Диклонат П (раствор)



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:

Раствор для в/в и в/м введения прозрачный, от бесцветного до светло-желтого цвета, со слабым запахом бензилового спирта.

	1 мл	**1 амп.**
диклофенак натрия	25 мг	75 мг

Вспомогательные вещества: бензиловый спирт, маннитол, натрия гидроксид, натрия метабисульфит, пропиленгликоль, вода д/и.

3 мл - ампулы (5) - поддоны (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Ненаркотические анальгетики, включая нестероидные и другие противовоспалительные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Является производным фенилуксусной кислоты; оказывает противовоспалительное, апальгетическое 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 C_{max} 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 C_{max} 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. $T_{1/2}$ из плазмы крови составляет 1-2 ч.

Не наблюдается кумуляции при соблюдении рекомендуемого интервала дозирования. Хорошо распределяется по тканям и жидкостям организма. Проникает в синовиальную жидкость и достигает C_{max} за 3-6 ч после введения.

Препарат метаболизируется в печени: 50% активного вещества подвергается метаболизму во время "первого прохождения" через печень; AUC в 2 раза меньше после перорального приема препарата, чем после парентерального введения той же дозы. Метаболизм происходит в результате многократного или однократного гидроксилирования и конъюгирования. В метаболизме принимает участие ферментная система P450 CYP 2C9. Фармакологическая активность метаболитов ниже, чем диклофенака.

Препарат выводится в основном через почки. Системный клиренс составляет 260 мл/мин. $T_{1/2}$ составляет 1-2 ч. 60% введенной дозы выводится через почки в виде метаболитов и менее 1% - в неизмененном 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 (КК 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:

Для в/м инъекций:

— воспалительные заболевания опорно-двигательного аппарата (ревматоидный артрит, псориатический, ювенильный хронический артрит, анкилозирующий спондилоартрит; острый подагрический артрит);

— воспалительные процессы в малом тазу, аднексит, первичная альгодисменорея, почечная или желчная колике, 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 другого 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.

Для внутривенных капельных инфузий:

— профилактика и лечение послеоперационных болей.

Относится к болезням:

- Аднексит
- Альгодисменорея
- Анкилозирующий спондилоартрит
- Артрит
- Артроз
- Болевой синдром
- Бурсит
- Воспаление
- Головная боль
- Желчная колика
- Инфекции
- Ишиас
- Лихорадка
- Люмбаго
- Миалгия
- Мигрень
- Невралгия
- Неврит
- Остеоартрит
- Остеоартроз
- Остеохондроз
- Отит
- Подагра
- Проктит
- Псориаз
- Ревматизм
- Ревматоидный артрит
- Спондилоартрит
- Тендовагинит
- Тонзиллит
- Фарингит

Противопоказания:

— 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;

— повышенная чувствительность к НПВП (в т.ч. к ацетилсалициловой кислоте), "аспириновая" астма.

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

Способ применения и дозы:

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

Внутримышечные инъекции

При *острых болях* назначают 75 мг ежедневно в/м. В случае необходимости (желчная или почечная колика) ежедневная доза может быть увеличена до 150 мг (по 1 ампуле 2 раза/сут).

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 натрия хлорида 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 *постоперационного 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 ч.

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 эпигастральной 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 эпигастральной 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 (гипостезия, 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 развиться 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.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказание: беременность; период лактации.

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 ЖКТ).

Уменьшает эффекты гипотензивных и снотворных средств.

Увеличивает вероятность возникновения побочных эффектов других НПВП и ГКС (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 гипогликемический эффект гипогликемических средств.

Цефамандол, цефаперазон, цефотетан, вальпроевая кислота и пликамицин 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 препаратами зверобоя повышает риск развития кровотечений в ЖКТ.

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 и меры предосторожности:

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

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

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

С *осторожностью:* пожилой возраст.

Применение в детском возрасте

Противопоказание: детский возраст до 15 лет.

Условия хранения:

Список Б. Хранить при температуре 15-25°С в недоступных для детей местах.

Срок годности:

5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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