Наклофен (свечи)



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:

Суппозитории ректальные белого или желтовато-белого цвета, конусообразные; на продольном срезе - однородная восковая масса белого или желтовато-белого цвета.

	1 супп.
диклофенак натрия	50 мг

Вспомогательные вещества: жир твердый.

5 шт. - стрипы (2) - 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 и связанные с этим побочные эффекты заключаются в неизбирательном угнетении активности фермента циклооксигеназы 1 и 2 (ЦОГ1 и ЦОГ2), что ведет к нарушению метаболизма арахидоновой кислоты, снижению синтеза простагландинов, простациклина и тромбоксана. Снижается синтез простагландинов в почках, слизистой оболочке желудка и синовиальной жидкости.

Наиболее эффективен при болях воспалительного характера. При ревматических заболеваниях противовоспалительное и анальгезируюшее действие диклофенака способствует значительному уменьшению выраженности боли, утренней скованности, отечности суставов, что улучшает функциональное состояние суставов. 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 влияния на время кровотечения. При длительном лечении аналыеэирующий эффект диклофенака не снижается.

Фармакокинетика

Всасывание

Диклофенак быстро всасывается после ректального введения. C_{max} достигаются через 1 час. При ректальном способе введения прием пищи не влияет на всасываемость диклофенака.

Распределение

99% абсорбированного диклофенака связывается с белками плазмы, в основном, альбуминами. Диклофенак активно проникает в синовиальную жидкость, где достигает 60-70% сывороточных концентраций. Через 3-6 часов после применения концентрации активного вещества и метаболитов в синовиальной жидкости выше, чем в сыворотке. Диклофенак из синовиальной жидкости выводится медленнее, чем из сыворотки крови.

Метаболизм и выведение

$T_{1/2}$ диклофенака составляет 1-2 часа. Диклофенак практически полностью метаболизируется в печени, преимущественно путем гидроксилирования и метоксилирования. В метаболизме препарата принимает участие ферментная система P450 CYP2C9. Фармакологическая активность метаболитов ниже, чем диклофенака.

$T_{1/2}$ из плазмы - 2 часа. Около 70% введенной дозы выводится в виде фармакологически неактивных метаболитов почками; менее 1% выводится в неизмененном виде, остальная часть дозы выводится в виде метаболитов с желчью.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

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, а также у пожилых пациентов фармакокинетические параметры диклофенака не изменяются.

Показания к применению:

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

— воспалительные заболевания опорно-двитательного аппарата (ревматоидный артрит, серонегативный спондилоартрит, ювенильный хронический артрит, артриты другой этиологии);

— дегенеративные заболевания опорно-двигательного аппарата (остеоартрит);

— микрокристаллические артриты (подагрический артрит, псевдоподагрический артрит);

— ревматическое поражение мягких тканей;

— периартрит, бурсит, миозит, тендинит, синовит;

— другие воспалительные заболевания скелетно-мышечной системы, сопровождающиеся болевым синдромом.

Как анальгетик Наклофен используется при травмах мягких тканей, в стоматологии, после хирургических вмешательств, при тяжелых мигренозных приступах, первичной альгодисменорее, аднексите, а также при почечной или желчной колике.

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

Относится к болезням:

- Аднексит
- Альгодисменорея
- Артрит
- Артроз
- Болевой синдром
- Бурсит
- Желчная колика
- Мигрень
- Остеоартрит
- Остеоартроз

- Подагра
- Ревматизм
- Ревматоидный артрит
- Синовит
- Спондилоартрит
- Стоматит
- Тендинит
- Травмы

Противопоказания:

— период после проведения аортокоронарного шунтирования;

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

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

— ректальные кровотечения, геморрой, травма или воспаление прямой кишки;

— цереброваскулярное кровотечение;

— гемофилия и другие нарушения свертываемости;

— 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 15 лет);

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

— гиперчувствительность к диклофенаку.

С осторожностью: ИБС, цереброваскулярные заболевания, дислипидемия/гиперлипидемия, сахарный диабет, заболевания периферических артерий, курение, КК менее 60 мл/мин; анамнестические данные о развитии язвенного поражения ЖКТ, наличие инфекции Helicobacter pylori, пожилой возраст, длительное использование НПВП, частое употребление алкоголя, тяжелые соматические заболевания, беременность I-II триместр, сопутствующая терапия следующими препаратами: антикоагулянты (например, варфарин), антиагреганты (например, ацетилсалициловая кислота, клопидогрел), фибринолитики, пероральные глюкокортикоиды (например, преднизолон), селективные ингибиторы обратного захвата серотонина (например, циталопрам, флуоксетин, пароксетин, сертралин).

Способ применения и дозы:

Ректально. При плохой переносимости больными пероральных форм диклофенака Наклофен можно назначать ректально в виде суппозиториев в соответствующих дозах. При комбинации нескольких лекарственных форм (в дополнение к пероральному приему препарата) следует учитывать, что суточная доза диклофенака не должна превышать 150 мг.

Взрослым начальная доза составляет 100-150 мг в сутки (по 1 суппозиторию 2-3 раза в сутки), в зависимости от тяжести заболевания. **Подросткам в возрасте от 15 лет и старше** рекомендуется по 1 суппозиторию не более 2 раз в сутки. Поддерживающая доза обычно составляет 100 мг в сутки (по 1 суппозиторию 2 раза в сутки).

Следует использовать минимальную эффективную дозу минимально возможным курсом.

Побочное действие:

Классификация частоты развития побочных эффектов (ВОЗ):

очень часто - >1/10

часто - от > 1/100 до < 1/10

нечасто - от > 1/1000 до < 1/100

редко - от>1/10000до< 1/1000

очень редко - от < 1/10000, включая отдельные сообщения.

Со стороны пищеварительной системы: часто - эпигастральная боль, тошнота, рвота, диарея, диспепсия, метеоризм, анорексия, повышение активности аминотрансфераз; редко - гастрит, проктит, обострение геморроя, 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 рта), повреждения пищевода, диафрагмоподобные стиктуры кишечника (неспецифический геморрагический колит, обострение язвенного колита или болезни Крона), запор, панкреатит, молниеносный гепатит. При использовании суппозиториев возможно местное раздражение и воспаление.

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, экзема, в т.ч. мультиформная и синдром Стивенса-Джонсона, синдром Лайелла, эксфолиативный дерматит, зуд, выпадение волос, фотосенсибилизация, пурпура, в т.ч. аллергическая.

Передозировка:

При применении суппозиториев передозировка маловероятна.

Симптомы: рвота, тошнота, боли в животе, кровотечение из ЖКТ, диарея, головная боль, головокружение, шум в ушах, повышенная возбудимость, явления гипервентиляции с повышенной судорожной готовностью, судороги, при значительной передозировке острая почечная недостаточность, гепатотоксическое действие.

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

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение диклофенака у беременных возможно только тогда, когда ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода. Диклофенак не следует использовать в течение последнего триместра беременности.

Несмотря на то, что диклофенак обнаруживается в грудном молоке в небольших количествах, его использование в период грудного вскармливания не рекомендуется.

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 тро.мболитических лекарственных средств (алтеплаза, стрептокиназа, урокиназа) повышается риск развития кровотечений (чаше - ЖКТ).

Уменьшает эффект гипотензивных и снотворных лекарственных средств. Увеличивает вероятность возникновения побочных эффектов других НПВП и ГКС (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.

При одновременном приеме с гилогликемическими средствами может наблюдаться гипо-или гапергликемия. При этой комбинации средств необходим контроль концентрации глюкозы в крови.

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 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 хинолонов повышают риск развития судорог.

Особые указания и меры предосторожности:

Пациентам следует информировать врача о любых хронических заболеваниях, метаболических нарушениях или реакциях повышенной чувствительности в анамнезе.

При лечении препаратом Наклофен следует тщательно наблюдать больных, в анамнезе которых имеются заболевания верхних отделов ЖКТ.

С осторожностью следует использовать препарат при НЯК и болезни Крона из-за возможного обострения заболевания.

При появлении признаков поражения печени (кожный зуд, пожелтение кожных покровов, тошнота, рвота, боли в животе, потемнение мочи, повышение уровня «печеночных» трансаминаз) следует прекратить прием препарата и обратиться к лечащему врачу.

При длительном применении (более 2-х недель) диклофенака необходим контроль показателей функции печени (уровня «печеночных» трансаминаз).

С осторожностью следует назначать диклофенак больным с тяжелой почечной или печеночной недостаточностью, сердечной недостаточностью, при нарушениях свертывания крови, при порфирии, эпилепсии, а также больным, получающим антикоагулянты или фибринолитики.

Не следует применять препарат одновременно с другими НПВП.

Препарат может изменять свойства тромбоцитов, однако не заменяет профилактического действия ацетилсалициловой кислоты при сердечно-сосудистых заболеваниях.

Применение препарата может отрицательно влиять на женскую фертильность и не рекомендуется женщинам, планирующим беременность.

При инфекционных заболеваниях противовоспалительный и жаропонижающий эффекты диклофенака натрия могут маскировать симптомы этих болезней.

У пожилых пациентов, как и в случаях применения других лекарственных средств, Наклофен следует использовать в минимально эффективной дозе.

Влияние на способность управления автотранспортом и другими сложными 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

Противопоказано применение препарата при выраженной почечной недостаточности (КК менее 30 мл/мин), в том числе подтвержденной гиперкалиемии, прогрессирующем заболевание почек.

С осторожностью при КК менее 60 мл/мин

При нарушениях функции печени

Противопоказано применение препарата при выраженной печеночной недостаточности или активном заболевании печени

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью у пациентов пожилого возраста.

Применение в детском возрасте

Противопоказан детям до 15 лет.

Условия хранения:

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

Срок годности:

4 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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