Наклофен (таблетки)



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:

Таблетки, покрытые кишечнорастворимой пленочной оболочкой коричнево-желтого цвета, круглые, слегка двояковыпуклые, гладкие.

	1 таб.
диклофенак натрия	50 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, крахмал кукурузный, целлюлоза микрокристаллическая, повидон, кремния диоксид коллоидный безводный, магния стеарат.

Состав кишечнорастворимой пленочной оболочки: гипромеллоза, краситель железа оксид красный (Е172), краситель железа оксид желтый (Е172), титана диоксид, сополимер метакриловой кислоты и этилакрилата, пропиленгликоль, тальк.

10 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Ненаркотические анальгетики, включая нестероидные и другие противовоспалительные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Диклофенак натрия является нестероидным противовоспалительным препаратом, обладающий обезболивающим, 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 уровень различных простагландинов в моче, слизистой желудка и синовиальной жидкости. 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 нестероидные противовоспалительные препараты (НПВП), диклофенак обладает антиагрегантной активностью. В терапевтических дозах диклофенак натрия практически не оказывает влияния на время кровотечения. При длительном лечении обезболивающий эффект диклофенака натрия не снижается.

Фармакокинетика

Абсорбция - быстрая и полная, пища замедляет скорость абсорбции на 1-4 часа и снижает максимальную концентрацию на 40%. После перорального приема 50 мг C_{max} - 1.5 мкг/мл достигается через 2-3 часа. Концентрация в плазме находится в линейной зависимости от величины принимаемой дозы. Изменения фармакокинетики диклофенака на фоне многократного введения не отмечается. Не кумулирует при соблюдении рекомендуемого интервала между приемами пищи. 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 часа позже, чем в плазме. $T_{1/2}$ из синовиальной жидкости 3-6 часов (концентрация активного вещества в синовиальной жидкости через 4-6 часов после введения препарата выше, чем в плазме, и остается более высокой еще в течение 12 часов). Взаимосвязь концентрации препарата в синовиальной жидкости с клинической эффективностью препарата 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 ферментная система P450 CYP2C9. Фармакологическая активность метаболитов ниже, чем диклофенака. Системный клиренс составляет 260 мл/мин, объем распределения - 550 мл/кг. $T_{1/2}$ 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.

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, а так же пожилых пациентов фармакокинетические параметры диклофенака не изменяются. Диклофенак проникает в грудное молоко.

Показания к применению:

— воспалительные и дегенеративные заболевания опорно-двигательного аппарата: ревматоидный артрит, псориатический, ювенильный хронический артрит, анкилозирующий спондилоартрит (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, синовиит);

— 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;

— в составе комплексной терапии инфекционно-воспалительных заболеваний уха, горла, носа с выраженным болевым синдромом (фарингит, тонзиллит, отит);

— лихорадочный синдром.

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

Относится к болезням:

- Аднексит
- Альгодисменорея
- Анкилозирующий спондилоартрит
- Артрит
- Артроз
- Болевой синдром
- Бурсит
- Воспаление
- Головная боль
- Желчная колика
- Зубная боль
- Инфекции
- Лихорадка

- Люмбоишиалгия
- Миалгия
- Мигрень
- Невралгия
- Неврит
- Остеоартрит
- Остеоартроз
- Отит
- Подагра
- Проктит
- Псориаз
- Радикулит
- Ревматизм
- Ревматоидный артрит
- Синовит
- Спондилоартрит
- Тендовагинит
- Тонзиллит
- Фарингит

Противопоказания:

— период после проведения аортокоронарного шунтирования;

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

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

— цереброваскулярное кровотечение или иные кровотечения и нарушения гемостаза;

— выраженная печеночная недостаточность или активное заболевание печени;

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

— декомпенсированная сердечная недостаточность;

— угнетение костномозгового кроветворения;

— III триместр беременности, период грудного вскармливания;

— данная лекарственная форма противопоказана детям весом менее 45 кг (или в возрасте до 15 лет);

— гиперчувствительность к диклофенаку; с анамнестическими данными о приступе бронхообструкции, ринита, крапивницы после приема ацетилсалициловой кислоты или иного НПВП (полный или неполный синдром непереносимости ацетилсалициловой кислоты - риносинусит, крапивница, полипы слизистой носа, астма).

С осторожностью: ишемическая болезнь сердца, цереброваскулярные заболевания, дислипидемия/гиперлипидемия, сахарный диабет, заболевания периферических артерий, курение, клиренс креатинина менее 60 мл/мин; анамнестические данные о развитии язвенного поражения желудочно-кишечного тракта, наличие инфекции Helicobacter pylori, пожилой возраст, длительное использование НПВП, частое употребление алкоголя, тяжелые соматические заболевания, индуцируемая порфирия, эпилепсия, пожилой возраст, дивертикулит, системные заболевания соединительной ткани, значительное снижение ОЦК (в т.ч. после массивного хирургического вмешательства), пожилые пациенты (в т.ч. получающие диуретики, ослабленные пациенты и с низкой массой тела), сопутствующая терапия следующими препаратами: антикоагулянты (например, варфарин), антиагреганты (например, ацетилсалициловая кислота, клопидогрел), пероральные глюкокортикоиды (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:

Внутрь, не разжевывая, во время или после еды, запивая небольшим количеством воды.

Взрослым и подросткам с 15 лет (и весом более 45 кг) - по 50 мг 2-3 раза в сутки. При достижении оптимального терапевтического эффекта дозу постепенно уменьшают и переходят на поддерживающее лечение в дозе 100 мг/сут. Максимальная суточная доза -150 мг.

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 рта), повреждения пищевода, диафрагмоподобные стиктуры 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 мочевыделителыюй 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 артериального давления (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:

Симптомы: рвота, кровотечение из ЖКТ, диарея, головокружение, шум в ушах, судороги, при значительной передозировке - острая почечная недостаточность, гепатотоксическое действие.

Лечение: промывание желудка, активированный уголь, 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 у беременных возможно только тогда, когда ожидаемая польза превышает потенциальный риск для плода. Диклофенак не рекомендуется 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 калийсберегаюших 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 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.

Особые указания и меры предосторожности:

С целью быстрого достижения желаемого терапевтического эффекта принимают препарат за 30 мин до приема пищи. В остальных случаях принимают до, во время или после еды целиком, запивая достаточным количеством воды.

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

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

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 крупного 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 противовоспалительный и антипиретический эффекты диклофенака натрия могут маскировать симптомы этих болезней.

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

Противопоказан детям до 15 лет.

Условия хранения:

Хранить в сухом месте при температуре не выше 25°C. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности:

5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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