Состав

действующее вещество: диклофенак натрия

1 мл раствора для инъекций содержит 25 мг диклофенака натрия (1 ампула содержит 3 мл раствора для инъекций, равной 75 мг диклофенака натрия)

вспомогательные вещества: пропиленгликоль, спирт бензиловый, ацетилцистеин, манит (Е 421), натрия гидроксид, вода для инъекций.

Лекарственная форма

Раствор для инъекций.

Основные физико-химические свойства: прозрачная раствор от бесцветного до почти бесцветного, не содержит видимых частиц.

Фармакотерапевтическая группа

Нестероидные противовоспалительные средства. Производные уксусной кислоты и родственные соединения.

Код АТХ М01А В05.

Фармакодинамика

Диклоберл® N75 - нестероидный препарат с выраженными обезболивающими / противовоспалительными свойствами. Он является ингибитором простагландинсинтетазы (ЦОГ). Диклофенак натрия in vitro в концентрациях, эквивалентных тем, которые были достигнуты в человека, не угнетает биосинтез протеогликанов в хрящевой ткани. Если лекарственное средство применять одновременно с опиоидами для снятия послеоперационной боли, Диклоберл® N75 часто уменьшает потребность в опиоидов.

Фармакокинетика

Абсорбция

После введения 75 мг диклофенака путем инъекции абсорбция начинается немедленно, а средняя максимальная концентрация в плазме составляет примерно 2,558 ± 0,968 мкг / мл (2,5 мкг / мл примерно равна 8 мкмоль / л) достигается через 20 минут . Объем абсорбции линейно пропорционален величине дозы.

В отличие от соответствующих результатов перорального применения, в случае применения лекарственного средства в виде суппозиториев или внутримышечного введения концентрация в плазме крови быстро снижается сразу после достижения максимальных уровней.

Биодоступность

Площадь под кривой концентрации (AUC) после внутримышечного или внутривенного введения примерно вдвое больше, чем после приема или ректального введения, так как этот путь позволяет избежать метаболизма первого прохождения через печень.

Распределение

99,7% диклофенака связывается с белками, главным образом с альбумином (99,4%).

Диклофенак попадает в синовиальной жидкости, где максимальная концентрация устанавливается через 2-4 часа после достижения пикового значения в плазме. Ожидаемый период полувыведения из синовиальной жидкости составляет от 3 до 6 часов. Через 2 часа после достижения уровня пикового значения в плазме концентрация действующего вещества в синовиальной жидкости превышает этот показатель в плазме и остается выше в течение периода до 12 часов.

Диклофенак был обнаружен в низкой концентрации (100 нг / мл) в грудном молоке у одной женщины, которая кормила грудью. Предполагаемое количество препарата, попадает в организм младенца с грудным молоком, эквивалентная 0,03 мг / кг / сут.

Метаболизм

Метаболизм диклофенака происходит частично путем глюкуронизации интактной молекулы, но главным образом путем однократного и многократного гидроксилирования и метоксилирования, что приводит к образованию нескольких фенольных метаболитов, большинство из которых превращается в конъюгаты глюкуронида. Два фенольных метаболиты являются биологически активными, однако их действие выражено значительно меньше, чем действие диклофенака.

Вывод

Общий системный клиренс диклофенака в плазме крови составляет 263 ± 56 мл / мин (среднее значение ± SD). Конечный период полувыведения в плазме

составляет 1-2 часа. Четыре метаболиты, включая два активных, также имеют короткий период полувыведения - 1-3 часа.

Примерно 60% введенной дозы выводится с мочой в виде конъюгатов с глюкуроновой кислотой интактной молекулы и в виде метаболитов, большинство из которых также превращается в глюкуронидные конъюгаты. Менее 1% выводится в виде неизмененного вещества. Остатки дозы элиминируются в виде метаболитов через желчь с калом.

Специальные группы пациентов.

Пациенты пожилого возраста

Никакой разницы в зависимости от возраста больного в абсорбции, метаболизме или экскреции препарата не наблюдалось. Кроме того, что у пяти пациентов пожилого возраста 15-минутная инфузия привела к высшей на 50% концентрации в плазме, чем это наблюдалось у молодых здоровых добровольцев.

Пациенты с нарушением функции почек

У пациентов с нарушением функции почек при соблюдении режима обычного дозирования нельзя не ожидать накопления неизмененного активного вещества, исходя из кинетики препарата после однократного применения. При КК менее 10 мл / мин уровне гидроксиметаболитов в плазме примерно в 4 раза выше, чем у здоровых добровольцев.

Однако метаболиты окончательно выводятся с желчью.

Пациенты с заболеванием печени

У пациентов с хроническим гепатитом или компенсированным циррозом печени кинетика и метаболизм диклофенака такие же, как и у пациентов без заболевания печени.

Показания

Препарат при введении предназначен для лечения:

- воспалительных и дегенеративных форм ревматизма, ревматоидного артрита, анкилозирующего спондилита, остеоартрита, спондилоартрита, вертебрального болевого синдрома, несуставного ревматизма;

- острых приступов подагры;

- почечных и билиарных колик;
- боли и отека после травм и операций;
- тяжелых приступов мигрени.

Противопоказания

- гиперчувствительность к действующему веществу или любых других вспомогательных веществ, указанных в разделе «Состав»;
- кровотечение или перфорация желудочно-кишечного тракта в анамнезе, связанная с предыдущим лечением нестероидными противовоспалительными средствами (НПВС);
- активная форма желудочной или кишечной язвы, кровотечение или перфорация;
- известные реакции в анамнезе бронхоспазма, астмы, ринита или крапивницы после применения ацетилсалициловой кислоты или других НПВП;
- неопределенные нарушения кроветворения;
- активная форма язвенной болезни / кровотечения или рецидивная язвенная болезнь / кровотечение в анамнезе (два или более отдельных эпизоды установленной язвы или кровотечения);
- III триместр беременности;
- как и другие НПВП, диклофенак также противопоказан пациентам, у которых применение ибупрофена, ацетилсалициловой кислоты или других нестероидных противовоспалительных средств провоцирует приступы бронхиальной астмы, ангионевротического отека, крапивницы или острого ринита;

- воспалительные заболевания кишечника (например болезнь Крона или язвенный колит);
- печеночная недостаточность;
- почечная недостаточность (клиренс креатинина <15 мл / мин / 1,73 м2);
- заболевания периферических артерий;
- цереброваскулярные заболевания у пациентов, перенесших инсульт или имеют эпизоды преходящих ишемических атак;
- ишемическая болезнь сердца у пациентов, имеющих стенокардию или перенесших инфаркт миокарда;
- застойная сердечная недостаточность (NYHA II-IV);
- высокий риск развития послеоперационных кровотечений, свертывания крови, нарушений гемостаза, гемопоэтических нарушений или цереброваскулярных кровотечений;
- лечение послеоперационной боли при коронарном шунтировании (или применения аппарата искусственного кровообращения).

В данной лекарственной форме препарат противопоказан детям.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Ниже приведены взаимодействия, которые наблюдались при применении Диклоберла® N75, раствора для инъекций и / или других лекарственных форм диклофенака.

Литий. При условии одновременного применения диклофенак может повысить концентрации лития в плазме крови. Рекомендуется мониторинг уровня лития в сыворотке крови.

Дигоксин. При условии одновременного применения диклофенак может повысить концентрации дигоксина в плазме. Рекомендуется мониторинг уровня дигоксина в сыворотке.

Фенитоин. В условиях одновременного применения фенитоина с диклофенаком, рекомендуется мониторинг концентрации фенитоина в плазме в связи с ожидаемым увеличением экспозиции фенитоина.

Диуретики и антигипертензивные средства. НПВС могут снижать гипотензивное эффективность диуретиков и других антигипертензивных лекарственных средств (таких как бета-блокаторы, ингибиторы АПФ (АПФ)) через ингибирование синтеза сосудорасширяющих простагландинов. Таким образом, подобную комбинацию следует применять с осторожностью, а пациенты, особенно пожилого возраста, должны находиться под тщательным наблюдением относительно артериального давления. Пациенты должны получать надлежащую гидратацию, рекомендуется также мониторинг функции почек после начала сопутствующей терапии и на периодической основе после нее, особенно по диуретиков и ингибиторов АПФ, учитывая увеличение риска нефротоксичности.

Препараты, как известно, вызывают гиперкалиемии. Сопутствующее лечение калийсберегающими диуретиками, циклоспорином, такролимусом или триметопримом может быть связано с увеличением уровня калия в сыворотке крови, поэтому их контроль следует проводить чаще.

Антикоагулянты и антитромботические средства. Рекомендуется принять меры предосторожности, поскольку сопутствующее введение повышает риск кровотечения. Хотя клинические исследования не свидетельствуют о влиянии диклофенака на активность антикоагулянтов, существуют данные об увеличении риска кровотечения у пациентов, получающих диклофенак и антикоагулянты одновременно. Поэтому для того чтобы убедиться, что никаких изменений в дозировке антикоагулянтов не нужно, рекомендуется тщательный мониторинг состояния таких пациентов.

Как и другие НПВС, диклофенак в высоких дозах может обратимо угнетать агрегацию тромбоцитов.

Другие НПВП, включая селективные ингибиторы циклооксигеназы-2, и кортикостероиды. Одновременное назначение диклофенака и других системных НПВС или кортикостероидов повышает риск желудочно-кишечного кровотечения или язвы. Следует избегать одновременного применения двух или более НПВП.

Селективные ингибиторы обратного захвата серотонина (СИОЗС). Одновременное назначение системных НПВС и СИОЗС повышает риск желудочно-кишечного кровотечения.

Противодиабетические препараты. Клинические исследования показали, что диклофенак можно применять вместе с пероральными гипогликемическими средствами без влияния на их клиническое действие. Однако известны отдельные сообщения как гипогликемического, так и гипергликемического влияния, требующих изменения дозировки противодиабетических препаратов при лечении диклофенаком. По этим причинам необходим мониторинг уровня глюкозы в крови, что является Меры предосторожности при сопутствующей терапии.

Также имеются отдельные сообщения о случаях метаболического ацидоза при одновременном применении с диклофенаком, особенно у пациентов с уже существующими нарушениями функции почек.

Пробенецид. Лекарственные средства, содержащие пробенецид, могут задерживать выведение диклофенака.

Метотрексат. Диклофенак может подавлять клиренс метотрексата в почечных канальцах, что приводит к повышению уровня метотрексата. При введении НПВП, включая диклофенак, менее чем за 24 часа до лечения метотрексатом рекомендуется быть осторожными, поскольку может расти концентрация метотрексата в крови и увеличиваться токсичность этого вещества. Были зарегистрированы случаи серьезной токсичности, когда метотрексат и НПВС, включая диклофенак, применяли с интервалом в пределах 24 часов. Это взаимодействие опосредовано через накопление метотрексата в результате нарушения почечной экскреции в присутствии НПВС.

Циклоспорин. Нестероидные противовоспалительные средства (такие как диклофенак натрия) могут увеличивать нефротоксичность циклоспорина через влияние на простагландины почек. В связи с этим его следует применять в более низких дозах, чем для больных, циклоспорин не получают.

Такролимус. При применении НПВП с такролимусом возможно повышение риска нефротоксичности. Это может быть опосредованно через почечные антипростагландин эффекты НПВС и ингибитора кальциневрина.

Антибактериальные хинолоны. Существуют отдельные данные по судорог, которые могут быть результатом сопутствующего применения хинолонов и НПВС. Это может происходить у пациентов с или без эпилепсии или судорог в анамнезе. Таким образом, следует взвешенно подходить к назначению хинолонов

пациентам, которые уже получают НПВС.

Колестипол и колестирамин. Эти препараты могут вызвать задержку или уменьшения всасывания диклофенака. Таким образом, рекомендуется назначать диклофенак по крайней мере за 1 час до или через 4-6 ч после применения колестипола / колестирамина.

Сердечные гликозиды. Одновременное применение сердечных гликозидов и НПВС у пациентов может усилить сердечную недостаточность, уменьшить скорость клубочковой фильтрации и повысить уровень гликозидов в плазме крови.

Мифепристон. НПВС не следует применять в течение 8-12 дней после применения мифепристона, поскольку НПВП могут уменьшить эффект мифепристона.

Мощные ингибиторы CYP2C9. Необходима осторожность рекомендуется при совместном назначении диклофенака с мощными ингибиторами CYP2C9 (такими как сульфинпиразон и вориконазол), что может привести к значительному увеличению максимальной в плазме крови концентрации и экспозиции диклофенака вследствие угнетения его метаболизма.

Индукторы CYP2C9. Необходима осторожность при одновременном назначении диклофенака с индукторами CYP2C9 (такими как рифампицин), что может привести к значительному увеличению в плазме крови концентрации и экспозиции диклофенака.

Особенности применения

Общие

Побочные эффекты можно минимизировать путем применения минимальной эффективной дозы в течение наименьшего срока, необходимого для контроля симптомов.

Следует избегать применения Диклоберла® N75 с системными НПВС, включая селективные ингибиторы ЦОГ-2, из-за отсутствия какой-либо синергического пользы и возможности развития дополнительных побочных эффектов.

Как и при применении других НПВП, без предварительной экспозиции диклофенака могут также возникнуть аллергические реакции, в том числе анафилактические / анафилактоидные.

Как и другие НПВС, Диклоберл® N75 благодаря своим фармакодинамическим свойствам может маскировать признаки и симптомы инфекции.

Следует четко соблюдать инструкции по внутримышечного введения во избежание побочных реакций в месте введения, что может привести к слабости мышц, паралича мышц, гипестезии и некроза в месте введения.

Влияние на желудочно-кишечный тракт

При применении всех НПВП, включая диклофенак, были зарегистрированы случаи желудочно-кишечных кровотечений (рвота кровью, мелена), образование язвы или перфорации, иногда с летальным исходом. Такие явления могли возникать в любое время в процессе лечения, независимо от наличия симптомов-предвестников или наличии в анамнезе серьезных явлений со стороны желудочно-кишечного тракта. Эти явления обычно имеют более серьезные последствия у пациентов пожилого возраста. Если у пациентов, получающих диклофенак, наблюдаются желудочно-кишечные кровотечения или образования язвы, препарат необходимо отменить.

При применении всех НПВП, включая диклофенак, необходимо тщательное медицинское наблюдение; особую осторожность следует проявлять при назначении диклофенака пациентам с симптомами, свидетельствующими о нарушениях со стороны желудочно-кишечного тракта или с наличием язвы желудка или кишечника, кровотечения и перфорации в анамнезе. Риск желудочно-кишечных кровотечений, образования язв или перфорации выше при увеличении дозы НПВП, включая диклофенак, а также у пациентов с наличием в анамнезе язвы, особенно с осложнениями в виде кровотечения или перфорации.

НПВП, в том числе и диклофенак, могут быть связаны с повышенным риском несостоятельности желудочно-кишечных анастомозов. При применении диклофенака после желудочно-кишечных операций рекомендуется тщательное медицинское наблюдение и осторожность.

Пациенты пожилого возраста

По соображениям безопасности, при лечении пациентов пожилого возраста необходимо проявлять осторожность. В частности, у пациентов пожилого возраста в ослабленном состоянии или с низкой массой тела рекомендуется применение минимальной эффективной дозы.

У пациентов пожилого возраста чаще возникают нежелательные реакции при применении НПВП, особенно таких как желудочно-кишечные кровотечения и

перфорации, которые могут быть летальными.

Чтобы уменьшить риск токсического воздействия на пищеварительную систему у пациентов с язвой в анамнезе, особенно с осложнениями в виде кровотечения или перфорации, и у пациентов пожилого возраста, лечение следует начинать и поддерживать низкими эффективными дозами.

Для таких пациентов, а также больных, нуждающихся сопутствующего применения лекарственных средств, содержащих низкие дозы ацетилсалициловой кислоты (АСК) или других лекарственных средств, которые повышают риск нежелательного воздействия на пищеварительную систему, следует рассмотреть вопрос о комбинированную терапию с применением защитных лекарственных средств (например ингибиторов протонного насоса или мизопростола).

Пациентам с желудочно-кишечным токсичностью в анамнезе, особенно пожилого возраста, необходимо сообщать о любых необычных абдоминальных симптомах (особенно желудочно-кишечные кровотечения). Также рекомендуется соблюдать осторожность при лечении пациентов, получающих сопутствующие препараты, повышающие риск язвы или кровотечения, такие как системные кортикостероиды, антикоагулянты (например варфарин), антитромботические средства (например ацетилсалициловая кислота) или селективные ингибиторы обратного захвата серотонина (СИОЗС).

Влияние на печень

Необходимо проявить осторожность перед тем, как начинать лечение у пациентов с нарушением функции печени, поскольку их состояние может ухудшиться на фоне терапии диклофенаком.

Как и при применении других НПВП, включая диклофенак, уровень одного или более печеночных ферментов может повышаться. При длительном лечении диклофенаком или при его повторном введении следует проводить регулярный контроль функции печени в качестве меры предосторожности.

При появлении клинических признаков патологии печени диклофенак необходимо немедленно отменить.

При применении диклофенака может возникнуть гепатит без предварительных симптомов. Осторожность необходима в случае, если диклофенак применять пациентам с печеночной порфирией, из-за вероятности провокации приступа.

Влияние на почки

Поскольку при лечении НПВС, включая диклофенак, сообщали о задержке жидкости и отек, особое внимание следует уделить больным с нарушением функции сердца или почек, артериальной гипертензией в анамнезе, пациентам пожилого возраста, пациентам, получающим сопутствующую терапию диуретиками или препаратами, которые существенно влияют на почечную функцию, и пациентам с существенным снижением внеклеточного объема жидкости с любой причине, например до или после серьезного хирургического вмешательства. В таких случаях в качестве меры предосторожности рекомендуется мониторинг почечной функции при применении диклофенака. Прекращение терапии обычно приводит возвращение к состоянию, которое предшествовало лечению.

Воздействие на кожу

В связи с приемом НПВС очень редко сообщалось о серьезных реакции со стороны кожи, некоторые из них были летальными, включая эксфолиативный дерматит, синдром Стивенса-Джонсона и токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла). Самый высокий риск развития этих реакций у пациентов наблюдается в начале курса терапии, в большинстве случаев - в течение первого месяца лечения. Применение Диклоберла® N75 необходимо прекратить при первом появлении кожных высыпаний, поражений слизистой оболочки или любых других признаков повышенной чувствительности.

Системная красная волчанка (СКВ) и смешанные заболевания соединительной ткани

Пациенты с СКВ и смешанными заболеваниями соединительной ткани имеют повышенный риск развития асептического менингита.

Сердечно-сосудистые и цереброваскулярные эффекты

Назначать диклофенак пациентам со значительными факторами риска кардиоваскулярных явлений (например, артериальная гипертензия, гиперлипидемия, сахарный диабет, курение) можно только после тщательной клинической оценки. Поскольку кардиоваскулярные риски диклофенака могут расти с увеличением дозы и продолжительности лечения, его необходимо применять как можно более короткий период и в самой эффективной дозе. Следует периодически просматривать потребности пациента в применении диклофенака для облегчения симптомов и ответ на терапию. С осторожностью применять пациентам в возрасте от 65 лет.

Для пациентов с наличием в анамнезе артериальной гипертензии и / или застойной сердечной недостаточности легкой или умеренной степени тяжести

необходимо проведение соответствующего мониторинга и рекомендации, поскольку в связи с приемом НПВС, включая диклофенак, были зарегистрированы случаи задержки жидкости и отеков.

Данные клинических исследований и эпидемиологические данные свидетельствуют, что применение диклофенака, особенно в высоких дозах (150 мг / сут) в течение длительного времени увеличивает риск развития артериальных тромботических событий (например инфаркта миокарда или инсульта).

Пациентам с неконтролируемой артериальной гипертензией, застойной сердечной недостаточностью, устойчивой ишемической болезнью сердца, заболеваниями периферических артерий и / или цереброваскулярной болезнью назначать диклофенак Не рекомендуется, в случае необходимости применение возможно только после тщательной оценки риск-пользы только в дозировке не более 100 мг в сутки.

Применения диклофенака пациентов с выраженными факторами риска развития сердечно-сосудистых явлений (например, артериальная гипертензия, гиперлипидемия, сахарный диабет и курение) следует проводить только после тщательной оценки. Пациенты должны быть проинформированы о признаках и симптомов серьезных антитромботических случаев (например, боль в груди, одышка, слабость, нарушение речи), которые могут возникнуть без предупреждения. В таких случаях пациенту следует немедленно обратиться к врачу.

Реакции повышенной чувствительности могут развиться синдрому Коунис, серьезной аллергической реакции, которая может привести к инфаркту миокарда. Имеющиеся симптомы таких реакций могут включать боль в грудной клетке, возникает при аллергической реакции на диклофенак.

Влияние на гематологические показатели

При длительном применении препарата, как и других НПВП, рекомендуется мониторинг показателей крови.

Как и другие НПВС, Диклоберл® N75 может обратимо угнетать агрегацию тромбоцитов. Следует тщательно наблюдать за пациентами с нарушениями гемостаза, геморрагическим диатезом или гематологическими нарушениями.

Астма в анамнезе

У пациентов с бронхиальной астмой, сезонным аллергическим ринитом, пациентов с отеком слизистой оболочки носа (назальные полипы), хроническими

обструктивными заболеваниями легких или хроническими инфекциями дыхательных путей (особенно связанными с аллергическими, подобными ринитов симптомами), реакции на НПВС, похожие на обострение астмы (так называемая непереносимость анальгетиков / анальгетическое астма), отек Квинке, крапивница возникают чаще, чем у других пациентов. В связи с этим таким пациентам рекомендованы специальные меры (готовность к оказанию неотложной помощи). Это также касается пациентов с аллергией на другие вещества, проявляется кожными реакциями, зудом или крапивницей.

Как и другие препараты, подавляющие активность простагландинсинтетазы, диклофенак натрия и другие НПВС могут спровоцировать развитие бронхоспазма у пациентов, страдающих бронхиальной астмой или у пациентов с бронхиальной астмой в анамнезе.

Фертильность у женщин

Применение Диклоберла® N75 может привести к нарушению фертильности у женщин и не рекомендуется женщинам, которые стремятся забеременеть. Если женщина испытывает трудности с зачатием или проходит обследование по поводу бесплодия, следует рассмотреть вопрос об отмене Диклоберла® N75.

Предупреждения

Бензиловый спирт может вызвать токсические реакции и анафилактические реакции у младенцев в возрасте до 3 лет.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

Пациенты, у которых во время лечения Диклоберлом® N75 наблюдаются нарушения зрения, головокружение, головокружение, сонливость или другие нарушения со стороны центральной нервной системы, должны воздерживаться от управления автотранспортом и работы с механизмами. Особенно это касается одновременного применения с алкоголем.

Предупреждения

Пропиленгликоль, входящей в состав Диклоберла® N75, может вызвать симптомы, напоминающие такие, как после употребления алкоголя.

Применение в период беременности или кормления грудью

Беременность

В I и II триместрах беременности Диклоберл® N75 не следует применять, кроме случаев, когда ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода. В таких случаях рекомендуется применять только в минимальной эффективной дозе, при этом продолжительность лечения должна быть настолько короткой, насколько это возможно. Как и другие НПВС, препарат противопоказан в III триместре беременности (возможно подавление сократительной способности матки и преждевременное закрытие артериального протока у плода).

Ингибирование синтеза простагландинов может негативно сказаться на беременности и/или развития эмбриона/плода. Данные эпидемиологических исследований свидетельствуют о повышенном риске выкидышей и/или риск развития сердечных пороков и гастрошизис после применения ингибитора синтеза простагландинов на ранних сроках беременности. Абсолютный риск сердечно-сосудистых пороков увеличился с менее чем 1% до 1,5%. Не исключено, что риск увеличивается с увеличением дозы и продолжительности лечения.

Было показано, что у животных введение ингибитора синтеза простагландинов приводит к увеличению пре- и постимплантацийних потерь и летальному исходу для 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. Если Диклоберл® N75 применять женщинам, которые стремятся забеременеть, или в I триместре беременности, доза препарата должна быть как можно ниже, а продолжительность лечения - как можно короче.

На III триместра беременности все ингибиторы синтеза простагландинов могут влиять на плод следующим образом:

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

- нарушение функций почек, может прогрессировать до почечной недостаточности с олигогидрамнион.

Влияние на мать и новорожденного, а также в конце беременности:

- возможно увеличение времени кровотечения, антиагрегантный эффект, который может наблюдаться даже при очень низких дозах

- торможение сокращений матки, что приводит к задержке или удлинение родов.

Итак, диклофенак противопоказан на III триместра беременности.

Период кормления грудью

Как и другие НПВС, диклофенак проникает в грудное молоко в небольшом количестве. Таким образом, чтобы избежать нежелательного влияния на младенца, диклофенак не следует применять в период кормления грудью.

Фертильность

Как и другие нестероидные противовоспалительные средства, применение Диклоберла® N75 может повлиять на фертильность женщины, поэтому не рекомендован женщинам, планирующим беременность. Женщины, которые испытывают трудности с зачатием, или те, кто проходит обследование по поводу бесплодия, должны прекратить применение Диклоберла® N75.

Способ применения и дозы

Побочные эффекты можно минимизировать путем применения минимальной эффективной дозы в течение наименьшего возможного срока, достаточного для контроля симптомов.

Взрослые

Лечение Диклоберлом® N75 следует осуществлять в виде однократной инъекции. В случае необходимости лечение можно продолжить, применяя лекарственные формы для перорального или ректального введения. Общая доза не должна превышать 150 мг, даже в день инъекции.

Инъекция

С целью предупреждения повреждения нервных или других тканей в месте инъекции нужно придерживаться следующих инструкций. Поскольку такие повреждения могут приводить к мышечной слабости, паралича мышц и парестезии.

Доза обычно составляет 75 мг (1 ампула) в сутки, которую следует вводить путем глубокой инъекции в верхний наружный сектор большой ягодичной мышцы, используя асептическую технику. В тяжелых случаях (например, колики) суточную дозу можно увеличить до двух инъекций по 75 мг, между которыми придерживаются интервала в несколько часов (по одной инъекции в каждую ягодицу). В качестве альтернативы 75 мг раствора для инъекций можно комбинировать с другими лекарственными формами препарата Диклоберл® (например таблетками или суппозиториями) до максимальной суммарной суточной дозы 150 мг диклофенака натрия.

В условиях приступа мигрени клинический опыт ограничен случаями с начальным применением 75 мг диклофенака; дозу вводить по возможности сразу же после применения суппозиториев по 100 мг в тот же день (в случае необходимости). Общая суточная доза не должна превышать 175 мг в первый день.

Нет доступных данных по применению Диклоберла® N75 для лечения приступов мигрени более чем один день.

Особые группы пациентов

Пациенты пожилого возраста

Хотя у пациентов пожилого возраста фармакокинетика Диклоберла® N75 не ухудшается к любому клинически значимой степени, нестероидные противовоспалительные средства следует применять с осторожностью таким пациентам, которые, как правило, более склонны к развитию побочных реакций. В частности, для ослабленных пациентов пожилого возраста или пациентов с низким показателем массы тела рекомендуется применять самые низкие эффективные дозы (см. Также раздел «Особенности применения»); также пациентов необходимо обследовать по желудочно-кишечных кровотечений при лечении НПВП.

Рекомендуемая максимальная суточная доза Диклоберла® N75 составляет 150 мг.

Нарушение функции почек

При нарушении функции почек легкой и средней степени уменьшения дозы не требуется (для пациентов с тяжелой почечной недостаточностью см. Раздел «Особенности применения»).

Нарушение функции печени

При нарушении функции печени легкой и средней степени уменьшения дозы не требуется (для пациентов с тяжелым нарушением функции печени см. Раздел «Особенности применения»).

Обращение с ампулами системы OPC (one-point cut)

1. Надпиливание ампулы не нужно!
2. Цветной точкой вернуть вверх.
3. Разрешить раствора стечь сверху ампулы вниз путем постукивания или встряхивания.
4. Цветной точкой вернуть вверх.
5. Надломить наконечник ампулы вниз.

Дети

Диклоберл® N75 в лекарственной форме раствора для инъекций противопоказан детям.

Передозировка

Симптомы передозировки.

Типичная клиническая картина последствий передозировки диклофенака отсутствует. Передозировка может вызвать такие симптомы как головная боль, тошнота, рвота, боль в эпигастрии, желудочно-кишечное кровотечение, диарея, головокружение, дезориентация, возбуждение, кома, сонливость, звон в ушах, потеря сознания или судороги. К тому же может быть гипотензия, затрудненное дыхание и цианоз. В случае тяжелого отравления возможна острая почечная недостаточность и поражение печени.

Терапевтические мероприятия при передозировке.

В течение 1 часа после случайного применения потенциально токсичного количества препарата может быть целесообразным применение активированного угля. В качестве альтернативы, для взрослых может потребоваться промывание желудка в течение 1 часа после применения потенциально токсичного количества препарата. При частых или длительных судорогах необходимо внутривенно ввести диазепам. В зависимости от клинического состояния пациента могут быть показаны другие мероприятия. Лечение симптоматическое.

Побочные реакции

При оценке побочных реакций применяют следующие критерии частоты их возникновения: очень часто (≥1 / 10); часто (≥ 1/100, <1/10); нечасто (≥ 1/100, <1/1000); редко (≥ 1/1000, <1/10000) очень редко (<1/10000), частота неизвестна (нельзя оценить по имеющимся данным).

Нижеприведенные побочные реакции включают такие, которые связаны с введением Диклоберла® N75 в условиях краткосрочного или длительного применения.

Инфекции и паразитарные заболевания

Очень редко описывали случаи обострения воспалительных процессов инфекционного происхождения (например, развитие некротизирующего фасциита), что связано с системным применением НПВП. Возможно, это связано с механизмом действия нестероидных противовоспалительных средств.

Если признаки инфекции появляются или ухудшаются при применении Диклоберла® N75, пациенту рекомендуется немедленно обратиться к врачу. Необходимо исследовать, существуют показания для противоинфекционной / антибактериальной терапии.

Очень редко при применении диклофенака наблюдались симптомы асептического менингита, такие как скованность шеи, головная боль, тошнота, рвота, лихорадка или помутнение сознания. К возникновению таких состояний склонны пациенты с аутоиммунными заболеваниями (системная красная волчанка, смешанное заболевание соединительной ткани).

Очень редко абсцесс в месте инъекции.

Со стороны крови и лимфатической системы

Очень редко: нарушение кроветворения (анемия, лейкопения, тромбоцитопения, панцитопения, агранулоцитоз), гемолитическая и апластическая анемия.

Первыми признаками могут быть лихорадка, боль в горле, поверхностные ранки в полости рта, гриппоподобные симптомы, выраженная слабость, носовые кровотечения и кожные кровоизлияния.

При длительном лечении следует регулярно проводить анализ крови.

Со стороны иммунной системы

Часто реакции гиперчувствительности, такие как кожная сыпь и зуд.

Нечасто: крапивница.

В таких случаях пациентам рекомендуется немедленно прекратить прием Диклоберла® N75 и обратиться к врачу.

Редко реакции гиперчувствительности, анафилактические и анафилактоидные реакции (включая сужение дыхательных путей, респираторный дистресс-синдром, учащенное сердцебиение, гипотензия и шок).

Очень редко ангионевротического отека (включая и отек лица).

При развитии хотя бы одного из указанных симптомов, которые могут появиться даже при первом применении, Диклоберл® N75 следует отменить и обеспечить пациенту немедленную медицинскую помощь.

Очень редко аллергический васкулит и пневмонит.

Психиатрические расстройства

Очень редко дезориентация, депрессия, бессонница, ночные кошмары, раздражительность и другие психические расстройства.

Со стороны нервной системы

Часто нарушения со стороны центральной нервной системы, такие как головная боль, головокружение, предобморочное состояние, возбуждение или сонливость.

Редко слабость.

Очень редко парестезии, нарушения ощущения вкуса, нарушения памяти, судороги, тревожность, тремор, асептический менингит, острое нарушение мозгового кровообращения.

Частота неизвестна: спутанность сознания, галлюцинации, нарушение чувствительности, общее недомогание.

Со стороны органов зрения

Очень редко расстройство зрения (затуманивание зрения и диплопия).

Частота неизвестна: неврит зрительного нерва.

Со стороны органов слуха и лабиринта

Часто вертиго.

Очень редко звон в ушах, нарушение слуха.

Со стороны сердца

Очень редко: сердцебиение, боль в груди, сердечная недостаточность, инфаркт миокарда.

Частота неизвестна: синдром Коунис.

Со стороны сосудов

Очень редко: артериальная гипертензия, артериальная гипотензия, васкулит.

Со стороны органов дыхания, грудной клетки и средостения

Редко астма (включая диспноэ).

Очень редко пневмонит.

Со стороны желудочно-кишечного тракта

Часто желудочно-кишечные жалобы, такие как тошнота, рвота и диарея, а также незначительные желудочно-кишечные кровотечения, в редких случаях с развитием анемии, диспепсия, метеоризм, боли в желудке, анорексия.

Редко кровавая рвота, геморрагическая диарея, мелена, гастрит, желудочно-кишечное кровотечение, язвы желудка или кишечника с кровотечением, гастроинтестинальный стеноз с перфорацией (иногда с летальным исходом,

особенно у пациентов пожилого возраста), которые могут привести к перитонита.

Очень редко стоматит (включая язвенный стоматит), глоссит, поражения пищевода, колит (включая геморрагический колит, ишемический колит и обострение язвенного колита или болезнь Крона), запор, диафрагмоподобные стриктуры кишечника, панкреатит.

В случае сильной боли в верхней части живота, при появлении мелены или кровавого рвота пациенту следует прекратить прием лекарственного средства и немедленно обратиться к врачу.

Со стороны печени и желчевыводящих путей

Часто: повышение уровня трансаминаз.

Нечасто: нарушение функции печени, особенно при длительной терапии, гепатит с или без желтухи (в редких случаях возможно мгновенный гепатит даже без предварительных симптомов).

Редко расстройства печени.

Очень редко мгновенный гепатит, гепатонекроз, печеночная недостаточность.

Поэтому при длительном лечении следует регулярно проверять показатели функции печени.

Со стороны кожи и подкожных тканей

Часто кожные высыпания.

Нечасто потеря волос.

Редко: крапивница.

Очень редко: сыпь, экзема, эритема, мультиформная эритема, фотосенсибилизация, пурпура (включая аллергическую пурпура), буллезные высыпания, синдром Стивенса-Джонсона и токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла), эксфолиативный дерматит, зуд.

Со стороны почек и мочевыводящих путей

Нечасто: образование отеков, особенно у больных артериальной гипертензией или с почечной недостаточностью.

Очень редко острое повреждение почек (острая почечная недостаточность), гематурия, протеинурия (интерстициальный нефрит, папиллярный некроз почек). Нефротический синдром.

Поэтому следует регулярно проверять функцию почек.

Общие нарушения и нарушения в месте введения

Часто реакции в месте инъекции, боль в месте инъекции, уплотнения в месте инъекции.

Редко отек, некроз в месте инъекции.

Очень редко абсцесс в месте инъекции.

Со стороны репродуктивной системы и молочных желез

Очень редко импотенция.

Данные клинических исследований и эпидемиологические данные свидетельствуют о повышенном риске артериальных тромботических явлений (например инфаркта миокарда или инсульта), связанный с применением диклофенака, в частности в высоких дозах (150 мг в сутки) и при длительном применении.

Зрительные нарушения

Такие зрительные нарушения, как ухудшение зрения, затуманивание зрения и диплопия, является эффектами класса НПВП и, как правило, обратимы после отмены препарата. Наиболее вероятным механизмом нарушений зрения является ингибирование синтеза простагландинов и других родственных соединений, нарушая регуляцию ретинального кровотока, способствуют развитию визуальных нарушений. Если такие симптомы возникают во время применения диклофенака, необходимо провести офтальмологическое исследование для исключения других возможных причин.

Другие возможные побочные реакции

В редких случаях возможны реакции гиперчувствительности на бензиловый спирт.

Сообщение о подозреваемых побочные реакции

Сообщение о подозреваемых побочные реакции после регистрации лекарственного средства играют важную роль. Это позволяет наблюдение за соотношением польза / риск в отношении данного лекарственного средства. Работников здравоохранения просят сообщать о любых подозреваемые побочные реакции.

Срок годности

3 года.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 30 ° С!

Для защиты от действия света ампулы хранить в оригинальной упаковке.

Хранить в недоступном для детей месте!

Упаковка

По 3 мл в ампуле с бесцветного стекла, по 5 ампул в картонной коробке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

А. Менарини Мануфактуринг Логистикс енд Сервисес С.р.Л.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Виа Сете Санти 3, 50131 Флоренция (ФИ), Италия.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника —

Государственного реестра лекарственных средств Украины.