

**ІНСТРУКЦІЯ**  
**для медичного застосування препарату**  
**ДИКЛОФЕНАК**

**Склад:**

*діюча речовина:* натрію диклофенак;

1 мл розчину містить 25 мг диклофенаку натрію;

*допоміжні речовини:* маніт (Е 421), натрію метабісульфіт (Е 223), пропіленгліколь, спирт бензиловий, натрію гідроксид, вода для ін'єкцій.

**Лікарська форма.** Розчин для ін'єкцій.

**Фармакотерапевтична група.** Нестероїдні протизапальні і протиревматичні засоби. Диклофенак.  
Код АТС М01А В05.

**Клінічні характеристики.**

**Показання.** Запальні і дегенеративні форми ревматичних захворювань (ревматоїдний артрит, анкілозуючий спондиліт, остеоартроз, спондилоартрити), больові синдроми з боку хребта, ревматичні захворювання позасуглобових м'яких тканин, гострі напади подагри, посттравматичні і післяопераційні больові синдроми, що супроводжуються запаленням і набряком, напади мігрені тяжкого перебігу, ниркова і жовчна коліки.

**Протипоказання.** Ерозивно-виразкові ураження шлунково-кишкового тракту, тяжкі порушення функції печінки і/або нирок, порушення системи кровотворення, вказівки в анамнезі на захворювання на бронхіальну астму, кропив'янку або гострий риніт, що пов'язані із застосуванням нестероїдних протизапальних засобів, дитячий вік до 18 років, вагітність, період годування груддю, підвищена індивідуальна чутливість до компонентів препарату або інших нестероїдних протизапальних засобів.

**Спосіб застосування та дози.** Дорослим глибоко внутрішньом'язово у сідничний м'яз.

*Порядок роботи з ампулою:*

1. Відокремити одну ампулу від блоку і струснути її, утримуючи за горлечко (рис. 1).
2. Стиснути ампулу рукою (при цьому не повинно відбуватися виділення препарату) і обертаючими рухами звернути і відокремити голівку (рис. 2).
3. Через отвір, що утворився, негайно з'єднати шприц з ампулою (рис. 3).
4. Перевернути ампулу і повільно втягнути в шприц її вміст (рис. 4).
5. Надіти голку на шприц.





рис. 1

рис. 2.

рис. 3

рис. 4

Звичайно вводять по 1 ампулі (3 мл = 75 мг диклофенаку натрію) на день глибоко у верхньозовнішній квадрант сідничного м'яза. У гострих випадках (наприклад, при кольці) денна доза може бути збільшена до 150 мг: по 1 ампулі двічі на день (по одній у кожен сідницю).

Тривалість курсу терапії розчином диклофенаку натрію становить 2 - 5 діб, у разі потреби лікування може бути продовжене з призначенням пероральних або ректальних форм препаратів диклофенаку натрію. При цьому не слід перевищувати загальну максимальну добову дозу диклофенаку натрію (150 мг), у тому числі у день ін'єкції препарату.

**Побічні реакції.** З боку системи травлення: нудота, блювання, діарея, шлунково-кишкові кровотечі (ризик розвитку особливо залежить від діапазону доз та тривалості застосування), що можуть призводити до анемії; в окремих випадках - диспепсія, спазми у животі, анорексія, розвиток шлунково-кишкових виразок (з можливістю кровотечі та перфорації), панкреатит; зрідка – мелена, кривава діарея, підвищення рівнів сироваткових трансаміназ; в окремих випадках - стоматит, глосит, подразнення стравоходу, загострення виразкового коліту, запор, розвиток діафрагмально-кишкових структур, гепатит з жовтяницею або без неї (іноді з блискавичним перебігом, навіть без продромальних симптомів).

З боку системи крові: у поодиноких випадках - анемія, лейкопенія, агранулоцитоз, тромбоцитопенія, в окремих випадках - алергічний васкуліт, гемолітична анемія.

З боку серцево-судинної системи: в окремих випадках - тахікардія, біль у грудній клітці, зміни артеріального тиску.

З боку нервової системи: зрідка - головний біль, збудження, дратівливість, слабкість, сонливість та запаморочення, порушення тактильної або смакової чутливості, порушення функції зору (розпливчастість зору або диплопія), дзвін у вухах, оборотні порушення слуху, порушення пам'яті, дезорієнтація, посмикування м'язів, тривожність, тремор, депресія.

З боку дихальної системи: алергічна пневмонія, пульмоніт.

З боку сечовидільної системи: зрідка - периферичні набряки, особливо у пацієнтів з високим артеріальним тиском або порушеннями функцій нирок, ушкодження тканини нирок (інтерстиціальний нефрит, папілярний некроз) з проявами гострої ниркової недостатності, протеїнурії та/або гематурії; в окремих випадках - нефротичний синдром.

З боку шкірних покривів: шкірні висипи, свербіж, кропив'янка, алопеція; в окремих випадках - бульозна екзантема, екзема, еритема, фоточутливість, пурпура (у тому числі алергічна), синдром Стівенса-Джонсона, синдром Лайєлла.

Алергічні реакції: набряк обличчя, язика та внутрішньої поверхні гортані зі спазмом дихальних шляхів, порушення функції дихання і, зокрема астматичні напади, тахікардія, падіння артеріального тиску із блискавичною шоковою реакцією. При появі одного з цих симптомів, що завжди можливо при першому застосуванні, слід надати невідкладну медичну допомогу.

Місцеві реакції: стерильний абсцес, некроз підшкірно-жирової клітковини.

Інші: в окремих випадках - асептичний менінгіт, зокрема напруженість шийних м'язів, пропасниця або порушення свідомості. До таких реакцій схильні пацієнти з аутоімунними захворюваннями

(червоний вовчак, змішані колагенози).

**Передозування.** При перевищенні рекомендованих доз та тривалості лікування можливі токсичні прояви з боку гастроінтестинальної системи (біль у животі, нудота, блювання, шлунково-кишкові кровотечі, порушення функцій печінки та нирок), артеріальна гіпотензія, пригнічення дихання, нефротоксичність (навіть до гострої ниркової недостатності) і токсична дія на центральну нервову систему (головний біль, запаморочення, сонливість та непритомність). *Лікування:* симптоматична і підтримуюча терапія, моніторинг життєвих функцій. У випадку ушкодження нирок призначають допамін або добутамін, при значній гіпотензії застосовують плазмозамінники, при судомах – діазепам або інші бензодіазепіни. Специфічного антидоту не існує.

**Застосування у період вагітності або годування груддю.** Прийом препарату під час вагітності протипоказаний. Диклофенак у невеликій кількості виділяється в грудне молоко, тому в період лікування препаратом годування груддю необхідно припинити.

**Діти.** Не застосовують пацієнтам віком до 18 років у зв'язку з відсутністю достатнього досвіду застосування ін'єкційних препаратів диклофенаку хворим цієї вікової категорії.

**Особливості застосування.** Застосовувати з обережністю пацієнтам з анемією, бронхіальною астмою (можливе загострення симптомів астми), застійною серцевою недостатністю, артеріальною гіпертензією, при набряковому синдромі, печінковій і/або нирковій недостатності, запальних захворюваннях кишечника, цукровому діабеті, при зменшенні об'єму позаклітинної рідини (наприклад, після поширених хірургічних втручань), індукованій порфірії, при дивертикуліті, системних захворюваннях сполучної тканини.

Хворим на гемофілію та з порушеннями гемостазу препарат застосовують лише під контролем лікаря.

Хворим літнього віку препарат призначається з обережністю і в мінімально ефективних дозах.

Під час лікування, особливо тривалого, необхідно контролювати показники функції печінки і нирок, рівень глюкози в крові (здебільшого у хворих на цукровий діабет), стан периферичної крові.

При підозрі на виникнення виразок або кровотечі в шлунково-кишковому тракті, в т.ч. безсимптомних, застосування диклофенаку потрібно негайно припинити.

**Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами.** Не слід застосовувати під час роботи особам, які керують транспортними засобами, або працюють з потенційно небезпечними механізмами.

**Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.** Диклофенак може підвищувати плазмові рівні дигоксину, літію, метотрексату, циклоспорину.

Ацетилсаліцилова кислота зменшує концентрацію диклофенаку в плазмі крові.

Препарати, що блокують каналцеву секрецію, підвищують концентрацію в плазмі диклофенаку, тим самим підвищуючи його токсичність.

Послаблює ефекти гіпотензивних і снодійних засобів, знижує активність діуретиків і салуретиків групи тіазиду і фуросеміду, при застосуванні калійзберігаючих діуретиків підсилюється ризик гіперкаліємії.

Одночасне призначення з іншими нестероїдними протизапальними засобами і глюкокортикоїдами збільшує ризик виникнення побічних ефектів, застосування з парацетамолом підвищує ризик розвитку нефротоксичних ефектів диклофенаку, застосування з етанолом, колхіцином, кортикотропіном і препаратами звіробією підвищує ризик розвитку кровотеч у шлунково-кишковому тракті.

При застосуванні одночасно з антикоагулянтами і тромболітичними засобами підвищується ризик розвитку кровотеч (частіше шлунково-кишкових), тому під час зазначеної сумісної терапії слід контролювати стан системи згортання крові.

Диклофенак може застосовуватися разом із пероральними цукрознижувальними засобами, але відомі окремі випадки необхідності змін дозування гіпоглікемічних засобів під час лікування диклофенаком.

Цефамандол, цефоперазон, цефотетан, вальпроева кислота, плікамідин збільшують частоту розвитку гіпопротромбемії.

Диклофенак збільшує токсичність метотрексату (тому не повинен застосовуватися раніше, ніж за 24 години до або після терапії метотрексатом), збільшує нефротоксичність циклоспорину.

З обережністю призначають разом із хінолонами через небезпеку виникнення судом.

Диклофенак підсилює дію препаратів, що спричиняють фотосенсибілізацію.

### **Фармакологічні властивості.**

*Фармакодинаміка.* Нестероїдний протизапальний, анальгетичний, протиревматичний засіб. Механізм дії зумовлений пригніченням біосинтезу простагландинів шляхом зворотного блокування циклооксигенази, зменшенням утворення кінінів та інших медіаторів запалення та болю, стабілізуючим впливом на лізосомальні мембрани. При ревматичних захворюваннях зменшує набряк, гіперемію та біль у стані спокою і при русі, ранкову скутість і припухлість суглобів, сприяє збільшенню об'єму рухів уражених суглобів. У післятравматичному і післяопераційному періодах ефективно зменшує біль (як в стані спокою, так і під час фізичної активності), припухлість і набряки.

*Фармакокінетика.* Після внутрішньом'язового введення 75 мг диклофенаку максимальна концентрація досягається приблизно через 15 - 30 хв і становить в середньому 2,7 мкг/мл. Поглинена кількість знаходиться у лінійній пропорції до величини дози. Понад 99 % диклофенаку зв'язується з білками крові. Диклофенак добре розподіляється у тканинах і рідинах організму. У синовіальній рідині високі концентрації досягаються і підтримуються протягом 3 - 6 годин. Біотрансформується в печінці шляхом гідроксилювання та глюкуронізації за участі ферментної системи цитохрому P<sub>450</sub> CYP2C9. Фармакологічна активність метаболітів нижча, ніж у диклофенаку. Період напіввиведення з плазми становить приблизно 2 години. Екскреція відбувається переважно нирками (приблизно 60 % введеної дози), головним чином, у вигляді метаболітів, у незміненому стані – 1 %. Решта виділяється кишечником у вигляді метаболітів. При дотриманні рекомендованого режиму дозування накопичення препарату не відбувається.

У пацієнтів із помірною печінковою недостатністю метаболізм істотно не змінюється.

У пацієнтів із тяжкою нирковою недостатністю (кліренс креатиніну < 10 мл/хв) виділення неактивних метаболітів з жовчю збільшується.

Немає значних відмінностей фармакокінетики препарату, пов'язаних з віком пацієнта.

### **Фармацевтичні характеристики.**

*Основні фізико-хімічні властивості:* прозора, безбарвна або зі злегка жовтуватим відтінком рідина зі специфічним запахом.

*Несумісність.* Не слід змішувати в одному шприці з іншими лікарськими засобами.

*Термін придатності.* 2 роки.

*Умови зберігання.* В оригінальній упаковці в недоступному для дітей місці при температурі не вище 25 °С.

*Упаковка.* По 3 мл в ампулах № 5, № 10.

*Категорія відпуску.* За рецептом.

*Виробник.* ТОВ «НІКО».

*Місцезнаходження.* 86117, Україна, Донецька обл., м. Макіївка, вул. Енгельса, 1.