Диклофенак-Акри Ретард



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 ретард, покрытые оболочкой светло-коричневого или розовато-коричневого цвета, пленочной; круглые, двояковыпуклые, допускается наличие шероховатости; на поперечном разрезе - белого с кремоватым или желтоватым оттенком цвета.

	1 таб.
диклофенак натрия	100 мг

Вспомогательные вещества: лудипресс, оксипропилметилцеллюлоза, магния стеарат, аэросил, стеариновая кислота.

Состав оболочки: оксипропилметилцеллюлоза, глицерол, титана диоксид, полиэтиленгликоль, железа оксид.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Ненаркотические анальгетики, включая нестероидные и другие противовоспалительные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Нестероидный противовоспалительный препарат (НПВП), производное фенилуксусной кислоты. Окалывает противовоспалительное, анальгезирующее, жаропонижающее и антиагрегантное действие. Неизбирательно угнетая циклоксигеназы 1 и 2, нарушает метаболизм арахидоновой кислоты, уменьшает количество простагландинов. в очаге воспаления, подавляет экссудативную и пролиферативную фазы воспаления.

При ревматических заболеваниях противовоспалительное и анальгезирующее действие диклофенака способствует значительному уменьшению выраженности боли, утренней скованности, припухлости суставов, что улучшает состояние сустава.

При травмах, в послеоперационном периоде диклофенак уменьшает болевые ощущения и воспалительный отек.

Фармакокинетика

Абсорбция - быстрая и полная, пища замедляет скорость абсорбции. 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. В результате замедленного высвобождения активного вещества C_{max} в плазме ниже той, которая образуется при введении препарата короткого действия; однако она остается высокой в течение длительного времени после приема. C_{max} - 0.5-1 мкг/мл, время достижения C_{max} - 5 ч после приема 100 мг таблетки пролонгированного действия. Биодоступность - 50%. Связывание 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 (концентрации активного вещества в синовиальной жидкости через 4-6 ч после введения препарата выше, чем в плазме, и остаются выше еще в течение 12 ч).

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 диклофенака также участвует изофермент CYP2C9. Фармакологическая активность метаболитов ниже, чем диклофенака.

Системный клиренс составляет 260 мл/мин. $T_{1/2}$ из плазмы - 1-2 ч. 60% введенной дозы выводится в виде метаболитов через почки; менее 1% выводится в неизмененном виде, остальная часть дозы выводится в виде метаболитов с желчью. У больных с выраженными нарушениями функции почек увеличивается выведение метаболитов с желчью, при этом увеличения их концентрации в крови не наблюдается. У больных с хроническим гепатитом или компенсированным циррозом печени фармакокиинетические параметры такие же, как и у пациентов без заболеваний печени.

Показания к применению:

— воспалительные и дегенеративные заболевания опорно-двигательного аппарата: ревматоидный артрит, псориатический артрит, ювенильный хронический артрит, анкилозирующий спондилит (болезнь Бехтерева); подагрический артрит (при остром приступе подагры предпочтительны быстродействующие лекарственные формы), ревматическое поражение мягких тканей, остеоартроз периферических суставов и позвоночника, в том числе с радикулярным синдромом, тендовагинит, бурсит.

Препарат предназначен для симптоматической терапии, уменьшения боли и воспаления на момент использования, на прогрессирование заболевания не влияет.

— болевой синдром слабой или умеренной выраженности: люмбаго, ишиас, невралгия, миалгия; посттравматический болевой синдром, сопровождающийся воспалением, послеоперационная боль, головная боль, мигрень, зубная боль, альгодисменорея, аднексит, проктит;

— в составе комплексной терапии инфекционно-воспалительных заболеваний ЛОР органов с выраженным болевым синдромом (фарингит, тонзиллит, отит).

Относится к болезням:

- Аднексит
- Альгодисменорея
- Артрит
- Артроз
- Болевой синдром
- Бурсит
- Воспаление
- Головная боль
- Зубная боль
- Инфекции
- Ишиас
- Люмбаго
- Миалгия
- Мигрень
- Невралгия
- Неврит
- Остеоартрит
- Остеоартроз
- Отит

- Подагра
- Проктит
- Псориаз
- Радикулит
- Ревматизм
- Ревматоидный артрит
- Тендовагинит
- Тонзиллит
- Фарингит

Противопоказания:

— полное или неполное сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза слизистой оболочки носа и околоносовых пазух и непереносимости ацетилсалициловой кислоты или других нестероидных противовоспалительных препаратов (в т.ч. в анамнезе);

— эрозивно-язвенные поражения слизистой желудка или двенадцатиперстной кишки, активное желудочно-кишечное кровотечение;

— воспалительные заболевания кишечника (язвенный колит, болезнь Крона) в фазе обострения;

— период после проведения аортокоронарного шунтирования;

— III триместр беременности, период лактации;

— 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, подтвержденная гиперкалиемия;

— детский возраст до 18 лет;

— наследственная непереносимость лактозы, нарушение всасывания глюкозы-галактозы, недостаточность лактазы;

— повышенная чувствительность к активному веществу (в т.ч. к другим НПВП) или вспомогательным веществам.

С осторожностью

Анемия, бронхиальная астма, цереброваскулярные заболевания, ишемическая болезнь сердца, хроническая сердечная недостаточность, артериальная гипертензия, заболевания периферических артерий, отечный синдром, печеночная и почечная недостаточность (клиренс креатинина 30-60 мл/мин), дислипидемия/гиперлипидемия, сахарный диабет, курение, воспалительные заболевания кишечника, состояния 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, алкоголизм, тяжелые соматические заболевания.

Одновременный прием глюкокортикостероидов (например, преднизолон), антикоагулянтов (например, варфарин), антиагрегантов (например, ацетилсалициловая кислота, клопидог-рел), селективных ингибиторов обратного захвата серотонина (например, циталопрам, флуоксетин, пароксетин, сертралин).

Способ применения и дозы:

Внутрь, не разжевывая, во время или после еды, запивая небольшим количеством воды. **Взрослым** - по 100 мг 1 раз в сутки. При *альгодисменорее и приступах мигрени* - до 200 мг/сут на протяжении не более 1-2 дней. При приеме 100 мг таблеток пролонгированного действия при необходимости увеличения суточной дозы до 150 мг/сут можно дополнительно принимать по 1 обычной таблетке (50 мг). Максимальная суточная доза - 150 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 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. парестезия), 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 (нечеткость 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 алластическая анемия, агранулоцитоз.

Аллергические реакции: анафилактические/анафилактоидные реакции, включая выраженное снижение артериального давления 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 (включая одышку); очень редко - пневмонит.

Со стороны кожных покровов: часто - кожная сыпь; редко - крапивница; очень редко - буллезные высыпания, эритема, 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, эпигастральная боль, диарея, головокружение, шум в ушах, судороги, повышение АД, угнетение дыхания, при значительной передозировке - острая почечная недостаточность, гепатотоксическое действие.

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 (в связи со значительной связью с белками и интенсивным метаболизмом).

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан в III триместре беременности и в период лактации.

С осторожностью - в I и II триместрах.

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, стрептокина-за, урокиназа) - риск кровотечений (чаще из ЖКТ).

Уменьшает эффекты гипотензивных и снотворных средств.

Увеличивает вероятность возникновения побочных эффектов других НПВП и ГКС (желудочно-кишечные кровотечения), токсичность метотрексата и нефротоксичность циклоспорина.

Ацетилсалициловая кислота снижает концентрацию диклофенака в крови.

Парацетамол повышает риск развития нефротоксичных эффектов диклофенака.

Уменьшает эффект гипогликемических лекарственных средств.

Цефамандол, цефаперазон, 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 использование с этанолом, колхицином, кортикотропином, селективными ингибиторами обратного захвата серотонина и препаратами зверобоя продырявленного повышаетриск развития кровотечений в ЖКТ.

Диклофенак усиливает действие препаратов, вызывающих фотосенсибилизацию.

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

Антибактериальные лекарственные средства из группы хинолона - риск развития судорог.

Особые указания и меры предосторожности:

Для быстрого достижения желаемого терапевтического эффекта принимают за 30 мин до приема пищи. В остальных случаях принимают до, во время или после еды, не разжевывая, заливая 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 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 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.

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

Пациентам, принимающим препарат, необходимо воздерживаться от употребления алкоголя.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Необходимо воздерживаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Противопоказан:

— выраженная почечная недостаточность (клиренс креатинина менее 30 мл/мин), прогрессирующие заболевания почек, подтвержденная гиперкалиемия.

С осторожностью - почечная недостаточность (клиренс креатинина 30-60 мл/мин).

При нарушениях функции печени

Противопоказан:

— выраженная печеночная недостаточность или активное заболевание печени.

С осторожностью - печеночная недостаточность.

Применение в детском возрасте

Противопоказан детям до 18 лет.

Условия хранения:

Список Б. В сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25°C. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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