Диклофенак (Ортофен)



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.
30 шт. - банки темного стекла (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Ненаркотические анальгетики, включая нестероидные и другие противовоспалительные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Диклофенак обладает противовоспалительным, обезболивающим, анальгезирующим 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. Как все НПВП, препарат оказывает антиагрегатную активность.

Фармакокинетика

Абсорбция - быстрая и полная, пища замедляет скорость абсорбции на 1-4 ч и снижает C_{max} диклофенака в плазме 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, диклофенак 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 диклофенака в синовильной жидкости с его клинической эффективностью 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 изофермент CYP2C9. Фармакологическая активность метаболитов ниже, чем диклофенака. Системный клиренс составляет 350 мл/мин, V_d - 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:

Воспалительные и дегенеративные заболевания опорно-двигательного аппарата, в том числе ревматоидный, псориатический, ювенильный хронический артрит, анкилозирующий спондилит (болезнь Бехтерева), остеоартроз, подагрический артрит, бурсит, тендовагинит. Препарат предназначен для симптоматической терапии, уменьшения боли и воспаления на момент использования, на прогрессирование заболевания не влияет.

Болевой синдром: головная (в том числе мигрень) и зубная боль, люмбаго, ишиалгия, оссалгия, невралгия, миалгия, артралгия, радикулит, при онкологических заболеваниях, посттравматический и послеоперационный болевой синдром, сопровождающийся воспалением.

Альгодисменорея: воспалительные процессы в малом тазу, в том числе аднексит.

Инфекционно-воспалительные заболевания ЛОР - органов с выраженным болевым синдромом (в составе комплексной терапии): фарингит, тонзиллит, отит.

Относится к болезням:

- Аднексит
- Артралгия
- Артрит
- Артроз
- Болевой синдром
- Бурсит
- Воспаление
- Зубная боль
- Ишиалгия
- Люмбаго
- Миалгия
- Мигрень
- Невралгия
- Неврит
- Остеоартрит
- Остеоартроз
- Отит
- Подагра
- Псориаз
- Радикулит
- Тендовагинит
- Тонзиллит
- Фарингит

Противопоказания:

Гиперчувствительность (в том числе к другим НПВП), полное или неполное сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза носа и околоносовых пазух и непереносимости ацетилсалициловой кислоты (АСК) или других НПВП (в том числе в анамнезе), эрозивно-язвенные поражения желудка и 12-перстной кишки, активное

желудочно-кишечное кровотечение, воспалительные заболевания кишечника, тяжелая печеночная и сердечная недостаточность; период после проведения аортокоронарного шунтирования; тяжёлая почечная недостаточность (клиренс креатинина (КК) менее 30 мл/мин), прогрессирующие заболевания почек, активное заболевание печени, подтверждённая гиперкалиемия, беременность (III триместр), период лактации, детский возраст (до 6 лет - для таблеток, покрытых кишечнорастворимой оболочкой 25 мг).

Наследственная непереносимость лактозы, нарушение всасывания глюкозы-галактозы, недостаточность лактазы.

С осторожностью. Язвенная болезнь желудка и 12-перстной кишки, язвенный колит, болезнь Крона, заболевания печени в анамнезе, печеночная порфирия, хроническая сердечная недостаточность, артериальная гипертензия, значительное снижение объема циркулирующей крови (ОЦК) (в том числе после обширного хирургического вмешательства), пожилые пациенты (в том числе получающие диуретики, ослабленные пациенты и пациенты с низкой массой тела), бронхиальная астма, одновременный прием ГКС (в том числе преднизолона), антикоагулянтов (в том числе варфарина), антиагрегантов (в том числе АСК, клопидогрела), селективных ингибиторов обратного захвата серотонина (в том числе циталопрама, флуоксетина, пароксетина, сертралина), ИБС, цереброваскулярные заболевания, дислипидемия/гиперлипидемия, сахарный диабет, заболевания периферических артерий, курение, хроническая почечная недостаточность (КК 30-60 мл/мин), наличие инфекции Helicobacter pylori, длительное применение НПВП, алкоголизм, тяжёлые соматические заболевания.

Способ применения и дозы:

Внутрь.

Для достижения быстрого желаемого терапевтического эффекта принимают за 30 мин до приема пищи. В остальных случаях принимают до, во время или после еды, в неразжеванном виде, запивая достаточным количеством воды. Взрослым и подросткам с 15 лет - по 25-50 мг 2-3 раза в сут. При достижении оптимального терапевтического эффекта дозу постепенно уменьшают и переходят на поддерживающее лечение в дозе 50 мг/сут. Максимальная суточная доза - 150 мг.

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 (количество таблеток)	Суточная доза (количество таблеток)
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:

Со стороны желудочно-кишечного тракта: чаще 1% - абдоминальная боль или спазм, ощущение вздутия живота, диарея, тошнота, запор, метеоризм, повышение активности "печеночных" транаминаз, пептическая язва с возможными осложнениями (кровотечение, перфорация), желудочно-кишечное кровотечение без язвы; реже 1% - рвота, желтуха, мелена, появление крови в кале, поражение пищевода, афтозный стоматит, сухость слизистых оболочек (в том числе полости рта), гепатит (возможно молниеносное течение), некроз печени, цирроз, гепаторенальный синдром, изменение аппетита, панкреатит (в том числе с сопутствующим гепатитом), холецистопанкреатит, колит.

Со стороны нервной системы: 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.

Со стороны органов чувств: чаще 1% - шум в ушах; реже 1% - нечеткость зрительного восприятия, диплопия, нарушение вкуса, обратимое или необратимое снижение слуха, скотома.

Со стороны кожных покровов: чаще 1% - кожный зуд, кожная сыпь; реже 1% - алопеция, крапивница, экзема, токсический дерматит, многоформная экссудативная эритема (в том числе синдром Стивенса-Джонсона), токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла), повышенная фоточувствительность, мелкоточечные кровоизлияния.

Со стороны мочеполовой системы: чаще 1% - задержка жидкости; реже 1% - нефротический синдром, протеинурия,

олигурия, гематурия, интерстициальный нефрит, папиллярный некроз, острая почечная недостаточность, азотемия.

Со стороны органов кроветворения и иммунной системы: 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).

Со стороны дыхательной системы: реже 1% - кашель, бронхоспазм, отек гортани, пневмонит.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: 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, помрачение сознания, у детей - миоклонические судороги, тошнота, рвота, абдоминальная боль, кровотечения, нарушение функции печени и почек.

Лечение: промывание желудка, введение активированного угля, симптоматическая терапия, направленная на устранение повышения артериального давления, нарушения функции почек, судорог, раздражение желудочно-кишечного тракта, угнетения дыхания. Форсированный диурез, гемодиализ малоэффективны.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан в III триместре беременности. В I и II триместре беременности должен применяться по строгим показаниям и в наименьшей дозировке.

Диклофенак проникает в грудное молоко. При необходимости назначения препарата в период лактации грудное вскармливание следует прекратить.

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 желудочно-кишечном тракте), токсичность метотрексата и нефротоксичность циклоспорина.

Ацетилсалициловая кислота снижает концентрацию диклофенака в крови. Одновременное применение 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 применение 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.

Антибактериальные лекарственные средства из группы хинолона - риск развития судорог.

Особые указания и меры предосторожности:

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 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.

При нарушениях функции почек

Противопоказан: тяжёлая почечная недостаточность (клиренс креатинина (КК) менее 30 мл/мин), прогрессирующие заболевания почек.

С осторожностью: хроническая почечная недостаточность (КК 30-60 мл/мин).

При нарушениях функции печени

Противопоказан: тяжелая печеночная недостаточность, активное заболевание печени.

С осторожностью: заболевания печени в анамнезе, печеночная порфирия.

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью: пожилые пациенты (в том числе получающие диуретики, ослабленные пациенты и пациенты с низкой массой тела).

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском возрасте (до 6 лет - для таблеток, покрытых кишечнорастворимой оболочкой 25 мг).

Условия хранения:

Препарат хранить в сухом, защищенном от света, недоступном для детей месте при температуре не выше 25°С.

Не использовать по окончании срока годности, указанного на упаковке

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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