

І Н С Т Р У К Ц І Я
для медичного застосування препарату
ОЛФЕН™-75
(OLFEN™-75)

Загальна характеристика:

основні фізико-хімічні властивості: прозорий, від безбарвного до світло-жовтого кольору розчин;
склад: 2 мл розчину містять диклофенак натрію 75 мг та лідокаїну гідрохлорид 20 мг;
допоміжні речовини: N-ацетилцистеїн, едетату динатрієва сіль, пропіленгліколь, поліетиленгліколь 400, натрію гідроксид, вода для ін'єкцій.

Форма випуску. Розчин для ін'єкцій.

Фармакотерапевтична група. Нестероїдні протизапальні та протиревматичні засоби.
Код АТС M01AB55.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Препарат містить натрієву сіль диклофенаку - нестероїдну активну речовину з вираженими протиревматичними, протизапальними, анальгетичними та антипіретичними властивостями. Важливим для механізму дії препарату є пригнічення біосинтезу простагландинів.

Простагландини суттєво впливають на розвиток запалення, болю та пропасниці. Препарат, завдяки своїм протизапальним та анальгетичним властивостям значною мірою поліпшує стан і підвищує функціональну здатність. При посттравматичних/ постопераційних запаленнях засіб швидко полегшує спонтанний біль та біль при русі, а також зменшує запальну припухлість і рановий набряк.

Крім того, очевидний анальгетичний ефект препарату був продемонстрований у клінічних випробуваннях при помірному і сильному болю неревматичного характеру. При первинній дисменореї препарат може зменшувати біль.

Ампули застосовують для початкової терапії запальних і дегенеративних ревматичних захворювань, а також для лікування болю, спричиненого запаленнями неревматичного характеру, при цьому початок дії настає протягом 15 – 30 хв.

При одночасному використанні для лікування післяопераційних болей засіб значно знижує потребу в опіоїдах.

При первинній дисменореї препарат може зменшувати біль.

Фармакокінетика.

Абсорбція. Середній об'єм розподілу диклофенаку становить 0,12 – 0,17 л/кг. Зв'язування з білками плазми – понад 99 %.

Терапевтична концентрація в плазмі дорівнює 0,7 – 2 мкг/мл.

Після прийому еквівалентної дози (мг/кг маси тіла) концентрація препарату в плазмі у дітей подібна до концентрації у дорослих.

Повторний прийом препарату не змінює кінетичні параметри. Кумуляція не відбувається, якщо чітко дотримуватись рекомендованих інтервалів між прийомами препарату.

Розподіл. Диклофенак проникає в синовіальну рідину, де максимальна концентрація його визначається через 2 – 4 год після того, як були одержані значення пікової концентрації. Період напіввиведення із синовіальної рідини становить 3 – 6 год. Як наслідок, навіть через 4 – 6 год після застосування препарату, концентрації активного інгредієнта вищі, ніж у плазмі, і вони залишаються вищими протягом 12 год.

Метаболізм. Біотрансформація відбувається частково шляхом глюкуронідації інтактною молекули, але переважно шляхом гідроксилювання та метоксилювання. Утворюються два фармакологічно активні фенольні метаболіти, але вони менш активні, ніж Диклофенак.

Елімінація. Диклофенак виводиться із плазми з системним кліренсом 263 – 56 мл/хв (середнє значення SD). Граничний період напіввиведення дорівнює 1 – 2 год. Приблизно 60 % прийнятої дози виводиться нирками у вигляді метаболітів і менше 1 % у незміненому вигляді. Решта дози виводиться з жовчю у метаболізованому вигляді.

Кінетика в особливих клінічних ситуаціях.

Очевидних відмінностей в абсорбції, метаболізмі та елімінації препарату, пов'язаних з віком пацієнтів, не спостерігалось.

У пацієнтів з порушеннями функції нирок при призначенні звичайної, індивідуально підібраної дози, підвищення рівня незміненої активної речовини не спостерігалось. Якщо кліренс креатиніну становив менше 10 мл/хв, теоретично сталий рівень метаболітів у плазмі крові був приблизно у 4 рази вищим, ніж у здорових людей. Незважаючи на це, метаболіти виводилися з жовчю.

У пацієнтів з порушенням функції печінки (хронічний гепатит, компенсований цироз печінки) кінетика і метаболізм такі самі, як і у пацієнтів з нормальною функцією печінки.

Показання для застосування. Препарат призначається у вигляді внутрішньом'язових ін'єкцій при наступних станах:

загострення запальних та дегенеративних форм ревматизму (ревматоїдний артрит, анкілозуючий спондиліт, дегенеративний спондилоартрит, патологічний хребцевий синдром, позасуглобовий ревматизм;
гострий подагричний артрит;
ниркові та печінкові коліки;
біль, запалення та набряк після травм і хірургічних втручань.

Спосіб застосування та дози. Тримайте ампулу догори позначкою. Постукайте по верхній частині ампули, щоб рідина скла донизу.

Дорослі. Для запобігання ушкодженню нервів або інших тканин у місці ін'єкції слід дотримуватись наступних інструкцій. Розчин слід вводити глибоко у верхній зовнішній квадрант сідничного м'язу 1 раз на добу. При сильних болях (наприклад, коліки) препарат можна вводити 2 рази на добу з інтервалом у декілька годин, обов'язково змінюючи при цьому місце ін'єкції.

Поєднання парентерального введення препарату Олфен™-75 з іншими формами Олфену (Лактаб, Депокапс або Ректокапс) припустимо у такий спосіб, щоб загальна максимальна добова доза диклофенаку натрію не перевищувала 150 мг. Тривалість парентерального застосування препарату не повинна перевищувати 2 дні. Якщо це необхідно, лікування можна продовжувати, застосовуючи Олфен™ Лактаб, Депокапс або Ректокапс.

Діти. Препарат Олфен™-75 не призначений для застосування у дітей, молодших 14 років.

Побічна дія.

Частота

Дуже часто (>1/10), часто (>1/100 <1/10), нечасто (>1/1000 <1/100), рідко (>1/0 000 <1/1000), дуже рідко (<1/10 000).

Травний тракт

Нечасто: біль в епігастральній області, нудота, блювання, діарея, абдомінальні спазми, диспепсія, метеоризм, втрата апетиту.

Рідко: шлунково-кишкові кровотечі (блювання із кров'ю, чорне забарвлення випорожнень, діарея із кров'ю), пептична виразка, що може супроводжуватись кровотечами, або перфорація;

Дуже рідко: афтозний стоматит, глосит, неспецифічний геморагічний коліт, езофагальні ураження, діафрагмоподібні кишкові стриктури, загострення виразкового коліту або хвороби Крона, запор, панкреатит.

Центральна нервова система

Нечасто: головний біль, запаморочення, вертиго, порушення мозкового кровообігу.

Рідко: стомлюваність.

Дуже рідко: порушення почуття дотику, парестезія, порушення пам'яті, дезорієнтація, безсоння, подразливість, спазми, депресія, відчуття неспокою, кошмарні сновидіння, тремтіння кінцівок, психотичні реакції, асептичний менінгіт.

Органи чуття

Дуже рідко: розлади зору (нечіткість зору, диплопія), порушення слуху, шум у вухах, порушення смаку.

Шкіра

Нечасто: шкірні висипи.

Рідко: кропивниця.

Дуже рідко: бульозний висип, екзема, мультиформна еритема, синдром Стівенса-Джонсона, синдром Лайєла (токсичний епідермальний некроліз), еритродермія (ексфоліативні дерматити), випадіння волосся, фотосенсибілізація, пурпура, включаючи алергічну пурпуру.

Нирки

Рідко: набряк.

Дуже рідко: гостра ниркова недостатність, гематурія, протеїнурія, інтерстиціальний нефрит, нефротичний синдром, некротизуючий папіліт.

Печінка

Часто: підвищення рівня печінкових ферментів (амінотрансфераз) у сироватці крові (іноді до помірного або високого ступеня).

Рідко: гепатити, що можуть супроводжуватись жовтухою.

Дуже рідко: блискавичний гепатит.

Кров

Дуже рідко: тромбоцитопенія, лейкопенія, агранулоцитоз, гемолітична анемія, апластична анемія.

Гіперчутливість

Рідко: реакції гіперчутливості (наприклад, бронхоспазм, анафілактичні/анафілактоїдні системні реакції, включаючи гіпотензію).

Дуже рідко: васкуліти, пневмонії.

Серцево-судинна система

Дуже рідко: прискорене серцебиття, біль у грудях, гіпертензія, порушення серцевої функції.

Реакції у місці введення

Нечасто: небажані реакції в місці введення, наприклад, біль та ущільнення тканин.

Дуже рідко: абсцес та некроз в місці внутрішньом'язового введення.

Протипоказання.

Гіперчутливість до діючої речовини або інших компонентів препарату;

як і інші нестероїдні протизапальні засоби, Олфен[™]-75 протипоказаний хворим на виразку шлунка та дванадцятипалої кишки, з нападами астми, кропивницею або гострим ринітом, що з'явилися після курсу лікування із застосуванням ацетилсаліцилової кислоти або інших нестероїдних протизапальних препаратів (НПЗП);

III триместр вагітності;

хвороба Крона або виразковий коліт;

тяжка серцева недостатність;

тяжка печінкова недостатність;

тяжка ниркова недостатність (кліренс креатиніну < 30 мл/хв);

пацієнти з високим ризиком післяопераційних кровотеч або неповним гемостазом, порушеннями гемопоезу або цереброваскулярними кровотечами;

Олфен[™]-75 не слід застосовувати в поєднанні з високими дозами антикоагулянтів або з іншими протизапальними засобами;

Олфен[™]-75 не слід призначати дітям, молодшим 14 років, через відсутність досвіду такого застосування.

Передозування. Лікування гострих отруєнь, викликаних прийомом нестероїдних протизапальних

препаратів (НПЗП), полягає у проведенні підтримуючих та симптоматичних медичних заходів. Типові клінічні симптоми передозування диклофенаку натрію не відомі. Лікування таких ускладнень, як гіпотензія, ниркова недостатність, конвульсії, подразнення шлунково-кишкового тракту та пригнічення дихання, полягає у проведенні підтримуючих заходів та симптоматичного лікування. Спеціальна терапія, така як форсований діурез, діаліз або гемоперфузія, не мають важливого значення для виведення НПЗП, оскільки останні значною мірою зв'язуються із білками плазми та піддаються екстенсивному метаболізму.

Особливості застосування. Оскільки препарат Олфен[™]-75 містить високі дози діючої речовини, він не рекомендується для призначення дітям. У пацієнтів зі скаргами на діяльність шлунково-кишкового тракту, при наявності пептичної виразки в анамнезі, виразкового коліту, хвороби Крона або порушень функції печінки необхідне точне визначення показань для застосування та проведення терапії під ретельним медичним наглядом.

У пацієнтів похилого віку шлунково-кишкові кровотечі або утворення виразок та перфорації часто мають серйозні наслідки. Вони можуть виникати під час лікування у будь-який момент, навіть при відсутності попереджувальних симптомів та без будь-якої схильності в анамнезі.

Якщо під час лікування із застосуванням Олфен[™]-75 виникають виразки або кровотечі в шлунково-кишковому тракті, слід припинити введення препарату.

У випадку порушення функції печінки, а також при появі клінічних ознак та симптомів печінкових захворювань (наприклад, гепатиту) та інших проявів (наприклад, еозінофілії, шкірних висипів тощо), лікування препаратом слід припинити. Хворим на печінкову порфірію Олфен[™]-75 слід застосовувати з обережністю, оскільки препарат може викликати напад цього захворювання.

Пацієнтам з порушеннями серцевої або ниркової функції, пацієнтам похилого віку, пацієнтам, що приймають діуретики, а також тим, хто страждає на дефіцит рідини у міжклітинному просторі, який виникає, наприклад, у до- або післяопераційному періоді, під час лікування рекомендується проводити моніторинг функції нирок.

Для лікування ослаблених пацієнтів, пацієнтів похилого віку чи з малою масою тіла рекомендується застосовувати мінімальні дози препарату.

Якщо препарат Олфен[™]-75 застосовується протягом тривалого часу, як попереджувальний захід рекомендується проводити контроль ниркової та печінкової функції, а також аналіз крові.

Подібно до інших нестероїдних протизапальних препаратів (НПЗП), препарат Олфен[™]-75 може тимчасово пригнічувати агрегацію тромбоцитів. Тому такі пацієнти з порушеннями коагуляції повинні знаходитись під суворим медичним наглядом.

Пацієнти, які страждають на запаморочення або на інші розлади центральної нервової системи, які послаблюють зір, під час лікування препаратом не повинні керувати транспортними засобами та працювати зі складними механізмами.

Вагітність та лактація.

I та II триместр. Клінічні дані щодо жінок, які приймали Олфен[™]-75 у період вагітності, відсутні. Досліди на тваринах не виявили прямої чи побічної дії, яка б шкодила вагітності, розвитку ембріону (плоду), родовому акту чи постнатальному розвитку. У період вагітності Олфен[™]-75 варто застосовувати тільки за наявності абсолютних показань і тільки в мінімальних ефективних дозах.

III триместр. Олфен[™]-75 не варто застосовувати в III триместрі вагітності через те, що прийом інгібіторів простагландинсинтези може призвести до передчасного закриття артеріального протоку та відсутності скорочень матки.

Після перорального прийому 50 мг препарату з п'ятигодинним інтервалом кількість активної субстанції в материнському молоці являється такою низькою, що поява будь-яких побічних ефектів у новонародженого не очікується.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами.

Літій, дігосин. При одночасному застосуванні з цими препаратами Олфен[™]-75 може підвищувати концентрації літію та дігосину в плазмі крові.

Діуретики. Подібно до інших нестероїдних протизапальних засобів, диклофенак може знижувати ефективність діуретиків. Одночасне застосування препарату разом із калійзберігаючими діуретиками може призвести до розвитку гіперкаліємії, тому в таких випадках необхідно регулярно визначати концентрацію калію в сироватці крові.

Нестероїдні протиревматичні засоби. Одночасне застосування різних системних нестероїдних протиревматичних засобів або глюкокортикоїдів системної дії може викликати небажані ефекти.

Антикоагулянти. Клінічні дослідження показали, що диклофенак не взаємодіє з антикоагулянтами. Однак при одночасному застосуванні препарату ОлфенTM-75 із антикоагулянтами необхідно перевіряти бажаний антикоагулянтний ефект за допомогою лабораторних аналізів. Високі дози (200 мг) диклофенаку натрію можуть зворотньо пригнічувати агрегацію тромбоцитів.

Протидіабетичні засоби. Клінічні дослідження показали, що диклофенак може застосовуватись одночасно з пероральними протидіабетичними засобами без будь-яких взаємодій. Однак повідомлялось про окремі випадки гіпоглікемічних та гіперглікемічних реакцій після застосування диклофенаку з цими препаратами, що потребувало корекції його дозування або дозування протидіабетичних засобів.

Метотрексат. Нестероїдні протиревматичні засоби слід застосувати з обережністю, якщо вони приймаються менш ніж за 24 години перед або після застосування метотрексату, оскільки в таких випадках концентрація метотрексату в крові та його токсичність можуть підвищуватись.

Циклоспорин. При одночасному застосуванні цього препарату з ОлфенTM-75 може підвищуватися нефротоксичність циклоспорину.

Хінолонові антибіотики. Існують окремі повідомлення про судоми, які, можливо, були наслідком одночасного застосування хінолонових препаратів та НПЗП.

Умови та термін зберігання. Зберігати у сухому, недоступному для дітей місці, при температурі не вище 25 С.

Термін придатності 5 років. Не застосовуйте препарат після закінчення терміну придатності, вказаного на упаковці.

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка. По 5 ампул по 2 мл в картонній коробці.

Виробник. Меркле ГмбХ., Блаубойрен,

Адреса. Німеччина для Мефа Лтд., Еш-Базель, Швейцарія.