеоризм, анорексия, повышение активности "печеночных" трансаминаз, желудочно-кишечное кровотечение (гематемезис, мелена), гепатит с желтухой или без желтухи, молниеносный гепатит, панкреатит, неспецифический колит с кровотечением, обострение язвенного колита или болезни Крона, афтозный стоматит, глоссит, эрозивный эзофагит, запор.

Со стороны нервной системы: головная боль, головокружение, повышенная утомляемость, нарушения восприятия, парестезии, снижение памяти, потеря чувства ориентации, снижение остроты зрения, диплопия, снижение слуха, шум в ушах, бессонница, раздражительность, судороги, депрессия, тревожность, "кошмарные" сновидения, тремор, психотические реакции, нарушение вкусовых ощущений.

Со стороны кожи: высыпания на коже, буллезные высыпания, экзема, полиморфная эритема, эритродермия (экзофоллиативный дерматит), алопеция, фотосенсибилизация, пурпура.

Со стороны мочевыделительной системы: острая почечная недостаточность, гематурия, протеинурия, интерстициальный нефрит, нефротический синдром, сосочковый некроз.

Со стороны органов кроветворения: тромбоцитопения, лейкопения, агранулоцитоз, гемолитическая анемия, апластическая анемия.

Аллергические реакции: бронхоспазм, крапивница, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла), аллергическая пурпура, системные анафилактические реакции (включая шок).

Прочие: отеки, импотенция, сердцебиение, боль в груди, повышение АД. В месте в/м введения - жжение; инфильтрат, асептический абсцесс, некроз жировой ткани.

Передозировка

Симптомы: головокружение, головная боль, гипервентиляция, помутнение сознания, у детей - миоклонические судороги, расстройство ЖКТ (тошнота, рвота, боли в области живота, кровотечения), расстройства функций печени и почек.

Лечение: промывание желудка, введение активированного угля, симптоматическая терапия, направленная на устранение повышения АД, нарушения функции почек, судорог, раздражения ЖКТ, угнетения дыхания. Форсированный диурез, гемодиализ малоэффективны.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Повышает концентрацию в плазме дигоксина, препаратов лития и циклоспорина.

На фоне калийсберегающих диуретиков усиливается риск гиперкалиемии, на фоне антикоагулянтов - риск кровотечений.

Уменьшает эффекты диуретических, гипотензивных и снотворных средств.

Увеличивает вероятность возникновения побочных эффектов нестероидных противовоспалительных препаратов, глюкокортикостероидов (кровотечения в ЖКТ), токсичность метотрексата и нефротоксичность циклоспорина.

Ацетилсалициловая кислота снижает концентрацию диклофенака в крови.

При одновременном применении с пероральными гипогликемическими препаратами возможно развитие как гипо-, так и гипергликемия.

Особые указания

Из-за важной роли простагландинов в поддержании почечного кровотока следует проявлять особую осторожность при назначении пациентам с сердечной или почечной недостаточностью, а также при терапии лиц пожилого возраста, принимающих диуретики, и больных, у которых по какой-либо причине наблюдается снижение объема циркулирующей крови (например, после обширного хирургического вмешательства). Если в таких случаях назначают диклофенак, рекомендуют в качестве меры предосторожности контролировать функцию почек.

У пациентов с печеночной недостаточностью (хронический гепатит, компенсированный цирроз печени) кинетика и метаболизм не отличаются от аналогичных процессов у пациентов с нормальной функцией печени. При проведении длительной терапии необходимо контролировать функцию печени, картину периферической крови, анализ кала на скрытую кровь.

В период лечения возможно снижение скорости психических и двигательных реакций.

Форма выпуска

Таблетки по 25 мг, 50 мг

По 10 таблеток в блистеры из фольги алюминиевой и пленки поливинилхлоридной. По 2,3 или 5 блистеров в картонной упаковке.

Раствор для инъекций 25 мг/мл в ампулах по 3 мл.

Условия хранения

Список Б. В сухом, защищенном от света месте, при температуре ниже 30° С. Хранить в местах, недоступных для детей.

В защищенном от света месте, при температуре ниже 30°С (для раствора).

Срок годности: таблетки - 4 года, раствор для инъекций 3 года.

Не использовать препарат после даты, указанной на упаковке.

Условия отпуска из аптек по рецепту.

Производитель:

«М. Дж. Биофарм Pvt. Лтд.»

113, Джолпи Мейкар Чамбарс 2, Нариман Поинт, Мумбаи, 400 021, Индия

Представительство в Российской Федерации

191334 Россия, Москва, Ленинский проспект, 45, офис 492.

Тел. (495) 935-7206/07 Факс (495) 135-1396. E-mail: marvel@tsr.ru