Диклофенак



Код АТХ:

- M01AB05

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Диклофенак

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые кишечнорастворимой оболочкой	**1 таб.**
диклофенак натрия	25 мг

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (5) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (10) - пачки картонные.
20 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
20 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
20 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
30 шт. - банки темного стекла (1) - пачки картонные.
30 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Ненаркотические анальгетики, включая нестероидные и другие противовоспалительные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Диклофенак обладает противовоспалительным, обезболивающим и жаропонижающим действием. Неизбирательно угнетая циклооксигеназу 1 и 2, нарушает метаболизм арахидоновой кислоты, уменьшает количество простагландинов в очаге воспаления. 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 ч и снижает C_{max} на 40%. После перорального приема 25 мг C_{max} 1.0 мкг/мл достигается через 2-3 ч. Концентрация в плазме находится в линейной зависимости от величины вводимой дозы.

Изменения фармакокинетики диклофенака на фоне многократного введения не отмечается, не кумулирует.

Биодоступность - 50%. Связь с белками плазмы - более 99% (большая часть связывается с альбуминами). Проникает в синовиальную жидкость: C_{max} в синовиальной жидкости наблюдается на 2-4 ч позже, чем в плазме. $T_{1/2}$ 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 синовильной 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 P450 CYP2C9. Фармакологическая активность метаболитов ниже, чем диклофенака.

Системный клиренс составляет 350 мл/мин, обьем распределения - 550 мл/кг, $T_{1/2}$ из плазмы -2 ч. 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 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:

— заболевания опорно-двигательного аппарата (ревматоидный артрит, псориатический, ювенильный хронический артрит, анкилозирующий спондилоартрит; подагрический артрит, ревматическое поражение мягких тканей, остеоартроз периферических суставов и позвоночника, в т.ч. с радикулярным синдромом, тендовагинит, бурсит);

— 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);

— лихорадочный синдром.

Относится к болезням:

- Аднексит
- Альгодисменорея
- Анкилозирующий спондилоартрит
- Артрит
- Артроз
- Болевой синдром
- Бурсит
- Воспаление
- Головная боль
- Зубная боль
- Инфекции
- Лихорадка
- Люмбоишиалгия
- Миалгия

- Мигрень
- Невралгия
- Неврит
- Остеоартрит
- Остеоартроз
- Отит
- Подагра
- Проктит
- Псориаз
- Радикулит
- Ревматизм
- Ревматоидный артрит
- Спондилоартрит
- Тендовагинит
- Тонзиллит
- Фарингит

Противопоказания:

— эрозивно-язвенные поражения ЖКТ (в фазе обострения);

— кровотечения из ЖКТ;

— "аспириновая" астма;

— нарушения кроветворения;

— нарушения гемостаза (в т.ч. гемофилия);

— беременность;

— детский возраст (до 6 лет);

— период лактации;

— гиперчувствительность (в т.ч. к др. НПВП).

С осторожностью: анемия, бронхиальная астма, застойная сердечная недостаточность, артериальная гипертензия, отечный синдром, печеночная или почечная недостаточность, алкоголизм, воспалительные заболевания кишечника, эрозивно-язвенные заболевания ЖКТ вне обострения, сахарный диабет, состояние после обширных хирургических вмешательств, индуцируемая порфирия, пожилой возраст, дивертикулит, системные заболевания соединительной ткани.

Способ применения и дозы:

Внутрь, не разжевывая, во время или после еды, запивая небольшим количеством воды. Взрослым и подросткам с 15 лет - по 25-50 мг 2-3 раза/сут. 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) суточная доза до 2 мг/кг массы тела, разделенная на 2-3 приема. При ювенильном ревматоидном артрите суточная доза может быть увеличена до 3 мг/кг массы тела.

Ориентировочный режим применения препарата представлен в таблице:

Возраст (масса тела, кг)	Разовая доза (число таблеток, [мг])	Суточная доза (число таблеток, [мг])
6-7 лет (20-24)	1 [25]	1 [25]
8-11 лет (25-37)	1 [25]	2-3 [50-75]
12-14 лет (38-50)	1-2 [25-50]	3-4 [75-100]
Старше 15 и взрослые	1-2 [25-50]	2-6 [50-150]

Побочное действие:

ЖКТ:

чаще 1% - абдоминальные боли, ощущение вздутия живота, диарея, тошнота, запор, метеоризм, повышение уровня

"печеночных" ферментов, пептическая язва с возможными осложнениями (кровотечение, перфорация), желудочно-кишечное кровотечение;

реже 1% - рвота, желтуха, мелена, появление крови в кале, поражение пищевода, афтозный стоматит, сухость слизистых оболочек (в том числе рта), гепатит (возможно молниеносное течение), некроз печени, цирроз, гепаторенальный синдром, изменение аппетита, панкреатит, холецистопанкреатит, колит.

Нервная система:

чаще 1% - головная боль, головокружение;

реже 1% - нарушение сна, сонливость, депрессия, раздражительность, асептический менингит (чаще у больных системной красной волчанкой и другими системными заболеваниями соединительной ткани), судороги, общая слабость, дезориентация, кошмарные сновидения, ощущение страха.

Органы чувств:

чаще 1 % - шум в ушах,

реже 1% - нечеткость зрения, диплопия, нарушение вкуса, обратимое или необратимое снижение слуха, скотома.

Кожные покровы:

чаще 1% - кожный зуд, кожная сыпь;

реже 1% - алопеция, крапивница, экзема, токсический дерматит, многоформная экссудативная эритема (в т.ч. синдром Стивенса-Джонсона), токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла), повышенная фоточувствительность, мелкоточечные кровоизлияния.

Мочеполовая система:

чаще 1% - задержка жидкости,

реже 1% - нефротический синдром, протеинурия, олигурия, гематурия, интерстициальный нефрит, папиллярный некроз, острая почечная недостаточность, азотемия

Органы кроветворения и иммунная система:

реже 1% - анемия (в том числе гемолитическая и апластическая анемии), лейкопения, тромбоцитопения, эозинофилия, агранулоцитоз, тромбоцитопеническая пурпура, ухудшение течения инфекционных процессов (в том числе развитие некротического фасциита).

Дыхательная система:

реже 1% - кашель, бронхоспазм, отек гортани, пневмонит.

Сердечно-сосудистая система:

реже 1% - повышение артериального давления; застойная сердечная недостаточность, экстрасистолия, боль в грудной клетке.

Аллергические реакции:

реже 1% - анафилактоидные реакции, анафилактический шок (обычно развивается стремительно), отек губ и языка, аллергический васкулит.

Передозировка:

Симптомы: рвота, головокружение, головная боль, одышка, помутнение сознания, у детей - миоклонические судороги, тошнота, абдоминальная боль, кровотечения, нарушение функции печени и почек.

Лечение: промывание желудка, введение активированного угля, симптоматическая терапия, форсированный диурез. Гемодиализ малоэффективен.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан при беременности. При необходимости применения препарата в период лактации следует решить вопрос о прекращении грудного вскармливания.

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 (алтеплаза, стрептокиназа, урокиназа) - риск кровотечений (чаще из желудочно-кишечного тракта).

Уменьшает эффекты гипотензивных и снотворных средств.

Увеличивает вероятность возникновения побочных эффектов других НПВП и глюкокортикостероидных средств (кровотечения в ЖКТ), 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 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.

Особые указания и меры предосторожности:

В период лечения препаратом следует проводить систематический контроль 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.

При нарушениях функции почек

С осторожностью: почечная недостаточность.

При нарушениях функции печени

С осторожностью: печеночная недостаточность.

Применение в пожилом возрасте

Применять с осторожностью в пожилом возрасте.

Применение в детском возрасте

Противопоказан детям до 6 лет.

Условия хранения:

Список Б. При температуре не выше 25°С. В сухом, защищенном от света месте, недоступном для детей.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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