Наклофен



Код АТХ:

- M02AA15

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/м введения прозрачный, бесцветный или слегка желтоватого цвета, без видимых механических включений.

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

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

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

Фармакотерапевтическая группа:

- Ненаркотические анальгетики, включая нестероидные и другие противовоспалительные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Диклофенак является нестероидным противовоспалительным препаратом (НПВП), обладающим анальгезирующим, противовоспалительным и жаропонижающим действием.

Основной механизм его действия заключается в неизбирательном угнетении активности фермента циклооксигсназы 1 и 2 (ЦОГ1 и ЦОГ2). что ведет к нарушению метаболизма арахндоновой кислоты, снижению синтеза простагландинов. простациклина и тромбоксана.

Наиболее эффективен при болях воспалительного характера. 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, диклофенак обладает антиагрегантной активностью. В терапевтических дозах диклофенак практически

не оказывает алияния на время кровотечения. При длительном лечении анальгезирующий эффект диклофенака не снижается.

Фармакокинетика

TC_{max} при в/м введении 75 мг - 15-30 мин. Связь с белками плазмы, преимущественно с альбуминами - 99%. Диклофенак активно проникает в синовиальную жидкость, где достигает 60-70% сывороточных концентраций. Через 3-6 часов после в/м введения концентрации активного вещества и метаболитов в синовиальной жидкости выше, чем в сыворотке. Диклофенак из синовиальной жидкости выводится быстрее, чем из сыворотки. 50% препарата подвергается метаболизму во время «первого прохождения» через печень. Практически полностью метаболизируется в печени, преимущественно путем гидроксилирования с последующей конъюгацией с глюкуроновой кислотой и сульфатирования.

$T_{1/2}$ составляет 1-2 часа. При легких нарушения функции печени или почек $T_{1/2}$ остается неизмененным. У больных с выраженной почечной недостаточностью (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 не изменяются.

Примерно 70% диклофенака выводится почками в форме фармакологически неактивных метаболитов. Только 1% препарата выводится в неизмененном виде, остальная часть метаболитов - через кишечник.

У пациентов пожилого возраста фармакокинетические параметры без значимых изменений.

Показания к применению:

Заболевания, при которых требуется достижение быстрого противовоспалительного или анальгезирующего эффекта:

— воспалительные и дегенеративные заболевания опорно-двигательного аппарата: ревматоидный артрит, псориатический, ювенильный хронический артрит, анкилозирующий спондилит (болезнь Бехтерева), подагрический артрит, артрит при болезни Рейтера, ревматическое поражение мягких тканей, остеоартроз периферических суставов и позвоночника, в том числе с радикулярным синдромом, тендовагинит, периартрит, бурсит, миозит, синовит;

— болевой синдром слабой или умеренной выраженности: невралгия, миалгия, люмбоишиалгия, посттравматический болевой синдром, сопровождающийся воспалением, послеоперационная боль, головная боль, мигрень, альгодисменорея, аднексит, проктит, зубная боль, почечная и желчная колика.

Диклофенак предназначен для симптоматической терапии и на прогрессирование заболевания не влияет.

Относится к болезням:

- Аднексит
- Альгодисменорея
- Артрит
- Артроз
- Болевой синдром
- Бурсит
- Воспаление
- Головная боль
- Желчная колика
- Зубная боль
- Люмбоишиалгия
- Миалгия
- Мигрень
- Невралгия
- Неврит
- Остеоартрит
- Остеоартроз
- Подагра
- Проктит
- Псориаз
- Радикулит
- Ревматизм
- Ревматоидный артрит
- Синовит
- Тендовагинит

Противопоказания:

— период после проведения аортокоронарного шунтирования;

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

— воспалительные заболевания кишечника (в т.ч. НЯК, болезнь Крона) в фазе обострения;

— цереброваскулярное кровотечение или иные кровотечения и нарушения гемостаза;

— выраженная печеночная недостаточность или активное заболевание печени;

— выраженная почечная недостаточность (КК менее 30 мл/мин), в том числе подтвержденная гиперкалиемия, прогрессирующее заболевание почек;

— декомпенсированная сердечная недостаточность;

— угнетение костномозгового кроветворения,

— III триместр беременности, период грудного вскармливания;

— детский возраст (до 18 лет);

— гиперчувствительность (в т.ч. к другим НПВП), полное или неполное сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза слизистой оболочки носа и околоносовых пазух и непереносимости ацетилсалициловой кислоты или других НПВП (в т.ч. в анамнезе).

С осторожностью: ишемическая болезнь сердца, цереброваскулярные заболевания, дислипидемия/гиперлипидемия, сахарный диабет, заболевания периферических артерий, курение, клиренс креатинина 30-60 мл/мин; анамнестические данные о развитии язвенного поражения желудочно-кишечного тракта, наличие инфекции Helicobacter pylori, длительное использование НПВП, частое употребление алкоголя, тяжелые соматические заболевания, индуцируемая порфирия, эпилепсия, дивертикулит, системные заболевания соединительной ткани, значительное снижение ОЦК (в том числе после обширного хирургического вмешательства), пациенты пожилого возраста (в том числе получающие диуретики, ослабленные пациенты и с низкой массой тела), беременность (I-II триместр), сопутствующая терапия следующими препаратами: антикоагулянты (например, варфарин), антиагрегаты (например, ацетилсалициловая кислота, клопидогрел), пероральные глюкокортикостероиды (например, преднизолон), селективные ингибиторы обратного захвата серотонина (например, циталопрам, флуоксетин, пароксетин, сертралин).

Для снижения риска развития нежелательных явлений со стороны желудочно-кишечного тракта следует использовать минимальную эффективную дозу минимально возможным курсом.

Способ применения и дозы:

Внутримышечно. Разовая доза для взрослых - 75 мг (1 ампула). При необходимости возможно повторное введение, но не ранее, чем через 12 часов (пациентам с почечной коликой препарат повторно можно ввести через 30 минут). При использовании других лекарственных форм диклофенака не следует превышать максимальной суточной дозы -150 мг.

Длительность использования не более 2 дней, при необходимости далее переходят на пероральное, либо ректальное применение диклофенака.

Нельзя смешивать раствор Наклофен с другими препаратами в одном шприце.

Побочное действие:

Часто - 1-10%; иногда - 0.1-1%; редко - 0.01-0.1%; очень редко - менее 0.01%, 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, сухость слизистых оболочек (в том числе полости рта), эрозивно-язвенные поражения пищевода, диафрагмоподобные стриктуры кишечника, 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. парестезии, 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 (затуманивание 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, эозинофилия, гемолитическая и апластическая анемия, агранулоцитоз.

Аллергические реакции: анафилактические/анафилактоидные реакции, включая выраженное снижение АД и шок; очень редко - ангионевротический отек (в т.ч. лица).

Со стороны сердечно-сосудистой системы: очень редко - сердцебиение, экстрасистолия, боль в груди, повышение АД, васкулит, сердечная недостаточность, инфаркт миокарда.

Со стороны дыхательной системы: редко - кашель, бронхиальная астма (включая одышку); очень редко - пневмонит, отек гортани.

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.

Прочие: в месте в/м введения возможны раздражение, боль, отек и покраснение кожных покровов.

Передозировка:

Симптомы: при парентеральном введении передозировка маловероятна. Клинические симптомы передозировки при парентеральном введении аналогичны таковым, которые могут наблюдаться при использовании других лекарственных форм: рвота, кровотечение из ЖКТ, диарея, головокружение, шум в ушах, судороги, повышение АД, угнетение
дыхания; при значительной передозировке - острая почечная недостаточность, гепатотоксическое действие.

Лечение: симптоматическая терапия, направленная на устранение повышения АД, нарушения функции почек, судорог, раздражения ЖКТ, угнетения дыхания. Форсированный диурез, гемодиализ малоэффективны (значительная связь с белками и интенсивный метаболизм).

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение диклофенака в I-II триместры беременности возможно только тогда, когда ожидаемая польза превышает потенциальный риск для плода. В III триместре и в период кормления грудью применение препарата Наклофен противопоказано.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Повышает концентрацию в плазме дигоксина, метотрексата, препаратов лития и циклоспорина.

Снижает эффект диуретиков, на фоне калийсберегающих диуретиков усиливается риск развития гиперкалиемии; на фоне антикоагулянтов, антиагрегантных и тромболитических лекарственных средств (алтеплаза, стрептокиназа, урокиназа) повышается риск развития кровотечений (чаще ЖКТ).

Уменьшает эффект гипотензивных и снотворных лекарственных средств.

Увеличивает вероятность возникновения побочных эффектов др. НПВП и глюкокортикостероидов (кровотечения из ЖКТ), токсичность метотрексата и нефротоксичность циклоспорина.

Ацетилсалициловая кислота снижает концентрацию диклофенака в крови.

Одновременное использование с парацетамолом повышает риск развития нефротоксичных эффектов диклофенака.

Уменьшает эффект гипогликемических лекарственных 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 проявляется повышением нефротоксичности.

Селективные ингибиторы обратного захвата серотонина повышают риск развития кровотечений из ЖКТ.

Одновременное назначение с этанолом, колхицином, кортикотропином и препаратами зверобоя продырявленного повышает риск развития кровотечений в ЖКТ.

Лекарственные средства, вызывающие фотосенсибилизацию, повышают сенсибилизирующее действие диклофенака к ультрафиолетовому облучению.

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

Антибактериальные лекарственные средства из группы хинолона - риск развития судорог.

Нельзя смешивать раствор Наклофен с другими препаратами в одном шприце.

Пациентам следует информировать врачей о развитии побочных эффектов.

Особые указания и меры предосторожности:

Для снижения риска развития нежелательных явлений со стороны желудочно-кишечного тракта следует использовать минимальную эффективную дозу минимально возможным коротким курсом.

При длительном применении диклофенака возможно, хотя и в редких случаях, развитие серьезных гепатотоксических реакций, в связи с чем, рекомендуется регулярно исследовать функцию печени.

Из-за важной роли простагландинов в поддержании почечного кровотока следует проявлять особую осторожность при назначении препарата 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, рекомендуется в качестве меры предосторожности контролировать функцию почек.

С осторожностью следует назначать диклофенак у больных при нарушениях свертывания крови, при порфирии, эпилепсии, а также у больных, получающих антикоагулянты или фибринолитики.

При проведении длительной терапии необходимо контролировать картину периферической крови, проводить анализ кала на скрытую кровь.

В связи с отрицательным действием на фертильность, женщинам, желающим забеременеть, препарат применять не рекомендуется. У пациенток с бесплодием (в том числе проходящих обследование) рекомендуется отменить препарат.

Пациентам, принимающим препарат, необходимо воздерживаться от употребления алкоголя.

При инфекционных заболеваниях противовоспатительный и антипиретический эффекты диклофенака натрия могут маскировать симптомы этих болезней.

Не рекомендуется смешивать раствор Наклофен с другими лекарственными средствами в одном шприце.

Влияние на способность к управлению автотранспортом и работе с механизмами

В период лечения возможно снижение скорости психических и двигательных реакций, поэтому необходимо воздерживаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Противопоказан при выраженной почечной недостаточности (КК менее 30 мл/мин), в том числе подтвержденной гиперкалиемии, прогрессирующем заболевании почек.

При нарушениях функции печени

Противопоказан при выраженной печеночной недостаточности или активном заболевании печени.

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью применять у пациентов пожилого возраста.

Применение в детском возрасте

Противопоказано детям до 18 лет

Условия хранения:

Список Б. Хранить при температуре не выше 25°С. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности:

5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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