

І Н С Т Р У К Ц І Я
для медичного застосування препарату
ВОЛЬТАРЕН РАПІД
(VOLTAREN RAPID)

Склад:

діюча речовина: диклофенак калію;

1 таблетка містить диклофенаку калію 25 мг;

допоміжні речовини: внутрішній вміст таблетки – кремнію діоксид колоїдний безводний, кальцію фосфат триосновний, магнію стеарат, крохмаль кукурудзяний, повідон, натрію крохмальгліколят; покриття таблетки - целюлоза мікрокристалічна, заліза оксид, титану діоксид, повідон, макрогол 8000, цукроза, тальк.

Лікарська форма. Таблетки, вкриті оболонкою.

Фармакотерапевтична група. Нестероїдні протизапальні та протиревматичні засоби. Код АТС M01AB05.

Фармакологічні властивості.*Фармакодинаміка.*

Таблетки Вольтарен Рапід (діюча речовина – диклофенак калію) — нестероїдний протизапальний засіб (НПЗП) з вираженими знеболювальним, протизапальним та жарознижуючим ефектами. Інгібіція біосинтезу простагландинів — основний принцип механізму дії. Простагландини відіграють основну роль в виникненні запалення, болю і лихоманки.

Таблетки Вольтарен Рапід 25 мг починають діяти через короткий час після прийому, тому препарат застосовують при гострому болю і для зниження підвищеної температури тіла. Вольтарен Рапід швидко послаблює біль завдяки вираженому знеболювальному ефекту.

Диклофенак калію *in vitro* в концентраціях, еквівалентних до тих, які застосовуються у людей, не чинить супресорної дії на біосинтез протеоглікану в тканині хряща.

*Фармакокінетика.**Абсорбція*

Диклофенак швидко і повністю абсорбується. Після прийому 25 мг препарату середні пікові концентрації 2 мкмоль/л в плазмі крові досягаються приблизно через 35 хвилин (середнє значення T_{max}). Одночасний прийом їжі не впливає на абсорбцію диклофенаку, хоча початок і рівень абсорбції може дещо уповільнюватись.

Абсорбована кількість препарату знаходиться лінійній пропорції до величини прийнятої дози.

Оскільки близько половини диклофенаку метаболізується протягом його першого проходження через печінку (ефект “першого проходу”), область під кривою концентрації відповідає приблизно половині перорально прийнятої дози, що спостерігається і при парентеральному введенні еквівалентної дози.

Фармакокінетичні характеристики не змінюються після повторного прийому препарату. Не спостерігалось накопичення препарату при прийомі в рекомендованих дозах.

Розподіл

99,7% диклофенаку зв'язується з протеїнами сироватки крові, переважно з альбуміном (99,4%). Явний об'єм розподілу складає 0,12–0,17 л/кг.

Диклофенак проникає в синовіальну рідину, де максимальні концентрації досягаються через 2–4 години після досягнення пікових значень в плазмі крові. Очевидний період напіввиведення з синовіальної рідини складає від 3 до 6 годин. Через 2 години після досягнення пікових рівнів у плазмі крові, концентрації діючої речовини вищі в синовіальній рідині, ніж в плазмі, і залишаються вищими ще до 12 годин.

Біотрансформація

Біотрансформація диклофенаку частково відбувається шляхом глюкуронидації інтактною молекулою, але переважно – одинарним і багаторазовим гідроксилюванням та метоксилюванням, внаслідок чого утворюється кілька фенольних метаболітів, більшість яких є конвертованими глюкоронідними кон'югатами. Двоє з фенольних метаболітів є біологічно активними, але значно меншої активності в порівнянні з диклофенаком.

Виведення

Повний системний кліренс диклофенаку з плазми крові складає 263–56 мл/хв. Термінальний період напіввиведення з плазми крові складає від 1 до 2 годин. Чотири з метаболітів, включаючи 2 активних, також мають короткий період напіввиведення з плазми крові — від 1 до 3 годин. П'ятий метаболіт, 3'-гідрокси-4'-метокси-диклофенак, має набагато довший плазматичний період напіввиведення. Цей метаболіт фактично неактивний.

Близько 60% прийнятої дози екскретується з сечею у вигляді глюкоронідних сполук інтактних молекул і у вигляді метаболітів, більшість яких також перетворені в глюкоронідні сполуки. Менше 1% екскретується в незміненому вигляді. Решта прийнятої дози виводиться з жовчю у вигляді метаболітів в калі.

Окремі групи пацієнтів

Немає значущих даних щодо залежних від віку відмінностей в абсорбції препарату, метаболізмі або виведенні.

У пацієнтів з порушенням функції нирок не спостерігається накопичення незміненої активної субстанції в кінетиці кожної прийнятої дози при застосуванні препарату в звичайному дозовому режимі. При кліренсі креатиніну менше ніж 10 мл/хв, стійкі рівні гідроксиметаболітів в плазмі крові близько в 4 рази вищі, ніж у пацієнтів з нормальним кліренсом креатиніну. Проте, метаболіти виводяться з жовчю.

У пацієнтів з хронічним гепатитом або недокомпенсованим цирозом кінетика і метаболізм диклофенаку такі ж, як у пацієнтів без захворювань печінки.

Назва і місцезнаходження виробника.

Новартіс Урунлері, Туреччина.

Стамбул, Туреччина.

Назва і місцезнаходження заявника.

Новартіс Фарма АГ, Швейцарія.

Базель, Швейцарія.

Клінічні характеристики.

Показання.

Ревматизм, ревматоїдний артрит, остеоартрит, алкілозуючий спондиліт, подагра, люмбаго, невралгія, міалгія, біль при травматичних пошкодженнях опорно-рухового апарату та м'яких тканин, первинна дисменорея.

Протипоказання.

Відома гіперчутливість до диклофенаку або будь-якого іншого компонента препарату.

Пацієнтам, у яких при прийомі ацетилсаліцилової кислоти чи інших НПЗП (наприклад, ібупрофен) розвивається приступ ядухи, кропив'янка або гострий риніт.

Виразка, кровотеча або перфорація шлунку або кишечника.

Останній тримістр вагітності

Тяжка форма недостатності функції печінки, нирок чи серця.

Належні заходи з безпеки при застосуванні.

Застосування у період вагітності та годування груддю.

Вагітність

Дослідження застосування диклофенаку у вагітних жінок не проводились. Вольтарен Рапід не слід приймати протягом перших двох триместрів вагітності, за винятком, якщо потенційна перевага

прийому препарату для матері вища за ризик для плоду. Як із іншими НПЗП, прийом препарату протягом третього триместра вагітності є протипоказанням, оскільки існує можливість відсутності скорочень матки і/або передчасного закриття Боталового протоку. Вивчення на тваринах не показали прямого або непрямого шкідливого впливу на вагітність, ембріональний/фетальний розвиток, роди або постнатальний розвиток.

Годування груддю

Подібно до інших НПЗП, диклофенак проникає в грудне молоко в невеликих кількостях, тому Вольтарен Рапід не слід призначати протягом періоду годування груддю щоб уникнути розвитку побічних ефектів у дитини.

Діти.

Препарат не рекомендований дітям у віці до 14 років.

Особливості застосування.

Попередження

Про гастроінтестинальну кровотечу, виразку або перфорацію, які можуть бути фатальними, повідомлялось при застосуванні всіх НПЗП; ці ускладнення можуть виникати в будь-який час протягом лікування, із/без симптомів-передвісників або серйозних гастроінтестинальних ускладнень в анамнезі. Вони, загалом, мають серйозніші наслідки у літніх пацієнтів. Якщо гастроінтестинальна кровотеча або виразка виникають у пацієнтів, які приймають диклофенак, препарат слід відмінити.

Про серйозні реакції шкіри, іноді фатальні, зокрема ексфолювативний дерматит, синдром Стівенса-Джонсона і токсичний епідермальний некроліз, рідко повідомлялось при застосуванні НПЗП, зокрема диклофенаку. Ризик виникнення цих побічних реакцій вищий на початку курсу лікування, більшість випадків побічних ефектів спостерігається протягом першого місяця лікування. Прийом диклофенаку необхідно припинити при перших проявах висипу на шкірі, враженнях слизових оболонок або будь-якого іншого ознаку гіперчутливості. Як з іншими НПЗП, алергічні реакції, включаючи анафілактичні/анафілактоїдні реакції, можуть виникати в окремих випадках без попереднього прийому диклофенаку.

Подібно до інших НПЗП, диклофенак може маскувати ознаки і симптоми інфекції, що зумовлено його фармакодинамічними властивостями.

Вказівки

Загальні

Слід уникати одночасного призначення диклофенаку та НПЗП системної дії, включаючи селективні інгібітори ЦОГ-2, оскільки немає підтверджень про переваги синергічної дії та потенційний розвиток додаткових побічних ефектів.

З обережністю призначають пацієнтам похилого віку, після медичного обґрунтування. Зокрема, рекомендовано призначати найнижчі ефективні дози фізично слабким пацієнтам літнього віку чи якщо маса тіла нижча за норму.

Таблетки Вольтарен Рапід містять цукрозу і тому не рекомендовані пацієнтам з рідкими формами спадкової непереносимості фруктози, глюкозо-галактозної мальабсорбції чи недостатності сахарози-ізомальтози.

Астма

У пацієнтів з астмою, сезонним алергічним ринітом, набряком слизової оболонки носа (наприклад, назальні поліпи), ХОЗЛ чи хронічними інфекціями респіраторного тракту (особливо з проявами, подібними до симптомів алергічного риніту) при прийомі НПЗП частіше ніж у інших пацієнтів виникають такі побічні ефекти, як пароксизми астми (так названа, непереносимість анальгетиків або астма на анальгетики), набряк Квінке, кропивниця. Вищевказане також стосується пацієнтів, у яких спостерігались алергічні прояви при прийомі інших препаратів, наприклад, реакції шкіри, свербіж, кропивниця.

Вплив на ШКТ

Як з іншим НПЗП, обережність і пильний медичний нагляд являється імперативним при призначенні

диклофенаку пацієнтам з симптомами, що вказують на порушення функції ШКТ, чи з підозрою виразки, кровотечі або перфорації шлунку або кишечника в анамнезі (див. розділ Побічні ефекти). Ризик виникнення кровотечі ШКТ підвищується при: збільшенні дози НПЗП; у пацієнтів з виразкою в анамнезі, особливо якщо було ускладнення (кровотеча або перфорація); у пацієнтів похилого віку.

Для зменшення ризику токсичного впливу на ШКТ у пацієнтів з виразкою в анамнезі, особливо якщо було ускладнення (кровотеча або перфорація) і пацієнтам похилого віку лікування слід починати та підтримувати в найнижчих ефективних дозах. Для цих пацієнтів слід обдумати призначення комбінованої терапії з інгібіторами протонної помпи, місопростолом, а також для пацієнтів, яким необхідний одночасний прийом ацетилсаліцилової кислоти чи інших препаратів, що підвищують ризик шкідливого впливу на ШКТ.

Пацієнти з токсичним впливом на ШКТ в анамнезі, особливо літнього віку, повинні повідомити лікаря про появу будь-яких незвичайних симптомів з боку ШКТ (особливо про кровотечу з ШКТ). З обережністю призначають препарат пацієнтам, які одночасно приймають препарати, що можуть підвищувати ризик розвитку виразки чи кровотечі (кортикостероїди системної дії, антикоагулянти, антиагрегантні препарати чи селективні інгібітори серотонінового захвату).

Постійний медичний нагляд потрібно забезпечити пацієнтам з виразковим колітом або хворобою Крона, оскільки їх стан може погіршитися.

Вплив на печінку

Постійний медичний нагляд потрібно забезпечити пацієнтам з порушенням функції печінки, оскільки їх стан може погіршитися.

Як і при застосуванні інших НПЗП, можуть зростати рівні одного або більше ферментів печінки. У випадку, якщо диклофенак призначають на тривалий період, застережним засобом є регулярне спостереження за функцією печінки. Прийом диклофенаку потрібно припинити якщо: спостерігається порушення або погіршення функції печінки, клінічні ознаки або симптоми свідчать про розвиток хвороби печінки, виникають інші симптоми, наприклад, еозинофілія, висип. Гепатит може виникати без предромальних симптомів.

З обережністю призначають диклофенак хворим з печінковою порфірією, оскільки можливе погіршення стану.

Вплив на нирки

Оскільки повідомлялось про затримку рідини і набряк в зв'язку з прийомом НПЗП, з обережністю призначають препарат пацієнтам: з порушенням функції серця або нирок; з підвищенням кров'яного тиску в анамнезі; літнього віку; тим, хто одночасно приймає сечогінні препарати або лікарські засоби, що можуть значно впливати на функцію нирок; з істотним зменшенням об'єму позаклітинної рідини з будь-якої причини, наприклад перед/після хірургічних втручань. При призначенні в таких випадках диклофенаку проводять контроль функції нирок. Після припинення терапії стан, зазвичай, нормалізується.

Гематологічні ефекти

Препарат Вольтарен Рапід рекомендовано застосовувати тільки протягом декількох днів. Якщо Вольтарен Рапід призначають на довший або тривалий період, рекомендовано (як і для інших НПЗП) контролювати гемограму.

Подібно до інших НПЗП, диклофенак може тимчасово інгібувати агрегацію тромбоцитів. Слід ретельно спостерігати хворих з порушеннями гемостазу.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

Зазвичай, при прийомі препарату в рекомендованій низькій дозі і при короткому курсі лікування, впливу на швидкість реакції не спостерігається. Проте, пацієнти, у яких виникають порушення зору, запаморочення, вертиго, сонливість або інші порушення функції ЦНС при прийомі диклофенаку, повинні утримуватися від керування автотранспортом або механізмами.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші форми взаємодій.

Інструкцію завантажено з сайту www.dovgolit.com

Наступні форми взаємодії включають взаємодії, які спостерігались при прийомі диклофенаку у високих дозах та інших фармацевтичних формах.

Літій. При одночасному застосуванні диклофенак може підвищувати концентрації літію в плазмі крові. Рекомендовано проводити контроль рівню літію в сироватці крові.

Дигоксин. При одночасному застосуванні диклофенак може підвищувати концентрації дигоксину в плазмі крові. Рекомендовано проводити контроль рівню літію в сироватці крові.

Сечогінні і антигіпертензивні засоби. Як і з іншими НПЗП, одночасне призначення диклофенаку та сечогінних або антигіпертензивних препаратів (наприклад, бета-блокатори, інгібітори ангіотензин-перетворюючого ферменту) може призводити до зниження антигіпертензивного ефекту. Тому, комбінацію цих препаратів призначають з обережністю; пацієнтам, особливо літнього віку, слід періодично контролювати рівень АТ. Пацієнти повинні отримувати адекватні дози рідини; слід проводити контроль функції нирок після початку супутньої терапії і надалі періодично, особливо при прийомі сечогінних засобів і інгібіторів АПФ з причини підвищеного ризику нефротоксичного впливу. Супутнє лікування з калійзберігаючими діуретиками може викликати підвищення рівню калію в сироватці крові, тому рівні калію слід часто перевіряти (див. розділ 4.4 Спеціальні попередження і вказівки щодо використання).

Інші НПЗП і кортикостероїди. Одночасне призначення диклофенаку та інших НПЗП системної дії або кортикостероїдів може збільшувати частоту розвитку гастроінтестинальних побічних ефектів (див. розділ 4.4 Спеціальні попередження і вказівки щодо використання).

Антикоагулянти і антиагреганти призначають з обережністю, оскільки одночасний прийом може підвищувати ризик розвитку кровотечі (див. розділ 4.4 Спеціальні попередження і застереження щодо використання). Хоча клінічні дослідження не вказують на те, що диклофенак впливає на дію антикоагулянтів, є окремі повідомлення про підвищення ризику розвитку кровотечі у пацієнтів, які приймають одночасно диклофенак і антикоагулянти. Рекомендоване постійне спостереження стану таких пацієнтів.

Селективні інгібітори серотонінового захвату (СІСЗ). Одночасне призначення НПЗП системної дії і СІСЗ може підвищувати ризик розвитку ШКТ-кровотечі (див. розділ 4.4 Спеціальні попередження і вказівки щодо використання).

Антидіабетичні препарати. Клінічні дослідження показали, що диклофенак можна призначати одночасно з пероральними антидіабетичними препаратами без впливу на їх клінічний ефект.

Проте, були окремі повідомлення про гіперглікемію та гіпоглікемію, що потребує змін в дозуванні антидіабетичних препаратів протягом лікування диклофенаком. Рекомендований контроль рівня глюкози в крові протягом супутньої терапії.

Метотрексат. З обережністю призначають НПЗП за менше, ніж 24 години перед або після лікування Метотрексатом, оскільки концентрації Метотрексату можуть підвищуватись і токсичність, відповідно, збільшуватись.

Циклоспорин. Диклофенак, як і інші НПЗП, може підвищувати нефротоксичність циклоспорину з причини впливу на ниркові простогландини. Тому, диклофенак потрібно призначати в дозах нижчих за ті, що призначаються пацієнтам, які не отримують циклоспорин.

Антибіотики хінолонового ряду. Були окремі повідомлення про розвиток судом, що, можливо, пов'язано з одночасним прийомом хінолонів та НПЗП.

Спосіб застосування та дози.

Препарат застосовують внутрішньо. Таблетку потрібно проковтнути і запити водою.

Як рекомендовано загальною практикою, препарат слід приймати в найнижчих ефективних дозах та протягом найкоротшого курсу лікування.

Дорослі і діти у віці 14 років та старші: по 1 таблетці при виникненні симптомів, з прийомом послідувочої таблетки (якщо необхідно) через 4–6 годин. Не слід приймати більше 3 таблеток протягом 24 годин.

Діти: таблетки Вольтарен Рапід не рекомендовано призначати дітям у віці молодше 14 років.

Передозування.

Симптоми. Типової клінічної картини при передозуванні диклофенаку немає. При передозуванні можуть виникати такі симптоми: блювання, гастроінтестинальна кровотеча, пронос, запаморочення, дзвін у вухах або конвульсії. В випадку тяжкого отруєння можливий розвиток гострої ниркової недостатності і враження печінки.

Лікування. Лікування гострого отруєння НПЗП зазвичай заключається в проведенні підтримуючих заходів і симптоматичного лікування при таких ускладненнях як гіпотонія, ниркова недостатність, конвульсії, порушення функції ШКТ, пригнічення дихання.

Проведення спеціальних заходів, таких як форсований діурез, діаліз або гемоперфузія не сприяють виведенню НПЗП із організму по причині високого ступеня зв'язування з протеїнами і екстенсивного метаболізму.

У разі потенційно токсичного передозування — прийняти активоване вугілля; у разі потенційно небезпечного для життя передозування — провести випорожнення шлунку (блювання, промивання шлунку).

Побічні реакції.

Побічні ефекти класифікуються за частотою виникнення (спочатку найчастіші) з використанням наступного правила: часто ($\geq 1/100$, $< 1/10$); нечасто ($\geq 1/1,000$, $< 1/100$); рідко ($\geq 1/10,000$, $< 1/1,000$); дуже рідко ($< 1/10,000$), включаючи поодинокі випадки. Нижчеперелічені побічні ефекти включають повідомлення, які отримані при тривалому прийомі диклофенаку у вищих дозах.

Порушення функції системи крові та лімфатичної системи: дуже рідко – тромбоцитопенія, лейкопенія, анемія (включаючи гемолітичну і апластичну анемію), агранулоцитоз.

Порушення функції імунної системи: рідко – гіперчутливість, анафілактична і анафілактоїдна реакція (зокрема гіпотонію і шок; дуже рідко – ангіоневротичний набряк (зокрема набряк обличчя).

Порушення психіки: дуже рідко – дезорієнтація, депресія, безсоння, страшні сновидіння, дратівливість, психотичні порушення.

Порушення функції ЦНС: часто – головний біль, запаморочення; рідко – сонливість; дуже рідко – парестезія, погіршення пам'яті, конвульсії, неспокій, тремор, асептичний менінгіт, порушення смаку, цереброваскулярні ускладнення.

Порушення функції зору: дуже рідко – порушення зору, нечіткість зору, диплопія.

Порушення функції слуху та лабіринту: часто – вертиго; дуже рідко – дзвін у вухах, погіршення слуху.

Порушення функції серця: дуже рідко – серцебиття, біль в грудях, серцева недостатність, інфаркт міокарду.

Порушення функції судин: дуже рідко – підвищений кров'яного тиску, васкуліт.

Порушення функції респіраторного тракту, органів торакального та медіастинального відділів: рідко – астма (включаючи диспное); дуже рідко – пневмоніт.

Порушення функції ШКТ: часто – нудота, блювання, пронос, диспепсія, абдомінальний біль, метеоризм, анорексія; рідко – гастрит, гастроінтестинальна кровотеча, блювота кров'ю, геморагічна діарея, мелена, гастроінтестинальна виразка (з або без кровотечі або перфорації); дуже рідко – коліт (включаючи геморагічний коліт і загострення виразкового коліту або хвороби Крона), запор, стоматит, глосит, езофагеальні порушення, діафрагмальноподібна інтестинальна стриктура, панкреатит.

Порушення функції гепатобіліарного тракту: часто – підвищення рівня трансаміназ; рідко – гепатит, жовтуха, порушення функції печінки; дуже рідко – фульмінантний гепатит.

Шкіра та підшкірно-жирова тканина: часто – висип; рідко – кропив'янка; дуже рідко – бульозний висип, екзема, еритема, мультиформна еритема, синдром Стівенса-Джонсона, токсичний епідермальний некроліз (синдром Лайела), ексфолюативний дерматит, посилене випадіння волосся, реакція фоточутливості, пурпура, алергічна пурпура, свербіж.

Порушення функції нирок та сечовивідного тракту: дуже рідко – гостра ниркова недостатність, гематурія, протеїнурія, нефротичний синдром, інтерстиціальний нефрит, медулярний некроз нирки.

Загальні порушення та пов'язані зі способом введення: рідко – набряк.

Термін придатності.

3 роки.

Умови зберігання.

Зберігати при температурі не вище 30°C. Запобігати впливу вологи. Зберігати в недоступному для дітей місці. Препарат не слід використовувати після закінчення терміну придатності, зазначеного на упаковці.

Упаковка.

По 10 таблеток в блістері, по 3 блістера в картонній коробці.

Категорія відпуску. Без рецепту.