

ІНСТРУКЦІЯ для медичного застосування препарату

КАТАФАСТ (CATAFAST®)

Загальна характеристика:

міжнародна та хімічна назви: diclofenac; [о-[(2,6-дихлорфеніл)-аміно]-феніл]-ацетат калію;

основні фізико-хімічні властивості: порошок від білого до злегка жовтуватого кольору;

склад: 1 саше містить 50 мг диклофенаку калію;

допоміжні речовини: калію гідрокарбонат, манітол SD 200, манітол 35, аспартам, натрію сахаринат, гліцерину дибегенат, м'ятний ароматизатор, анісовий ароматизатор.

Форма випуску. Порошок для приготування розчину для внутрішнього застосування.

Фармакотерапевтична група. Нестероїдні протизапальні та протиревматичні засоби.

Код АТС M01A B05.

Фармакологічні властивості. Катафаст містить калієву сіль диклофенаку, речовину нестероїдної структури, що має виражену аналгетичну, протизапальну та жарознижувальну дію.

Катафаст характеризується швидким початком дії, у зв'язку з чим він особливо придатний для лікування гострих больових і запальних синдромів. Основним механізмом дії, встановленим в умовах експерименту, вважається гальмування біосинтезу простагландинів. Простагландини відіграють важливу роль у генезі запалення, болю і пропасниці.

In vitro диклофенак калію в концентраціях, еквівалентних тим, що досягаються при лікуванні пацієнтів, не пригнічує біосинтез протеогліканів хрящової тканини.

Фармакодинаміка. Встановлено, що Катафаст має сильну аналгетичну дію при помірно вираженому і тяжкому больовому синдромі. При наявності запалення, викликаного, наприклад, травмою або хірургічним втручанням, препарат швидко усуває як спонтанний біль, так і біль при рухах, а також зменшує запальну набряклість тканин і набряк у ділянці хірургічної рани. Проведені клінічні дослідження дали змогу встановити, що диклофенак калію здатний усувати больові відчуття і знижувати вираженість крововтрат при первинній дисменореї. При нападах мігрені Катафаст зменшує вираженість головного болю і таких супутніх симптомів як нудота і блювання.

Фармакокінетика.

Всмоктування. Диклофенак швидко і повністю всмоктується. Всмоктування активної речовини розпочинається зразу ж після прийому препарату. Після одноразового прийому внутрішньо одного саше, що містить 50 мг диклофенаку калію, його максимальна концентрація в плазмі крові досягається через 5 - 20 хв і становить 5,5 мкмоль/л.

При прийомі препарату під час їжі кількість диклофенаку, що всмоктується, не змінюється, хоча початок і швидкість всмоктування можуть дещо сповільнюватися.

Ступінь всмоктування перебуває у лінійній залежності від величини дози препарату.

Оскільки близько половини дози диклофенаку метаболізується під час першого проходження крізь печінку ("ефект першого проходження"), площа під кривою "концентрація-час" (AUC) у випадку прийому препарату внутрішньо чи ректально майже у два рази менша, ніж у випадку парентерального введення еквівалентної дози препарату.

Після повторного прийому показники фармакокінетики не змінюються. Тому, якщо підтримуються рекомендовані інтервали між прийомами окремих доз препарату, кумуляція не відзначається.

Розподіл. Зв'язування диклофенаку з білками сироватки крові становить 99,7 %, при цьому з альбуміном зв'язано 99,4 % препарату. Уявний об'єм розподілу становить 0,12 - 0,17 л/кг.

Диклофенак проникає в синовіальну рідину, де його максимальна концентрація досягається на 2 - 4 год пізніше, ніж у плазмі крові. Період напіввиведення із синовіальної рідини становить 3 - 6 год.

Інструкцію завантажено з сайту www.dovgolit.com

Через 2 год після досягнення максимальних концентрацій у плазмі концентрація диклофенаку в синовіальній рідині залишається більш високою; ця закономірність триває протягом 12 год.

Метаболізм. Диклофенак метаболізується частково шляхом глюкуронізації незміненої молекули, але головним чином шляхом одноразового і багаторазового гідроксилювання та метоксилювання, що призводить до утворення декількох фенольних метаболітів (3'-гідрокси-, 4'-гідрокси-, 5'-гідрокси-, 4',5-дигідрокси- та 3'-гідрокси-4'-метоксидиклофенаку), більша частина яких утворює кон'югати з глюкуроновою кислотою. Два з цих фенольних метаболітів біологічно активні, але значно менше, ніж диклофенак.

Виведення. Загальний системний кліренс диклофенаку становить 263 ± 56 мл/хв. Кінцевий період напівжиття у плазмі крові становить 1 - 2 год. Період напівжиття у плазмі крові чотирьох метаболітів, включаючи два фармакологічно активних, також нетривалий і становить 1 - 3 год. Один із метаболітів, 3'-гідрокси-4'-метоксидиклофенак, має довший період напівжиття у плазмі, проте цей метаболіт повністю неактивний.

Близько 60 % застосованої дози препарату виводиться із сечею у вигляді кон'югатів незміненої активної речовини з глюкуроновою кислотою, а також у вигляді метаболітів, більшість з яких також перетворюється в глюкуронові кон'югати. У незміненому вигляді виводиться менше 1 % диклофенаку. Решта застосованої дози препарату виводиться у вигляді метаболітів через жовч, із калом.

Фармакокінетика в окремих групах хворих. Вплив віку пацієнта на всмоктування, метаболізм і виведення препарату, прийнятого внутрішньо, не відзначений.

У пацієнтів із порушенням функції нирок, які отримували терапевтичні дози, не було виявлено накопичення незміненої активної речовини. У хворих із кліренсом креатиніну менше 10 мл/хв розрахункові рівноважні концентрації гідроксилюваних метаболітів у плазмі були приблизно в 4 рази вищі, ніж у здорових пацієнтів. Проте в кінцевому результаті всі метаболіти виводилися із жовчю.

У хворих на хронічний гепатит або компенсований цироз печінки показники фармакокінетики, метаболізм диклофенаку аналогічні таким у пацієнтів без захворювань печінки.

Показання для застосування.

Короткочасне лікування таких гострих захворювань:

посттравматичний біль, запалення і набряк, наприклад, внаслідок розтягнень;

післяопераційний біль, запалення і набряк, наприклад, після стоматологічних або ортопедичних операцій;

біль і/або запалення, що супроводжують запальні гінекологічні захворювання, наприклад, первинну дисменорею або аднексит;

напади мігрені;

больові синдроми з боку хребта;

ревматичні захворювання позасуглобових тканин;

як допоміжний засіб при інфекціях вуха, горла і носа, наприклад, при фаринготонзиліті, отиті, що супроводжуються вираженим болем і запаленням. Відповідно до загальноприйнятих підходів до лікування інфекційно-запальних захворювань необхідно також застосовувати етіотропні засоби. Ізольоване підвищення температури не є показанням для застосування препарату.

Спосіб застосування та дози. Слід застосовувати мінімально ефективну дозу та, за можливості, протягом мінімального терміну.

Для *дорослих* рекомендована початкова доза препарату становить 100 - 150 мг на день. У разі помірної вираженості симптомів звичайно буває достатньо застосування 50 - 100 мг препарату на день. Добову дозу слід розділити на 3 прийоми.

При первинній дисменореї добову дозу слід підбирати індивідуально; вона становить звичайно 50 - 150 мг. Спочатку призначають 50 - 100 мг, а потім, у разі необхідності, протягом наступних декількох менструальних циклів дозу препарату підвищують до максимальної, що становить 200 мг на день. Прийом препарату рекомендується починати якнайшвидше після появи першого неприємного

відчуття, лікування продовжувати протягом декількох днів, залежно від симптоматики.

При мігрені початкова доза 50 мг повинна бути прийнята при перших симптомах нападу, що починається. У випадках, коли в межах 2 год після прийому першої дози достатнє послаблення болю не настає, можна прийняти наступну дозу 50 мг. Якщо необхідно, наступні дози по 50 мг можна приймати з інтервалами 4-6 год, не перевищуючи загальну дозу 200 мг на добу.

Вміст пакетика слід розчинити в склянці негазованої води. Розчин може бути трохи каламутним, але це не впливає на ефективність препарату. Розчин слід приймати переважно перед прийомом їжі.

Діти. Катафаст не рекомендується призначати дітям віком до 14 років. Для лікування дітей віком до 14 років застосовують краплі і супозиторії диклофенаку 12,5 мг і 25 мг.

Для дітей старше 14 років, як правило, достатньо застосування дози 50-100 мг, розподіленої на 1-2 прийоми, щодня. Дослідження Катафасту при нападах мігрені у дітей не проводилося.

Побічна дія. (Включаючи взаємодії, що спостерігаються з іншими формами диклофенаку калію та диклофенаку натрію при короткочасному та довготривалому застосуванні). *При оцінці частоти виникнення різних побічних реакцій використані такі критерії: часто ($\geq 1/100, < 1/10$); нечасто ($\geq 1/1000 < 1/100$); рідко ($\geq 1/10000 < 1/1000$); дуже рідко ($< 1/10000$), включаючи окремі випадки.*

З боку системи кровотворення: дуже рідко - тромбоцитопенія, лейкопенія, гемолітична анемія, апластична анемія, агранулоцитоз.

З боку імунної системи: рідко – реакції гіперчутливості, анафілактичні та анафілактоїдні реакції (включаючи гіпотензію і шок), дуже рідко – ангіоневричний набряк (включаючи набряк обличчя).

З боку нервової системи: часто - головний біль, запаморочення; рідко - сонливість, дуже рідко - парестезії, зниження пам'яті, судоми, тремор, асептичний менінгіт, порушення смаку, інсульт.

Психіатричні порушення: дуже рідко - дезорієнтація, депресія, безсоння, роздратованість, нічні кошмари, психотичні порушення.

З боку органів чуття: дуже рідко - порушення зору (нечіткість зору, диплопія), порушення слуху, шум у вухах.

З боку серцево-судинної системи: дуже рідко – відчуття серцебиття, біль у грудях, серцева недостатність, інфаркт міокарда.

З боку шлунково-кишкового тракту: часто - біль в епігастральній ділянці, нудота, блювання, диспепсія, метеоризм, анорексія; рідко – гастрит, шлунково-кишкова кровотеча (криваве блювання, мелена, діарея з домішками крові), виразки шлунка і кишечника, що супроводжуються або не супроводжуються кровотечею чи перфорацією; дуже рідко - коліт (включаючи геморагічний коліт та загострення виразкового коліту або хвороба Крона), запор, стоматит, глосит, зміни з боку стравоходу, діафрагмоподібний стеноз кишечника, панкреатит.

Порушення з боку судинної системи. Дуже рідко- гіпертензія, васкуліт.

Порушення з боку дихальної системи. Рідко - астма, дуже рідко – пневмоніт.

Порушення з боку гепатобіліарної системи: часто - підвищення рівня трансаміназ; рідко - гепатит (із жовтяницею або без неї); дуже рідко - миттєвий гепатит.

Порушення зі сторони шкіри та підшкірної клітковини: часто - висипи; рідко – кропив'янка; дуже рідко - висипи у вигляді пухирів, екзема, мультиформна еритема, синдром Стівенса-Джонсона, синдром Лайела (токсичний епідермальний некроліз), ексфолюативний дерматит, випадіння волосся, фоточутливі реакції; пурпура, у т. ч. алергічна.

З боку нирок та сечовивідних шляхів: дуже рідко - гостра ниркова недостатність, гематурія, протеїнурія, інтерстиціальний нефрит; нефротичний синдром; папілярний некроз.

Протипоказання.

- Виразка шлунка або кишечника в активній фазі.
- Підвищена чутливість до активної речовини або інших інгредієнтів препарату.
- Останні три місяці вагітності.
- Тяжка печінкова, ниркова та серцева недостатність.
- Катафаст, так як й інші нестероїдні протизапальні препарати (НПЗП), протипоказаний тим пацієнтам, у яких напади бронхіальної астми, кропив'янки або гострого риніту провокуються прийомом ацетилсаліцилової кислоти або інших препаратів, які мають здатність інгібувати

простагландинсинтетази.

Передозування. Типової клінічної картини, характерної для передозування диклофенаку, не існує. Передозування може спричинити блювання, шлунково-кишкову кровотечу, діарею, запаморочення, шум у вухах та судоми. Лікування гострого отруєння НПЗП полягає в проведенні підтримуючої і симптоматичної терапії.

Терапевтичні заходи, які необхідно вжити при передозуванні: проведення підтримуючої і симптоматичної терапії, особливо це стосується лікування таких проявів як артеріальна гіпотензія, ниркова недостатність, судоми, симптоми подразнення шлунково-кишкового тракту, пригнічення дихання. Після прийому потенційно токсичної дози можна застосовувати активоване вугілля, після прийому потенційно небезпечної для життя дози треба викликати блювання або промити шлунок. Малоймовірно, що такі специфічні лікувальні заходи, як форсований діурез, гемодіаліз або гемоперфузія виявляться корисними для виведення НПЗП, оскільки активні речовини цих препаратів значною мірою зв'язуються з білками крові і піддаються інтенсивному метаболізму.

Особливості застосування. У період лікування в будь-який час може виникнути шлунково-кишкова кровотеча або розвинутися виразка шлунково-кишкового тракту, яка іноді ускладнюється перфорацією. Цим ускладненням не обов'язково передують симптоми-провісники або наявність амнестичних відомостей про виразкове ураження. Серйозніші наслідки цих ускладнень можуть відзначатися у пацієнтів літнього віку. В окремих випадках, коли у пацієнтів, які отримують препарат, розвиваються вказані ускладнення, препарат потрібно відмінити. Щоб зменшити ризик шлунково-кишкової токсичності, лікування слід починати і підтримувати із застосуванням мінімально ефективної дози.

Для пацієнтів, які отримують супутню терапію ацетилсаліциловою кислотою або іншими лікарськими засобами, що можуть посилити ризик розвитку побічних ефектів, треба розглянути питання щодо комбінованої терапії захисними засобами (наприклад, інгібіторами протонного насоса). Пацієнтам, які отримують супутню терапію системними кортикостероїдами, антикоагулянтами, протитромбоцитарними засобами, рекомендовано бути обережними.

У зв'язку з тим, що немає доказів щодо синергічних переваг і можливості посилення небажаних ефектів, необхідно утримуватись від сумісного прийому Катафасту з іншими НПЗП, включаючи інгібітори циклооксигенази-2.

У пацієнтів, які раніше не отримували препарат, у період лікування цим препаратом, так як і під час терапії іншими НПЗП, у поодиноких випадках можуть розвинутися алергічні реакції, включаючи анафілактичні та анафілактоїдні реакції. У пацієнтів з астмою, алергічними ринітами, набряками слизової оболонки носа (назальні поліпи), хронічним обструктивним захворюванням дихальних шляхів, хронічними інфекціями дихальних шляхів (особливо, якщо вони пов'язані з риніт-подібними алергічними симптомами), реакції на НПЗП, такі, як провокування астми, набряк Квінке або кропив'янка зустрічаються частіше. Тому таким пацієнтам рекомендовано дотримуватись обережності.

Катафаст, як й інші НПЗП, завдяки своїм фармакодинамічним властивостям може маскувати скарги і симптоми, характерні для інфекційно-запальних захворювань.

Під час застосування препарату необхідний пильний медичний нагляд за хворими, які скаржаться на захворювання шлунково-кишкового тракту або мають в анамнезі дані про виразкову хворобу шлунка або дванадцятипалої кишки; хворими, що страждають на виразковий коліт або хворобу Крона, а також пацієнтами з порушеннями функції печінки.

Під час застосування препарату, як й інших НПЗП, може підвищуватися рівень одного або декількох печінкових ферментів. Тому при тривалій терапії Катафастом як запобіжний захід показане регулярне дослідження функції печінки. Якщо порушення з боку функціональних показників печінки зберігаються або посилюються, або якщо з'являються скарги або симптоми, що вказують на захворювання печінки, а також у тому випадку, коли виникають інші побічні явища (наприклад, еозинофілія, висип тощо), Катафаст слід відмінити. Потрібно мати на увазі, що гепатит на фоні прийому препарату може виникнути без продромальних явищ.

Обережність необхідна при призначенні Катафасту хворим на печінкову порфірію, оскільки препарат може провокувати напади порфірії.

Оскільки простагландини відіграють важливу роль у підтриманні ниркового кровотоку, особлива обережність потрібна при лікуванні пацієнтів із порушеннями функції серця або нирок, пацієнтів літнього віку, хворих, що отримують діуретичні засоби, а також хворих, у яких є значне зменшення об'єму циркулюючої плазми будь-якої етіології, наприклад, у період до і після масивних хірургічних втручань. У цих випадках під час застосування Катафасту рекомендується як запобіжний захід регулярний контроль функції нирок. Припинення застосування препарату звичайно призводить до відновлення функції нирок до вихідного рівня.

Застосування Катафасту за всіма вказаними вище показаннями звичайно обмежується декількома днями. Проте у тому випадку, коли, незважаючи на рекомендації щодо застосування, Катафаст застосовується протягом тривалого часу, рекомендується, як і при тривалому застосуванні інших НПЗП, контролювати склад периферичної крові.

Катафаст, як й інші НПЗП, може тимчасово інгібувати агрегацію тромбоцитів. Тому в пацієнтів із порушеннями гемостазу необхідний ретельний контроль відповідних лабораторних показників.

Враховуючи загальні медичні положення, обережність при використанні препарату необхідна пацієнтам літнього віку. Це особливо актуально для людей літнього віку, які ослаблені або мають невелику масу тіла; їм рекомендується призначати препарат у мінімально ефективній дозі.

Катафаст містить джерело фенілаланіну, що може бути небезпечним для хворих на фенілкетонурию.

Вагітність і годування груддю. У період вагітності Катафаст слід призначати тільки у виняткових випадках і тільки в мінімально ефективній дозі. Так як і у випадку застосування інших інгібіторів простагландинсинтетази, ці рекомендації особливо важливі в останні 3 місяці вагітності (можливе пригнічення скорочувальної здатності матки і передчасне закриття артеріального протоку у плода).

При застосуванні препарату в дозі 50 мг кожні 8 год активна речовина проникає у грудне молоко, однак у такій незначній кількості, що немає підстав очікувати будь-якого небажаного впливу на новонародженого, що перебуває на грудному вигодовуванні.

Вплив на здатність керувати транспортними засобами або працювати зі складними механізмами. Пацієнтам, у яких виникнуть під час застосування препарату запаморочення або інші неприємні відчуття з боку центральної нервової системи, включаючи порушення зору, не слід керувати транспортними засобами або працювати зі складними механізмами.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами. (Включаючи взаємодії, що спостерігаються з іншими формами диклофенаку калію та диклофенаку натрію).

Літій, дигоксин. Катафаст може підвищувати концентрації цих препаратів у плазмі крові.

Діуретичні та гіпотензивні засоби. Катафаст, як й інші НПЗП, може гальмувати дію діуретичних та гіпотензивних засобів (β -блокатори, інгібітори АПФ). Тому пацієнтам, особливо літнім, цю комбінацію необхідно призначати з обережністю та періодично контролювати артеріальний тиск. Пацієнти повинні бути адекватно гідратовані; після початку та періодично під час супутньої терапії, особливо при призначенні діуретичних засобів і інгібіторів АПФ, необхідно контролювати функцію нирок. Одночасне застосування калійзберігаючих діуретиків може призводити до підвищення рівня калію в сироватці крові (у випадку застосування такої комбінації лікарських засобів даний показник слід регулярно контролювати).

НПЗП та кортикостероїди. Одночасне системне застосування НПЗП та кортикостероїдів може збільшувати частоту побічних реакцій.

Антикоагулянти та протитромбоцитарні засоби. Хоча в клінічних дослідженнях не було встановлено впливу диклофенаку на дію антикоагулянтів, існують окремі повідомлення про підвищення ризику кровотеч у пацієнтів, що приймали одночасно диклофенак і ці препарати. Тому, у випадку такого поєднання лікарських засобів, рекомендується пильний і регулярний нагляд за пацієнтами.

Селективні інгібітори зворотнього захвату серотаніну (СІЗЗС).

Супутнє введення НПЗП та СІЗЗС може збільшувати ризик шлунково-кишкових кровотеч.

Протидіабетичні препарати. У клінічних дослідженнях встановлено, що диклофенак може

застосовуватися сумісно з пероральними протидіабетичними засобами і не змінювати їх лікувальної дії. Проте є деякі повідомлення про розвиток у таких випадках як гіпоглікемії, так і гіперглікемії, що обумовлювало необхідність зміни дози цукрознижуючих препаратів під час застосування диклофенаку.

Метотрексат. Слід дотримуватись обережності при призначенні НПЗП менше ніж за 24 год до або після прийому метотрексату, оскільки в таких випадках може підвищуватися концентрація метотрексату в крові і посилюватися його токсична дія.

Циклоспорин. Вплив НПЗП на синтез простагландинів у нирках може посилювати нефротоксичність циклоспорину.

Хінолонові антибактеріальні засоби. Є окремі повідомлення про розвиток судом у хворих, що одержували одночасно похідні хінолону й НПЗП.

Умови та термін зберігання. Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С, запобігати дії вологи. Зберігати в недоступному для дітей місці.

Термін придатності – 2 роки.

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка. По 3 саше в упаковці.

Виробник. Miphaarm S.p.A. for Novartis Pharma AG / Міфарм С.п.А. для Новартіс Фарма АГ.

Адреса. Milan, Italy for Basel, Switzerland / Мілан, Італія для Базель, Швейцарія.