



ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

ДИКЛОФЕНАК

Регистрационный номер: П N011648/01, П N011648/02

Торговое название препарата: Диклофенак

Международное непатентованное название (МНН): Диклофенак.

Лекарственная форма: таблетки, покрытые кишечнорастворимой оболочкой; таблетки пролонгированного действия, покрытые пленочной оболочкой.

Состав

1 таблетка, покрытая кишечнорастворимой оболочкой, содержит: *активное вещество:* диклофенак натрия 50 мг; *вспомогательные вещества:* лактозы моногидрат – 46,6 мг, кукурузный крахмал – 59,2 мг, повидон-К30 – 10,0 мг, натрия лаурилсульфат – 10,0 мг, карбоксиметилкрахмал натрия – 20,0 мг, кремния диоксид коллоидный – 3,0 мг, магния стеарат – 1,2 мг; *оболочка:* метакриловой кислоты и метилметакрилата сополимер – 4,1379 мг, макрогол-6000 – 1,0345 мг, тальк – 6,7241 мг, титана диоксид Е 171 – 1,0345 мг, краситель солнечный закат желтый – 2,0670 мг.

1 таблетка пролонгированного действия, покрытая пленочной оболочкой, содержит: *активное вещество:* диклофенак натрия 100 мг; *вспомогательные вещества:* сахароза – 94,7880 мг, цетиловый спирт – 54,8200 мг, кремния диоксид коллоидный, безводный – 0,7900 мг, тальк – 3,9500 мг, повидон К-25 – 1,053 мг, магния стеарат – 7,8990 мг; *оболочка:* гипромеллоза – 3,4355 мг, титана диоксид Е 171 – 0,8649 мг, тальк – 2,4178 мг, полисорбат 80 – 0,3826 мг, макрогол 6000 – 0,6894 мг, краситель пунцовый [Понсо 4R] [Е124] – 0,0441 мг, краситель коричневый [краситель солнечный закат желтый [Е110]+краситель азорубин [Е122]+краситель бриллиантовый черный [Е151]] – 0,0147 мг, лак алюминиевый на основе красителя солнечный закат желтый [Е110] – 0,0500 мг.

Описание

Таблетки, покрытые кишечнорастворимой оболочкой, 50 мг – круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые кишечнорастворимой оболочкой оранжевого цвета, на изломе от белого до почти белого цвета.

Таблетки пролонгированного действия, покрытые пленочной оболочкой, 100 мг – круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые оболочкой розового цвета, на изломе от белого до почти белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа: Нестероидный противовоспалительный препарат (НПВП)

Код АТХ: M01AB05

Фармакологическое действие

Нестероидный противовоспалительный препарат (НПВП), производное фенилуксусной кислоты. Диклофенак обладает противовоспалительным, обезболивающим, антиагрегантным и жаропонижающим действием. Неизбирательно угнетая циклооксигеназу 1 и 2 (ЦОГ1 и ЦОГ2), нарушает метаболизм арахидоновой кислоты, уменьшает количество простагландинов в очаге воспаления. Наиболее эффективен при болях воспалительного характера.

При ревматических заболеваниях противовоспалительное и анальгезирующее действие диклофенака способствует значительному уменьшению выраженности боли, утренней скованности, припухлости суставов, что улучшает функциональное состояние сустава. При травмах, в послеоперационном периоде диклофенак уменьшает болевые ощущения и воспалительный отек.

Фармакокинетика

Абсорбция – быстрая и полная, пища замедляет скорость абсорбции на 1 – 4 часа и снижает максимальную концентрацию (С_{max}) на 40%. После перорального приема 50 мг максимальная концентрация (С_{max}) – 1,5 мкг/мл достигается через – 2-3 ч. Концентрация в плазме находится в линейной зависимости от величины вводимой дозы.

После перорального приема таблеток 100 мг С_{max} – 0,5 мкг/мл достигается через – 4 -5 ч.

Изменения фармакокинетики диклофенака на фоне многократного введения не отмечается.

Не кумулирует при соблюдении рекомендуемого интервала между приемами пищи.

Биодоступность – 50%. Связь с белками плазмы – более 99% (большая часть связывается с альбуминами). Проникает в синовиальную жидкость; С_{max} в синовиальной жидкости наблюдается на 2-4 ч позже, чем в плазме. Период полувыведения (Т_{1/2}) из синовиальной жидкости 3-6 ч (концентрация активного вещества в синовиальной жидкости через 4-6 ч после введения препарата выше, чем в плазме, и остается выше еще в течение 12 ч).

Взаимосвязь концентрации препарата в синовиальной жидкости с клинической эффективностью препарата не выяснена.

Метаболизм: 50% активного вещества подвергается метаболизму во время «первого прохождения» через печень. Метаболизм происходит в результате многократного или однократного гидроксилирования и конъюгирования с глюкуроновой кислотой. В метаболизме препарата принимает участие ферментная система Р450 СYP2C9. Фармакологическая активность метаболитов ниже, чем диклофенака.

Системный клиренс составляет около 260±50 мл/мин, объем распределения – 550 мл/кг. Т_{1/2} из плазмы составляет в среднем около 2,5 часа. 65% введенной дозы выводится в виде метаболитов почками; менее 1% выводится в неизмененном виде, остальная часть дозы выводится в виде метаболитов с желчью.

У больных с выраженной почечной недостаточностью (клиренс креатинина КК 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 не изменяются.

Диклофенак проникает в грудное молоко.

Показания к применению

Симптоматическое лечение заболеваний опорно-двигательного аппарата (ревматоидный артрит, псориатический артрит, ювенильный хронический артрит, анкилозирующий спондилит (болезнь Бехтерева); подагрический артрит, ревматическое поражение мягких тканей, остеоартроз периферических суставов и позвоночника, в том числе с радикулярным синдромом, тендовагинит, бурсит).

Препарат снимает или уменьшает боль и воспаление в период лечения, при этом не влияет на прогрессирование заболевания.

Болевой синдром слабой или умеренной выраженности: невралгия, миалгия, люмбоишиалгия, посттравматический болевой синдром, сопровождающийся воспалением, послеоперационная боль, головная боль, мигрень, альгодисменорея, аднексит, проктит, зубная боль.

В составе комплексной терапии инфекционно-воспалительных заболеваний уха, горла, носа с выраженным болевым синдромом (фарингит, тонзиллит, отит).

Противопоказания

- Гиперчувствительность к активному веществу (в т.ч. к др. НПВП) или вспомогательным компонентам;

- Анамнестические данные о приступе бронхообструкции, ринита, крапивницы после приема ацетилсалициловой кислоты или иного НПВП (полный или неполный синдром непереносимости ацетилсалициловой кислоты – риносинусит, крапивница, полипы слизистой носа, астма);

- Эрозивно-язвенные изменения слизистой желудка или 12-перстной кишки, активное желудочно-кишечное кровотечение;

- Воспалительные заболевания кишечника (неспецифический язвенный колит, болезнь Крона) в фазе обострения;

- Период после проведения аортокоронарного шунтирования;

- III триместр беременности, период грудного вскармливания;

- Декомпенсированная сердечная недостаточность;

- Нарушения кроветворения, нарушения гемостаза (в т.ч. гемофилия);

- Выраженная печеночная недостаточность или активное заболевание печени;

- Выраженная почечная недостаточность (клиренс креатинина менее 30 мл/мин); прогрессирующие заболевания почек, в т.ч. подтвержденная гиперкалиемия;

- Детский возраст до 15 лет - для таблеток по 50 мг и до 18 лет – для таблеток по 100 мг;

- Пациентам с редкими наследственными заболеваниями, такими как непереносимость галактозы, дефицит лактазы или глюкозо-галактозной мальабсорбцией принимать препарат (таблетки 50 мг) противопоказано.

С осторожностью

Анемия, бронхиальная астма, цереброваскулярные заболевания, ишемическая болезнь сердца, застойная сердечная недостаточность, артериальная гипертензия, заболевания периферических артерий, отечный синдром, печеночная или почечная недостаточность (клиренс креатинина менее 60 мл/мин), дислипидемия/гиперлипидемия, сахарный диабет, курение, воспалительные заболевания кишечника, состояние после обширных хирургических вмешательств, индуцируемая порфирия, дивертикулит, системные заболевания соединительной ткани, беременность I-II триместр.

Анамнестические данные о развитии язвенного заболевания желудочно-кишечного тракта, наличие инфекции *Helicobacter pylori*, пожилой возраст, длительное использование НПВП, частое употребление алкоголя, тяжелые соматические заболевания.

Одновременная терапия антикоагулянтами (например, варфарин), антиагрегантами (например, ацетилсалициловая кислота, клопидогрел), пероральными глюкокортикостероидами (например, преднизолон), селективными ингибиторами обратного захвата серотонина (например, циталопрам, флуоксетин, пароксетин, сертралин).

Способ применения и дозы

Таблетки 50 мг.

Внутрь, не разжевывая, во время или после еды, запивая небольшим количеством воды. Взрослым и подросткам с 15 лет – по 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.

Таблетки 100 мг.

По 1 таблетке 1 раз в день. При необходимости дополнительного приема препарата используют таблетки по 50 мг.

Побочное действие

Часто - 1-10%; иногда - 0,1-1%; редко - 0,01-0,1%; очень редко - менее 0,001%, включая отдельные случаи.

Со стороны пищеварительной системы: часто - эпигастральная боль, тошнота, рвота, диарея, диспепсия, метеоризм, анорексия, повышение активности аминотрансфераз; редко - гастрит, проктит, кровотечение из желудочно-кишечного тракта (ЖКТ) (рвота с кровью, мелена, диарея с примесью крови), язвы ЖКТ (с или без кровотечения или перфорации), гепатит, желтуха, нарушение функции печени; очень редко - стоматит, глоссит, эзофагит, неспецифический геморрагический колит, обострение язвенного колита или болезни Крона, запор, панкреатит, молниеносный гепатит.

Со стороны нервной системы: часто - головная боль, головокружение; редко - сонливость; очень редко - нарушение чувствительности, в т.ч. парестезии, расстройства памяти, тремор, судороги, тревога, цереброваскулярные нарушения, асептический менингит, дезориентация, депрессия, бессонница, ночные "кошмары", раздражительность, психические нарушения.

Со стороны органов чувств: часто - вертиго; очень редко - нарушение зрения (затуманивание зрения, диплопия), нарушение слуха, шум в ушах, нарушение вкусовых ощущений.

Со стороны мочевыделительной системы: очень редко - острая почечная недостаточность, гематурия, протеинурия, интерстициальный нефрит, нефротический синдром, папиллярный некроз.

Со стороны органов кроветворения: очень редко - тромбоцитопения, лейкопения, гемолитическая и апластическая анемия, агранулоцитоз.

Аллергические реакции: анафилактические/анафилактоидные реакции, включая выраженное снижение артериального давления (АД) и шок; очень редко - ангионевротический отек (в т.ч. лица).

Со стороны сердечно-сосудистой системы: очень редко - сердцебиение, боль в груди, повышение артериального давления, васкулит, сердечная недостаточность, инфаркт миокарда.

Со стороны дыхательной системы: редко - обострение бронхиальной астмы; очень редко - пневмонит.

Со стороны кожных покровов: часто - кожная сыпь; редко - крапивница; очень редко - буллезные высыпания, экзема, в т.ч. мультиформная и синдром Стивенса-Джонсона, синдром Лайелла, эксфолиативный дерматит, зуд, выпадение волос, фотосенсибилизация, пурпура, в т.ч. аллергическая.

Передозировка

Симптомы: рвота, кровотечение из ЖКТ, диарея, головокружение, шум в ушах, судороги, повышение АД, угнетение дыхания, при значительной передозировке - острая почечная недостаточность, гепатотоксическое действие.

Лечение: промывание желудка, активированный уголь, симптоматическая терапия, направленная на устранение повышения АД, нарушения функции почек, судорог, раздражения ЖКТ, угнетения дыхания. Форсированный диурез, гемодиализ малоэффективны (в связи со значительной связью с белками и интенсивным метаболизмом).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Повышает концентрацию в плазме дигоксина, метотрексата, препаратов лития и циклоспорина.

Снижает эффект диуретиков, на фоне калийсберегающих диуретиков усиливается риск гиперкалиемии; на фоне антикоагулянтов, тромболитических средств (альтеплаза, стрептокиназа, урокиназа) - риск кровотечений (чаще из желудочно-кишечного тракта).

Уменьшает эффекты гипотензивных и снотворных средств.

Увеличивает вероятность возникновения побочных эффектов других НПВП и глюкокортикостероидов (кровотечения в желудочно-кишечном тракте), токсичность метотрексата и нефротоксичность циклоспорина.

Ацетилсалициловая кислота снижает концентрацию диклофенака в крови.

Одновременное использование с парацетамолом повышает риск развития нефротоксических эффектов диклофенака.

Уменьшает эффект гипогликемических средств.

Цефамандол, цефоперазон, цефотетан, вальпроевая кислота и пликамицин увеличивают частоту развития гипопротромбинемии.

Циклоспорин и препараты золота повышают влияние диклофенака на синтез простагландинов в почках, что повышает нефротоксичность.

Одновременное назначение с этанолом, колхицином, кортикотропином, ингибиторами обратного захвата серотонина и препаратами зверобоя повышает риск развития кровотечений в желудочно-кишечном тракте.

Диклофенак усиливает действие препаратов, вызывающих фотосенсибилизацию.

Препараты, блокирующие канальцевую секрецию, повышают концентрацию в плазме диклофенака, тем самым, повышая его токсичность.

Антибактериальные лекарственные средства из группы хинолона - риск развития судорог.

Влияние на результаты лабораторных анализов: диклофенак может влиять на показатели сывороточных трансаминаз (если это влияние носит продолжительный характер или если имеют место осложнения, лечение необходимо прекратить), а также может вызвать повышение концентрации калия.

Особые указания

С целью быстрого достижения желаемого терапевтического эффекта диклофенак принимают за 30 мин до приема пищи. В остальных случаях принимают до, во время или после еды, не разжевывая, запивая достаточным количеством воды.

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 пожилых пациентов, 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 почечной недостаточностью при КК менее 10 мл/мин Css метаболитов в плазме теоретически должна быть значительно выше, чем у пациентов с нормальной функцией почек, однако этого реально не наблюдается, поскольку в этой ситуации усиливается выведение метаболитов с желчью.

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 связи с отрицательным действием на фертильность, женщинам, желающим забеременеть, препарат применять не рекомендуется. У пациенток с бесплодием (в т.ч. проходящих обследование) рекомендуется отменить препарат.

Необходимо соблюдать осторожность при совместном использовании с ингибиторами АПФ, бета-блокаторами; дигоксином; при лечении нефротоксичными препаратами, зидовудином.

В период лечения возможно снижение скорости психических и двигательных реакций, поэтому необходимо воздерживаться от вождения автотранспорта и занятий другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Для снижения риска развития нежелательных явлений со стороны ЖКТ следует использовать минимальную эффективную дозу минимально возможным коротким курсом.

При приеме таблеток 100 мг больным сахарным диабетом следует учитывать содержание в препарате сахарозы (в 1 таблетке - 94,7880 мг сахарозы).

Пациентам, принимающим препарат, необходимо воздерживаться от употребления алкоголя.

Форма выпуска

Таблетки, покрытые кишечнорастворимой оболочкой, 50 мг.

По 10 таблеток в блистер из ПВХ/АЛ. 2 блистера вместе с инструкцией по применению в пачку картонную.

Таблетки пролонгированного действия, покрытые пленочной оболочкой, 100 мг.

По 10 таблеток в блистер из ПВХ/ПВДХ/АЛ. 2 блистера вместе с инструкцией по применению в пачку картонную.

Условия хранения

Список Б.

Хранить в сухом, защищенном от света месте при температуре от 15 до 25°C.

Хранить в недоступном для детей месте!

Срок годности

Таблетки, покрытые кишечнорастворимой оболочкой - 3 года.

Таблетки пролонгированного действия, покрытые пленочной оболочкой - 4 года.

Не использовать после окончания срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Производитель

1. Производитель

Хемофарм А.Д., Сербия

26300 г. Вршац, Београдский путь бб, Сербия

Тел.: 13/803100, факс: 13/803424

Претензии потребителей направлять по адресу:

Россия, 603950, г. Нижний Новгород ГСП-458, ул. Салганская, 7 и по тел.: (495) 221-70-40, факс: (495) 221-70-46.

В случае упаковки на ООО Хемофарм, Россия:

Произведено: Хемофарм А.Д. г. Вршац, Сербия

Упаковано: ООО «Хемофарм», 249030, Россия, Калужская обл., г. Обнинск, Киевское шоссе,

д. 62, тел.: (48439) 90-500, факс: (48439) 90-525.

Организация, принимающая претензии от потребителей:

ООО «Хемофарм», 249030, Россия, Калужская обл., г. Обнинск, Киевское шоссе, д. 62, тел.:

(48439) 90-500, факс: (48439) 90-525.

ИЛИ

2. Производитель

ООО «Хемофарм», 249030, Россия, Калужская обл., г. Обнинск, Киевское шоссе, д. 62, тел.:

(48439) 90-500, факс: (48439) 90-525.

Организация, принимающая претензии от потребителей:

ООО «Хемофарм», 249030, Россия, Калужская обл., г. Обнинск, Киевское шоссе, д. 62, тел.:

(48439) 90-500, факс: (48439) 90-525.