

**Инструкция
по медицинскому применению
лекарственного препарата ДИКЛОНАТ® П**

Регистрационное удостоверение _____

Название препарата: ДИКЛОНАТ® П

Международное непатентованное название: Диклофенак

Химическое название: 2-[(2,6-Дихлорфенил)амино] бензолуксусная кислота
(в виде натриевой соли)

Лекарственная форма: Раствор для внутримышечного и внутривенного введения

Состав:

1 ампула (3мл) содержит активное вещество - диклофенак натрия 75 мг и вспомогательные вещества: спирт бензиловый, манитол, натрия гидроксид, натрия метабисульфит, пропиленгликоль, вода для инъекций.

Описание:

прозрачный раствор от бесцветного до светло-желтого цвета со слабым запахом бензинового спирта.

Фармакологическая группа: нестероидное противовоспалительное средство (НПВС).

АТХ: M01AB05

Фармакологические свойства

Фармакодинамика:

Является производным фенилуксусной кислоты; оказывает противовоспалительное, анальгетическое и жаропонижающее действие.

Неизбирательно угнетая циклооксигеназу 1 и циклооксигеназу 2, диклофенак нарушает метаболизм арахидоновой кислоты, подавляет биосинтез простагландинов, являющихся медиаторами воспаления, боли и подъема температуры,

Диклофенак приводит к снижению выраженности болевого синдрома (в покое и движении), к уменьшению отечности в области суставов и утренней скованности при ревматических заболеваниях. Как и все НПВП препарат обладает антиагрегантной активностью.

Фармакокинетика:

После в/м введения 75 мг диклофенака натрия максимальная концентрация в плазме - 2.5 мкг/мл (8 мкмоль/л) отмечается уже через 20 мин и находится в линейной зависимости от величины введенной дозы.

После в/в капельного введения 75 мг в течение свыше 2-х часов максимальная концентрация диклофенака в плазме составляет 1.9 мкг/мл (5.9 мкмоль/л) и находится в обратной зависимости от времени инфузии препарата.

Связь с белками плазмы крови высокая (до 99%) и большая часть связывается с альбуминами. Период полувыведения из плазмы крови составляет 1-2 часа.

Не наблюдается кумуляции при соблюдении рекомендуемого интервала дозирования. Хорошо распределяется по тканям и жидкостям организма. Проникает в синовиальную жидкость и достигает максимальной концентрации за 3-6 часов после введения.

Препарат метаболизируется в печени: 50% активного вещества подвергается метаболизму во время "первого прохождения" через печень; площадь под кривой «концентрация-время» (AUC) в 2 раза меньше после перорального приема препарата, чем после парентерального введения той же дозы. Метаболизм происходит в результате многократного или однократного гидроксирования и конъюгирования. В метаболизме принимает участие ферментная система P450 CYP2C9. Фармакологическая активность метаболитов ниже, чем диклофенака.

Препарат выводится в основном через почки. Системный клиренс составляет 260 мл/мин. Период полувыведения составляет 1-2 часа. 60% введенной дозы выводится через почки в виде метаболитов и менее 1% - в неизменном виде. Остальная часть препарата выводится в виде метаболитов с желчью.

Отмечено, что фармакокинетика препарата не меняется в зависимости от возраста пациента.

На фоне многократного введения диклофенака не происходит изменения фармакокинетики.

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

Внутримышечные инъекции при:

- Воспалительные заболевания опорно-двигательного аппарата (ревматоидный артрит, псориазический, ювенильный хронический артрит, анкилозирующий спондилоартрит; острый подагрический артрит).
- Воспалительные процессы в малом тазу, аднексит, первичная альгодисменорея, почечная или желчная колика, проктит.
- Дегенеративные заболевания опорно-двигательного аппарата (деформирующий остеоартроз, остеохондроз).
- Болевой синдром (люмбаго, ишиас, невралгия, миалгия, тендовагинит, бурсит, ревматическое поражение мягких тканей, зубная и головная боль, мигрень и боли умеренной выраженности др. генеза).
- Посттравматический болевой синдром, сопровождающийся воспалением.
- Послеоперационная боль.
- В составе комплексной терапии инфекционно-воспалительных заболеваний уха, горла, носа с выраженным болевым синдромом (фарингит, тонзиллит, отит).
- Лихорадочный синдром.

Внутривенные капельные инфузии

Профилактика и лечение послеоперационных болей.

Противопоказания

- Гиперчувствительность к НПВП (в том числе ацетилсалициловой кислоты), «аспириновая» астма,
- эрозивно-язвенные поражения ЖКТ (в фазе обострения), кровотечения из ЖКТ,
- угнетение костномозгового кроветворения,
- различные нарушения гемостаза (в т.ч. гемофилия),
- при состояниях, ассоциированных с высоким риском кровотечений (в том числе в анамнезе),
- детский возраст до 15 лет,
- беременность,
- период лактации,

С осторожностью: анемия, бронхиальная астма, застойная сердечная недостаточность, артериальная гипертензия, отечный синдром, печеночная или почечная недостаточность, алкоголизм, дивертикулит, эрозивно-язвенные заболевания желудочно-кишечного тракта вне обострения, сахарный диабет, послеоперационный период, индуцируемая острая печеночная порфирия, пожилой возраст.

Способ применения и дозы

Препарат вводится внутримышечно или внутривенно капельно в виде инфузии. Вводится не более 2-х дней. В случае необходимости продления лечения пациентам назначают препарат в виде таблеток или суппозиторий.

Внутримышечные инъекции:

пациентам при острых болях назначают 75 мг ежедневно внутримышечно. В случае необходимости (желчная или почечная колика) ежедневная доза может быть увеличена до 150 мг (по 1 ампуле 2 раза в день)

Внутривенные инфузии: Препарат вводится капельно в виде инфузий. Непосредственно перед введением содержимое 1 ампулы (75 мг) следует развести в 100-500 мл 0.9% раствора NaCl или 5% раствора декстрозы (предварительно добавив в инфузионные растворы раствор натрия бикарбоната - 0.5 мл 8.4%). Приготовленные растворы для инфузии должны быть прозрачными.

При лечении послеоперационного болевого синдрома средней и сильной степени выраженности препарат вводят в дозе 75 мг в течение 30 - 120 мин. При необходимости, препарат может вводиться повторно через несколько часов. Однако доза препарата не должна превышать 150 мг за 24 часа.

С целью предотвращения послеоперационных болей проводят инфузию "ударной" дозой препарата 25-50 мг в течение 15-60 мин. В дальнейшем инфузию продолжают со скоростью 5 мг/ч до достижения максимальной суточной дозы 150 мг.

Побочное действие

Со стороны пищеварительной системы

- часто (>1 случая на 100 назначений): НПВП-гастропатия (гастралгия и дискомфорт в эпигастриальной области, тошнота, рвота, ощущение переполнения желудка, отрыжка, изжога, диарея, абдоминальная боль, метеоризм), эрозивно-язвенные поражения ЖКТ (включая поражение пищевода, желудка, пептическую язву, множественные поражения ЖКТ); перфорация стенки кишечника (интенсивная режущая боль, жжение в эпигастриальной области, кровавый стул, мелена, гематемезис), кровотечение ЖКТ (гематемезис, мелена), неспецифический колит с кровотечением, сухость во рту, запоры, панкреатит, токсический гепатит.
- не часто (< 1 случая на 100 назначений, но не > 1 случая на 1000 назначений) – рвота, колит или его обострение, снижение аппетита или анорексия, сухость, болезненность слизистой оболочки полости рта, спазмы, афтозный стоматит (эрозии, язвы, белый налет на слизистой оболочке полости рта)

Со стороны нервной системы

- часто (> 1 случая на 100 назначений): головная боль, головокружение
- не часто (< 1 случая на 100 назначений, но не > 1 случая на 1000 назначений): судороги, асептический менингит, снижение памяти, депрессия, психотические реакции, периферическая полинейропатия (гипестезия, тремор, боль или слабость в мышцах рук и ног), сонливость, раздражительность и нервозность, чувство страха, бессонница, повышенная утомляемость.

Со стороны органов чувств:

- часто (> 1 случая на 100 назначений): токсическая амблиопия, снижение остроты зрения, диплопия, скотома, снижение слуха и др. нарушения слуха, звон в ушах.

Со стороны кожных покровов:

- часто (> 1 случая на 100 назначений): кожный зуд, кожная сыпь (преимущественно эритематозная и уртикарная), гиперемия кожи;

- не часто (< 1 случая на 100 назначений, но не > 1 случая на 1000 назначений): многоформная экссудативная эритема, в т.ч. синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла), фотодерматит (тяжелые солнечные ожоги, кожная сыпь, нарушение пигментации);
- редко (< 0,001% случаев): в месте в/м введения возможны: жжение; инфильтрат, асептический некроз, некроз жировой ткани. В отдельных случаях в месте инъекции может развиваться некроз.

Со стороны мочеполовой системы:

- часто (> 1 случая на 100 назначений): задержка жидкости;
- не часто (< 1 случая на 100 назначений, но не > 1 случая на 1000 назначений): повторяющиеся вагинальные боли неясного генеза, дисменорея, гематурия, цистит, поллакиурия, протеинурия, интерстициальный нефрит, нефротический синдром, олигурия или анурия, снижение функции почек или ее усугубление периферические отеки.

Со стороны органов кроветворения

- не часто (< 1 случая на 100 назначений, но не > 1 случая на 1000 назначений): агранулоцитоз, гемолитическая анемия, апластическая анемия, анемия, связанная с внутренними кровотечениями, экхимозы, лейкопения, нейтропения тромбоцитопения с пурпурой или без нее.

Со стороны дыхательной системы

- не часто (< 1 случая на 100 назначений, но не > 1 случая на 1000 назначений): одышка.

Со стороны сердечно-сосудистой системы

- часто (>1 случай на 100 назначений): повышение АД;
- не часто (< 1 случая на 100 назначений, но не > 1 случая на 1000 назначений): аритмии, кардиалгия, коллапс;
- редко (< 0,001% случаев): боль за грудиной, усугубление застойной сердечной недостаточности.

Эндокринные нарушения

- редко (< 0,001% случаев): снижение массы тела.

Аллергические реакции

- редко (< 0,001% случаев): анафилаксия и анафилактоидные реакции (фокальная гиперемия, крапивница, кожный зуд, одышка, отек Квинке в области век или параорбитальных тканей, губ, языка, голосовой щели, давящей боли за грудиной, хрипы, анафилактический шок (обычно развивается стремительно), бронхоспастические аллергические реакции.

Передозировка

Симптомы: симптоматика со стороны ЖКТ, гипотензия, нефротоксичность (вплоть до острой почечной недостаточности), нарушения со стороны ЦНС (от вялости и сонливости до судорог и комы).

Лечение: симптоматическое и поддерживающее, направленное на устранение симптоматики.

Форсированный диурез, гемодиализ малоэффективны.

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 нестероидных противовоспалительных препаратов и глюкокортикостероидных средств (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 гипогликемический эффект гипогликемических средств.

Цефамандол, цефеперзон, цефотетан, вальпроевая кислота и пликсамицин увеличивают частоту развития гипопротромбинемии.

Циклоспорин и препараты золота повышают влияние диклофенака на синтез простагландина в почках, что проявляется повышением нефротоксичности.

Одновременное назначение с этанолом, колхицином, кортикотропином и препараты зверобоя повышают риск развития кровотечений в желудочно-кишечном тракте.

Препараты, вызывающие фотосенсибилизацию, повышают сенсибилизирующее действие диклофенака к ультрафиолетовому облучению.

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

Особые указания

В период лечения препаратом следует проводить систематический контроль картины периферической крови, функции печени, почек, исследование кала на наличие крови.

Пациентам, принимающим препарат, необходимо воздерживаться от видов деятельности, требующих повышенного внимания и быстрых психических и двигательных реакций, употребления алкоголя.

Упаковка

5 ампул по 3 мл помещают в прозрачный поддон и вместе с инструкцией по применению вкладывают в картонную пачку.

Срок годности

5 лет

Не использовать по окончании срока годности

Условия хранения

Список Б

При температуре 15-25°C, в местах, недоступных для детей.

Условия отпуска из аптек

По рецепту

Производитель

Плива Хрватска д.о.о.

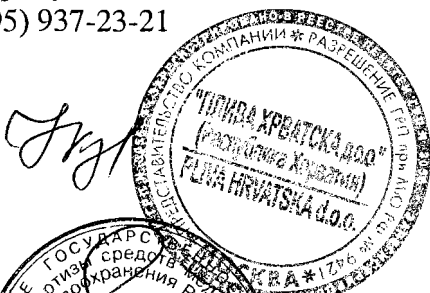
Прилаз баруна Филиповича 25, 10 000 Загреб, Республика Хорватия

Представительство компании «Плива Хрватска д.о.о.»

117418 г. Москва, ул. Новочеремушкинская, д. 61

тел. (095) 937-23-20; факс (095) 937-23-21

Представитель фирмы



Н.А Кузнецова

Директор Института ИДЭКЛ
Профессор



В.В. Чельцов