

Состав

действующее вещество: диклофенак диэтиламин (diclofenac diethylamine);

1 г геля содержит 23,2 мг диклофенака диэтиламина в пересчете на диклофенак натрия 20 мг;

другие составляющие: пропиленгликоль, спирт изопропиловый, карбомер, диэтиламин, кокоила каприлокапрат, спирт олеиловый, полиэтиленгликоля цетостеариловый эфир, масло минеральное легкое, бутилгидрокситолуол (Е 321), вода очищенная.

Лекарственная форма

Эмульсионный гель для наружного применения.

Основные физико-химические свойства: белый или белый мягкий однородный гель.

Фармакотерапевтическая группа

Средства, применяемые местно при суставной и мышечной боли. Нестероидные противовоспалительные средства для местного применения. Диклофенак. Код АТХ М02А А15.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика.

Диклосейф® Форте с действующим веществом диклофенак является нестероидным противовоспалительным средством (НПВС) для наружного применения.

Диклофенак – НПВС, оказывает выраженное противоревматическое, обезболивающее, противовоспалительное и жаропонижающее действие. Основным механизмом терапевтического действия диклофенака является угнетение биосинтеза простагландинов циклооксигеназой 2 (ЦОГ-2).

При воспалении и боли травматического или ревматического происхождения гель с диклофенаком приводит к уменьшению боли, отека тканей и сокращению периода восстановления функций поврежденных суставов, связок, сухожилий и мышц.

Клиническими данными доказано, что при растяжении связок голеностопного сустава гель с диклофенаком значительно уменьшал боль при движениях по сравнению с пациентами, получавшими плацебо, в течение трех дней после начала лечения, включая подгруппу пациентов с сильной болью. Кроме того, лечение этим препаратом также значительно улучшало функцию голеностопного сустава в течение трех дней после начала лечения.

Благодаря водно-спиртовой основе гель с диклофенаком оказывает местноанестезирующий и охлаждающий эффект.

Фармакокинетика.

Количество всасываемого через кожу диклофенака пропорционально площади его нанесения и зависит как от общей примененной дозы препарата, так и от степени гидратации кожи. После местного применения (2 раза в сутки) на поверхность кожи площадью 400 см² степень системной абсорбции препарата, определяемая как концентрация действующего вещества в плазме крови, эквивалентна нанесению 4 раза в сутки диклофенака диэтиламина с концентрацией 1,16%.

Относительная системная биодоступность диклофенака при применении геля с диклофенаком на 7 день составляет 4,5% по сравнению с таблетками по 50 мг (при той же дозе диклофенака натрия). Абсорбция не зависит от применения влагопроницаемой и паропроницаемой повязки.

После нанесения геля с диклофенаком на кожу суставов кисти и колена диклофенак выявляется в плазме крови (где его максимальная концентрация примерно в 100 раз меньше, чем после перорального приема того же количества диклофенака), в синовиальной оболочке и синовиальной жидкости. Связывание диклофенака с белками составляет 99,7%, главным образом с альбумином (99,4%).

Диклофенак накапливается в коже, которая служит резервуаром, откуда происходит постепенное высвобождение вещества в близлежащие ткани. Оттуда диклофенак предпочтительно поступает в более глубокие воспаленные ткани, такие как суставы, связки, где продолжает действовать и определяется в концентрациях до 20 раз больше, чем в плазме крови.

Диклофенак частично метаболизируется путем глюкуронизации и преимущественно путем гидроксилирования с образованием нескольких фенольных производных, два из которых являются фармакологически активными, но в значительно меньшей степени, чем диклофенак.

Диклофенак и его метаболиты выводятся преимущественно с мочой. Конечный период полувыведения диклофенака из плазмы крови составляет в среднем 1-2 часа. Четыре метаболита, включая два активных, также имеют небольшой период полувыведения – 1-3 часа. Один из метаболитов -3'-гидрокси-4'-метоксидиклофенак - имеет более длительный период полувыведения, но почти неактивен.

При почечной недостаточности накопление диклофенака и его метаболитов в организме не наблюдается. При хроническом гепатите или недекомпенсированном циррозе печени кинетика и метаболизм диклофенака не изменяются.

Показания

Лечение боли, воспаления и отека при:

повреждения мягких тканей: травмы сухожилий, связок, мышц и суставов (например, вследствие вывиха, растяжения, ушиба) и боли в спине (спортивные травмы);

локализованных формах ревматизма мягких тканей: тендинит (в т.ч. «теннисный локоть»), бурсит, плечевой синдром и периартропатия.

Симптоматическое лечение остеоартрита мелких и средних суставов, поверхностно расположенных, таких как суставы пальцев или коленные суставы.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к диклофенаку, ацетилсалициловой кислоте, другим НПВС или другим компонентам препарата.

Наличие в анамнезе приступов бронхиальной астмы, ангиоэдемы, крапивницы или острого ринита, обусловленных приемом ацетилсалициловой кислоты или других НПВС.

Последний триместр беременности.

Детский возраст до 14 лет.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Поскольку системная абсорбция диклофенака в результате местного применения препарата очень низкая, вероятность возникновения взаимодействий очень низка. На сегодняшний день отсутствуют данные о взаимодействии диклофенака в случае его местного применения. Однако нужно учитывать возможные взаимодействия, известные для пероральных форм диклофенака. Совместное

применение препарата Диклосейф Форте с другими системными НПВС и стероидами может увеличить частоту побочных эффектов.

Особенности по применению

С осторожностью применять лекарственное средство Диклосейф® Форте с пероральными НПВС.

Вероятность развития системных побочных эффектов (случающихся при местном применении системных форм диклофенака) должна быть рассмотрена при применении препарата на больших участках кожи или в течение более длительного времени, чем рекомендовано.

Гель Диклосейф® Форте рекомендуется наносить только на интактные, невредимые участки кожи, предотвращая попадание на поврежденную (раненую или инфицированную) кожу. Следует избегать контакта препарата с глазами и слизистыми. Препарат нельзя проглатывать.

При появлении любых кожных высыпаний лечение препаратом следует прекратить.

Гель Диклосейф Форте не следует применять под воздухонепроницаемую окклюзионную повязку, но допускается его применение под неокклюзионную повязку.

При местном применении диклофенака у пациентов с пептической язвой (наличной или в анамнезе) существует некоторая вероятность желудочно-кишечного кровотечения.

Как и другие препараты, ингибирующие простагландинсинтетазу, диклофенак и другие НПВС могут привести к бронхоспазму, если применяются пациентам, страдающим бронхиальной астмой или имеющим ее в анамнезе.

Из-за возможности возникновения светочувствительности следует избегать действия прямых солнечных лучей.

Необходимо посоветовать пациенту не курить и не приближаться к открытому огню, поскольку это риск получения серьезных ожогов. Ткань (одежда, постельное белье, перевязочный материал), которая контактировала с препаратом, может легко загореться и представляет серьезную пожарную опасность. Стирка одежды и постельного белья может снизить накопление геля, но не удаляет его полностью.

Вспомогательные вещества

Гель Диклосейф® Форте содержит пропиленгликоль и бутилгидрокситолуол. Пропиленгликоль может вызвать раздражение кожи. Бутилгидрокситолуол может вызвать местные кожные реакции (например, контактный дерматит) или раздражение глаз и слизистых.

Применение в период беременности или кормления грудью.

Беременность.

Клинический опыт применения беременных женщин ограничен.

После местного применения диклофенака его системная концентрация ниже, по сравнению с приемом пероральных форм. Учитывая опыт терапии системными НПВС, рекомендуется учитывать следующее.

Ингибирование синтеза простагландинов может отрицательно сказаться на течении беременности и/или развитии эмбриона/плода. Данные эпидемиологических исследований свидетельствуют о повышенном риске выкидышей и риске развития сердечных пороков и гастрошизиса после применения ингибитора синтеза простагландинов на ранних сроках беременности. Абсолютный риск сердечно-сосудистых пороков был увеличен с менее чем 1% до примерно 1,5%. Считается, что риск увеличивается с дозой и продолжительностью лечения. Было показано, что у животных введение ингибитора синтеза простагландинов приводит к увеличению пре- и постимплантационной потери и летальности эмбриона/плода.

Кроме того, у животных, получавших ингибитор синтеза простагландинов в период органогенеза, была зарегистрирована повышенная частота различных пороков развития, в том числе со стороны сердечно-сосудистой системы. Во время первого и второго триместра беременности не следует применять диклофенак, если это не необходимо. Если диклофенак применяется женщиной, стремящейся забеременеть, или если препарат применяется в течение первого или второго триместра беременности, доза препарата должна быть как можно ниже, а продолжительность лечения – как можно короче.

Во время третьего триместра беременности все ингибиторы синтеза простагландинов могут влиять на плод следующим образом:

сердечно-легочная токсичность (с преждевременным закрытием артериального протока и легочной гипертензией);

нарушение функции почек, которые могут прогрессировать до почечной недостаточности с олигогидроамнионом.

Применение ингибиторов синтеза простагландинов в конце беременности может влиять на мать и новорожденного таким образом:

возможные удлинение времени кровотечения, антиагрегантный эффект, который может наблюдаться даже при очень низких дозах;
торможение сокращений матки, что приводит к задержке или удлинению родов.

Следовательно, диклофенак, как и другие НПВС, противопоказан в течение третьего триместра беременности (см. раздел «Противопоказания»).

Период кормления грудью.

Как и другие НПВС, диклофенак в незначительном количестве проникает в грудное молоко. Однако при применении терапевтических доз геля Диклосейф Форте никакого влияния на грудное вскармливание не предполагается. Из-за отсутствия контролируемых исследований у кормящих грудью гель Диклосейф® Форте в данный период следует использовать только по назначению врача. В период кормления грудью препарат не следует наносить на молочные железы или на большие участки кожи и не следует применять в течение длительного времени (см. разделы «Особенности применения» и «Способ применения и дозы»).

фертильность.

Данные о влиянии диклофенака на фертильность человека при его внешнем применении отсутствуют.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или другими механизмами.

Препарат не влияет или оказывает незначительное влияние на способность управлять автомобилем и работать с другими механизмами.

Способ применения и дозы

Препарат предназначен только для наружного применения.

Взрослые и дети от 14 лет

Гель Диклосейф Форте применять 2 раза в сутки (утром и вечером), слегка втирая в кожу в месте локализации боли. Количество применяемого препарата зависит от размера пораженного участка (так, 2-4 г, что по размеру соответствует вишне или грецкому ореху, достаточно для нанесения на участок площадью 400-800 см²). Обезболивающее действие длится до 12 часов.

После нанесения препарата необходимо вымыть руки, кроме тех случаев, когда этот участок подлежит лечению.

Продолжительность терапии зависит от характера заболевания и эффективности лечения.

Препарат не следует применять более 14 дней подряд при повреждениях или ревматизме мягких тканей и более 21 дня при боли в суставах артритного происхождения, если другое не рекомендовано врачом.

Необходимо обратиться за консультацией врача, если симптомы заболевания не уменьшаются или усугубляются после 7 дней лечения.

Пациенты пожилого возраста

Не требует корректировки дозы препарата.

Если наносить гель Диклосейф® Форте на большие участки тела, системное всасывание диклофенака будет больше и возрастет риск побочных реакций, особенно если лекарственное средство применяется часто.

Дети.

Недостаточно данных об эффективности и безопасности для детей младше 14 лет (см. раздел «Противопоказания»).

При применении лекарственного средства детям от 14 лет дольше 7 дней или если симптомы заболевания усиливаются, необходимо обратиться за консультацией врача.

Передозировка

Симптомы

Передозировка маловероятна из-за низкой абсорбции диклофенака в системный кровоток при местном применении. В то же время развитие системных побочных реакций может наблюдаться при случайном проглатывании геля Диклосейф Форте (следует учитывать, что 1 туба препарата по 30 г содержит эквивалент 0,6 г диклофенака натрия).

Лечение

При случайном проглатывании препарата и возникновении значительных системных побочных реакций следует использовать общие терапевтические мероприятия по лечению отравления НПВС. Рекомендуются промывание

желудка и прием активированного угля, особенно в тех случаях, когда проглатывание препарата произошло недавно.

Лечение передозировки НПВС заключается в применении поддерживающей и симптоматической терапии. Не существует типичной клинической картины, вызванной передозировкой геля с диклофенаком. Поддерживающее и симптоматическое лечение показано при таких осложнениях как артериальная гипотензия, почечная недостаточность, судороги, нарушения желудочно-кишечного тракта и угнетение дыхания. Маловероятно, что форсированный диурез, гемодиализ или гемоперфузия полезны для выведения НПВС, поскольку активные вещества этих препаратов в значительной степени связываются с белками плазмы крови и подвергаются интенсивному метаболизму.

Побочные эффекты

Гель с диклофенаком обычно хорошо переносится. Побочные реакции включают в себя легкие временные реакции на коже в месте нанесения. В редких случаях могут наблюдаться аллергические реакции.

Категория частоты побочных реакций определяется следующим образом: очень часто ($\geq 1/10$); часто ($\geq 1/100$, $< 1/10$); нечасто ($\geq 1/1000$, $< 1/100$); редко ($\geq 1/10000$, $< 1/1000$); очень редко ($< 1/10000$); частота неизвестна (не может быть оценена по имеющимся данным).

Инфекции и инвазии: очень редко – пустулезная сыпь.

Со стороны иммунной системы: очень редко – реакции повышенной чувствительности (в том числе крапивница), ангионевротический отек.

Со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: очень редко – бронхиальная астма.

Со стороны кожи и подкожной клетчатки: часто – сыпь, зуд, экзема, эритема, дерматит, в том числе контактный дерматит; редко – буллезный дерматит; очень редко – реакции светочувствительности; частота неизвестна – десквамация, изменение цвета кожи, чувство жжения кожи.

При побочных реакциях следует прекратить лечение и обратиться к врачу.

Сообщения о подозреваемых побочных реакциях

Сообщение о побочных реакциях после регистрации лекарственного средства имеет важное значение. Это позволяет проводить мониторинг соотношения польза/риск при применении этого лекарственного средства. Медицинским и

фармацевтическим работникам, а также пациентам или их законным представителям следует сообщать о всех случаях подозреваемых побочных реакций и отсутствии эффективности лекарственного средства через Автоматизированную информационную систему по фармаконадзору по ссылке: <https://aisf.dec.gov.ua>.

Срок годности

3 года

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 30 г, по 50 г или по 100 г. в тубе. По 1 тубе в картонной упаковке.

Категория отпуска

Без рецепта.

Производитель

Кусум Хелтхкер Пвт Лтд/

Kusum Healthcare Pvt. Ltd.

Местонахождение производителя и адрес места его деятельности.

СП-289(А), РИИКО Индастриал ареа, Чопанки, Бхивади, Дист. Алвар (Раджастан), Индия/

SP-289(A), RIICO Industrial area, Chopanki, Bhiwadi, Dist. Alwar (Rajasthan), Индия.