Диклобене



Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр Википедия Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

НПВС, производное фенилуксусной кислоты. Оказывает выраженное противовоспалительное, анальгезирующее и умеренное жаропонижающее действие. Механизм действия связан с угнетением активности ЦОГ - основного фермента метаболизма арахидоновой кислоты, являющейся предшественником простагландинов, которые играют главную роль в патогенезе воспаления, боли и лихорадки. Анальгезирующее действие обусловлено двумя механизмами: периферическим (опосредованно, через подавление синтеза простагландинов) и центральным (за счет ингибирования синтеза простагландинов в центральной и периферической нервной системе).

Ингибирует синтез протеогликана в хрящах.

При ревматических заболеваниях уменьшает боли в суставах в покое и при движении, а также утреннюю скованность и припухлость суставов, способствует увеличению объема движений. Уменьшает посттравматические и послеоперационные боли, а также воспалительный отек.

Подавляет агрегацию тромбоцитов. При длительном применении оказывает десенсибилизирующее действие.

При местном применении в офтальмологии уменьшает отек и боль при воспалительных процессах неинфекционной этиологии.

Фармакокинетика

После приема внутрь абсорбируется из ЖКТ. Прием пищи замедляет скорость всасывания, степень абсорбции при этом не меняется. Около 50% активного вещества метаболизируется при "первом прохождении" через печень. При ректальном введении абсорбция происходит медленнее. Время достижения C_{max} в плазме после приема внутрь составляет 2-4 ч в зависимости от применяемой лекарственной формы, после ректального введения - 1 ч, в/м введения - 20 мин. Концентрация активного вещества в плазме находится в линейной зависимости от величины применяемой дозы.

Не кумулирует. Связывание с белками плазмы составляет 99.7% (преимущественно с альбумином). Проникает в синовиальную жидкость, C_{max} достигается на 2-4 ч позже, чем в плазме.

В значительной степени метаболизируется с образованием нескольких метаболитов, среди которых два фармакологически активны, но в меньшей степени, чем диклофенак.

Системный клиренс активного вещества составляет примерно 263 мл/мин. $T_{1/2}$ из плазмы составляет 1-2 ч, из синовиальной жидкости - 3-6 ч. Приблизительно 60% дозы выводится в виде метаболитов почками, менее 1% экскретируется с мочой в неизмененном виде, остальная часть выводится в виде метаболитов с желчью.

Показания к применению:

Суставной синдром (ревматоидный артрит, остеоартрит, анкилозирующий спондилит, подагра), дегенеративные и хронические воспалительные заболевания опорно-двигательного аппарата (остеохондроз, остеоартроз, периартропатии), посттравматическое воспаление мягких тканей и опорно-двигательного аппарата (растяжения, ушибы). Боли в позвоночнике, невралгии, миалгии, артралгии, болевой синдром и воспаление после операций и травм, болевой синдром при подагре, мигрень, альгодисменорея, болевой синдром при аднексите, проктите, колики (желчная и почечная), болевой синдром при инфекционно-воспалительных заболеваниях ЛОР-органов.

Для местного применения: ингибирование миоза во время операции по поводу катаракты, профилактика цистоидного макулярного отека, связанного с удалением и имплантацией хрусталика, воспалительные процессы глаза неинфекционной природы, посттравматический воспалительный процесс при проникающих и непроникающих ранениях глазного яблока.

Относится к болезням:

- Аднексит
- Альгодисменорея
- Артралгия
- Артрит
- Артроз
- Болевой синдром
- Воспаление
- Инфекции
- Катаракта
- Миалгия
- Мигрень
- Невралгия
- Неврит
- Остеоартрит
- Остеоартроз
- Остеохондроз
- Периартропатии
- Подагра
- Проктит
- Растяжение
- Ревматоидный артрит
- Травмы
- Ушиб
- Ушибы
- Цистит

Противопоказания:

Эрозивно-язвенные поражения ЖКТ в фазе обострения, "аспириновая триада", нарушения кроветворения неясной этиологии, повышенная чувствительность к диклофенаку и компонентам применяемой лекарственной формы, или другим НПВС.

Способ применения и дозы:

Для приема внутрь для взрослых разовая доза составляет 25-50 мг 2-3 раза/сут. Частота приема зависит от применяемой лекарственной формы, тяжести течения заболевания и составляет 1-3 раза/сут, ректально - 1 раз/сут. Для лечения острых состояний или купирования обострения хронического процесса применяют в/м в дозе 75 мг.

Для детей старше 6 лет и подростков суточная доза составляет 2 мг/кг.

Наружно применяют в дозе 2-4 г (в зависимости от площади болезненного участка) на пораженное место 3-4 раза/сут.

При применении в офтальмологии частота и длительность введения определяются индивидуально.

Максимальная суточная доза для взрослых при приеме внутрь составляет 150 мг/сут.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, анорексия, боли и неприятные ощущения в эпигастральной

области, метеоризм, запор, диарея; в отдельных случаях - эрозивно-язвенные поражения, кровотечения и перфорации ЖКТ; редко - нарушение функции печени. При ректальном введении в единичных случаях отмечались воспаление толстой кишки с кровотечением, обострение язвенного колита.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: головокружение, головная боль, возбуждение, бессонница, раздражительность, чувство усталости; редко - парестезии, нарушения зрения (расплывчатость, диплопия), шум в ушах, расстройства сна, судороги, раздражительность, тремор, психические нарушения, депрессия.

Со стороны системы кроветворения: редко - анемия, лейкопения, тромбоцитопения, агранулоцитоз.

Со стороны мочевыделительной системы: редко - нарушение функции почек; у предрасположенных пациентов возможны отеки.

Дерматологические реакции: редко - выпадение волос.

Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд; при применении в форме глазных капель - зуд, покраснение, фотосенсибилизация.

Местные реакции: в месте в/м введения возможно жжение, в отдельных случаях - образование инфильтрата, абсцесса, некроз жировой ткани; при ректальном введении возможны местное раздражение, появление слизистых выделений с примесью крови, болезненная дефекация; при наружном применении в редких случаях - зуд, покраснение, сыпь, жжение; при местном применении в офтальмологии возможны преходящее чувство жжения и/или временная нечеткость зрения сразу после закапывания.

При длительном наружном применении и/или нанесении на обширные поверхности тела возможны системные побочные эффекты вследствие резорбтивного действия диклофенака.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение при беременности и в период лактации возможно в случаях, когда потенциальная польза для матери превышает потенциальный риск для плода или новорожденного.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с диклофенаком антигипертензивных лекарственных средств возможно ослабление их действия.

Имеются единичные сообщения о возникновении судорог у больных, принимавших одновременно НПВС и антибактериальные препараты хинолонового ряда.

При одновременном применении с ГКС повышается риск возникновения побочных эффектов со стороны пищеварительной системы.

При одновременном применении диуретиков возможно уменьшение диуретического эффекта. При одновременном применении с калийсберегающими диуретиками возможно повышение концентрации калия в крови.

При одновременном применении с другими НПВС возможно повышение риска развития побочных эффектов.

Имеются сообщения о развитии гипогликемии или гипергликемии у больных с сахарным диабетом, применявших диклофенак одновременно с гипогликемическими препаратами.

При одновременном применении с ацетилсалициловой кислотой возможно уменьшение концентрации диклофенака в плазме крови.

Хотя в клинических исследованиях не установлено влияния диклофенака на действие антикоагулянтов, описаны отдельные случаи возникновения кровотечений при одновременном применении диклофенака и варфарина.

При одновременном применении возможно повышение концентрации дигоксина, лития и фенитоина в плазме крови.

Всасывание диклофенака из ЖКТ уменьшается при одновременном применении с колестирамином, в меньшей степени - с колестиполом.

При одновременном применении возможно повышение концентрации метотрексата в плазме крови и усиление его токсичности.

При одновременном применении диклофенак может не оказывать влияния на биодоступность морфина, однако концентрация активного метаболита морфина может оставаться повышенной в присутствии диклофенака, что увеличивает риск развития побочных эффектов метаболита морфина, в т.ч. угнетения дыхания.

При одновременном применении с пентазоцином описан случай развития большого судорожного припадка; с рифампицином - возможно уменьшение концентрации диклофенака в плазме крови; с цефтриаксоном - повышается экскреция цефтриаксона с желчью; с циклоспорином - возможно повышение нефротоксичности циклоспорина.

Особые указания и меры предосторожности:

С особой осторожностью применяют при заболеваниях печени, почек, ЖКТ в анамнезе, диспептических явлениях, бронхиальной астме, артериальной гипертонии, сердечной недостаточности, сразу после серьезных хирургических вмешательств, а также у пациентов пожилого возраста.

При указаниях в анамнезе на аллергические реакции на НПВС и сульфиты диклофенак применяют только в неотложных случаях. В процессе лечения необходим систематический контроль функции печени и почек, картины периферической крови.

Не рекомендуется ректальное применение у пациентов с заболеваниями аноректальной области или аноректальными кровотечениями в анамнезе. Наружно следует применять только на неповрежденных участках кожи.

Необходимо избегать попадания диклофенака в глаза (за исключением глазных капель) или на слизистые оболочки. Пациенты, использующие контактные линзы, должны применять глазные капли не ранее чем через 5 мин после снятия линз.

Не рекомендуется применять у детей в возрасте до 6 лет.

В период лечения лекарственными формами для системного применения не рекомендуется употребление алкоголя.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения возможно снижение скорости психомоторных реакций. При ухудшении четкости зрения после применения глазных капель не следует управлять автомобилем и заниматься другими потенциально опасными видами деятельности.

При нарушениях функции почек

С особой осторожностью применяют при заболеваниях почек в анамнезе.

При нарушениях функции печени

С особой осторожностью применяют при заболеваниях печени в анамнезе.

Применение в пожилом возрасте

С особой осторожностью применяют у пациентов пожилого возраста.

Применение в детском возрасте

Не рекомендуется применять у детей в возрасте до 6 лет.

Источник: http://drugs.thead.ru/Diklobene