

І Н С Т Р У К Ц І Я
для медичного застосування препарату
ОЛФЕН -50 Лактаб
(OLFEN -50 Lactab)

Загальна характеристика:

міжнародна назва: диклофенак;

основні фізико-хімічні властивості: двоопуклі таблетки, вкриті оболонкою, кольору жовтої охри, на одному боці відтиск "O 50", на іншому – "mp";

склад: 1 таблетка, вкрита оболонкою, містить: диклофенаку натрію – 50 мг;

допоміжні речовини: натрію гліколат крохмалю, мікрокристалічна целюлоза, стеарилфумарат натрію, діоксид силікону колоїдний, тальк, гідроксипропілметилцелюлоза;

оболонка: кополімер метакрилової кислоти типу С, триетилцитрат, тальк, гідроксид натрію.

покриття кольорове: гідроксипропілметилцелюлоза, діоксид титану жовтий Е 171, тальк, хінолін жовтий Е 104, оксид заліза жовтий Е 172, макроголь 6000.

Форма випуску. Таблетки, вкриті оболонкою.

Фармакотерапевтична група. Нестероїдні протизапальні та протиревматичні засоби.

АТС код: M01AB05.

Фармакологічні властивості. Олфен -50 Лактаб містить натрієву сіль диклофенаку, нестероїдну активну речовину з вираженими протиревматичними, протизапальними, аналгетичними та жарознижувальними властивостями. Важливим для дії механізмом препарату є пригнічення біосинтезу простагландинів, що було продемонстровано експериментально.

Простагландини відіграють істотну роль у розвитку запалення, болю та пропасниці. Препарат завдяки своїм протизапальним та аналгетичним властивостям значною мірою поліпшує стан і підвищує функціональну здатність. При травматичних, посттравматичних та післяопераційних запаленнях Олфен -50 Лактаб викликає швидко полегшує спонтанний біль і біль при русі, а також зменшує запальну припухлість і рановий набряк.

Крім того, очевидний аналгетичний ефект препарату був продемонстрований у клінічних випробуваннях при помірному і сильному болях неревматичного характеру. При первинній дисменореї Олфен -50 Лактаб полегшував біль і зменшував ступінь кровотечі.

Фармакокінетика.

Абсорбція

Олфен -50 Лактаб вкритий ентросолюбільним захисним покриттям, що розчиняється в кишечнику. Через це, диклофенак абсорбується із Лактабу, після проходження через шлунок.

Середня концентрація у плазмі 0.92 мг/л (C_{max}) досягається через 2.6 год. (t_{max}) після прийому 50 мг Лактабу на порожній шлунок. Співвідношення плазмової концентрації і дози лінійне.

Якщо Лактаб приймається під час або після їжі, проходження його через шлунок повільніше, ніж у разі призначення його на порожній шлунок, і може дорівнювати 2.5 - 12 год. Однак, це не впливає негативно на кількість абсорбованого активного інгредієнта.

Розподіл

Середній об'єм розподілу диклофенаку становить 0.12 – 0.17 л/кг. Зв'язування з білками плазми – понад 99%.

Терапевтична концентрація у плазмі дорівнює 0.7 – 2 мкг/мл.

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

Диклофенак проникає в синовіальну рідину, де максимальна концентрація його визначається через 2 – 4 год. після одержання значень пікової концентрації. Період напіввиведення із синовіальної рідини становить 3 - 6 год. Як наслідок, навіть через 4 - 6 год. після прийому препарату, концентрації

активного інгредієнта вищі, ніж у плазмі, і вони залишаються вищими ще до 12 год.

Метаболізм

Приблизно половина кількості активного інгредієнта зазнає метаболізму першого проходження. Як наслідок цього - площа під кривою концентрації (AUC), утворена після перорального застосування препарату, становить приблизно половину від площі, утвореної після парентерального застосування такої самої дози. Після перорального застосування лише 60% речовини досягає кровообігу в незміненому вигляді. Біотрансформація відбувається частково шляхом глюкуронідації незміненої молекули, але головним чином шляхом гідроксилювання та метоксилювання з утворенням двох фармакологічно активних фенольних метаболітів, які 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 порушенням функції нирок при призначенні звичайної або індивідуально підбраної дози, підвищення рівня незміненої активної речовини не спостерігалось. Якщо кліренс креатиніну становив менше 10 мл/хв, теоретичний сталий рівень метаболітів у плазмі крові був приблизно у 4 рази вищий, ніж у здорових людей. Незважаючи на це, метаболіти зрештою виводилися з жовчю.

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

Показання для застосування. Запальні і дегенеративні ревматичні захворювання м'язів, суглобів, суглобових капсул, синовіальної сумки, сухожиль, синовіальної піхви та хребта, а саме: хронічні поліартрити, артрити, артрози, дегенеративні спондилоартрити, анкілозивні спондиліти, ревматизм м'яких тканин, бурсити, тендовагініти, тендиніти, люмбаго, ішіас, цервікальний синдром.

Гострий подагричний артрит.

Біль у місці запалень і набряків після травм і хірургічних операцій, наприклад, у стоматології, ортодонції, ортопедії.

Біль і/або запалення при гінекологічних захворюваннях, наприклад, первинні дисменореї, аднексити.

Як допоміжний засіб при гострих запальних інфекціях горла, носа або вух, що супроводжуються болем, наприклад, при фаринготонзиліті, отиті.

Згідно із загальними медичними принципами терапевтичні заходи повинні бути спрямовані на лікування основних захворювань. Пропасниця сама по собі не є показанням для застосування даного препарату.

Спосіб застосування та дози.

Дорослі

Початкова добова доза становить, як правило, 100 – 150 мг. У менш тяжких випадках і при тривалій терапії доза 75 мг - 100 мг на добу у більшості випадків є достатньою.

Взагалі добову дозу розподіляють на 2 - 3 прийоми; при тривалому лікуванні приймають, наприклад, 2 рази на добу по 1 таблетці Олфен -50 Лактаб або 1 раз на добу 1 пролонговану капсулу Олфен -100 СР Депокапс.

Таблетки слід приймати перед їжею, не розжовуючи і запиваючи склянкою води.

Щоб запобігти появі болю вночі та вранішній скутості, прийом Олфен -50 Лактаб протягом дня можна поєднувати з прийомом Олфен -100 Ректокапс (50 мг або 100 мг) перед сном (до максимальної добової дози 150 мг). При первинній дисменореї добова доза, підібрана індивідуально, становить, як правило, 50 – 150 мг; початкова доза має становити 50 – 100 мг і, якщо необхідно, може

бути підвищена протягом декількох менструальних циклів до максимальної 200 мг/день. Терапію слід розпочинати у разі появи перших симптомів захворювання і продовжувати ще кілька днів, залежно від симптомів.

Діти

Через високий вміст активної речовини Олфен -50 Лактаб не рекомендується для застосування у дітей.

Побічна дія.

Шлунково-кишковий тракт

Інколи: шлунково-кишкові кровотечі (кривава блювота, мелена, кривава діарея), пептична виразка з або без кровотечі або перфорації.

У поодиноких випадках: симптоми в нижньому відділі черевної порожнини (наприклад, неспецифічний геморагічний коліт і загостренням виразкового коліту або хвороби Крона), афтозний стоматит, глосит, езофагальні ураження, діафрагмоподібні кишкові стриктури, запор, панкреатит.

Центральна нервова система:

Інколи: головний біль, запаморочення, вертиго, стомлюваність.

В окремих випадках: порушення відчуття, парестезії, порушення пам'яті, дезорієнтація, безсоння, дратівливість, спазми, депресія, занепокоєння, жахливі сновидіння, тремор, психотичні реакції, асептичний менінгіт.

Органи чуття: розлади зору (нечіткість зору, диплопія), порушення слуху, шум у вухах, порушення смаку.

Шкіра

Інколи: шкірні висипання.

Рідко: кропив'янка.

В поодиноких випадках: бульозне висипання, екзема, мультиформна еритема, синдром Стівенса Джонсона, синдром Лайєла (токсичний епідермальний некроліз), еритродермія (ексфолюативні дерматити), випадіння волосся, фотосенсибілізація, пурпура, включаючи алергічну пурпуру.

Нирки

Рідко: набряк.

У поодиноких випадках: гостра ниркова недостатність, гематурія, протеїнурія, інтерстиціальний нефрит, нефротичний синдром, некротизуючий папіліт.

Печінка

Часто: підвищення рівня амінотрансфераз у сироватці крові (АЛТ, АСТ), інколи до помірного ступеня (3 x верхній ліміт) або високого (8 x верхній ліміт) ступенів.

Рідко: гепатити з або без жовтяниці, в окремих випадках – блискавичний гепатит.

Кров

В окремих випадках: тромбоцитопенія, лейкопенія, агранулоцитоз, гемолітична анемія, апластична анемія.

Гіперчутливість

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

У поодиноких випадках: васкуліти, пневмоніти.

Інші органи

У поодиноких випадках: імпотенція (зв'язок із застосуванням Олфен -50 Лактаб не доведений), прискорене серцебиття, біль у грудях, гіпертензія, серцева недостатність.

Протипоказання.

Гіперчутливість до активного інгредієнта або інших компонентів препарату.

Як і інші нестероїдні протизапальні засоби, Олфен -50 Лактаб протипоказаний у пацієнтів з виразкою шлунка та 12-палої кишки, геморагічним колітом, загостренням геморою, порушенням кровотворення нез'ясованої етіології, нападами астми, уртикарією або гострим ринітом, що виникли після прийому ацетилсаліцилової кислоти або інших агентів з пригнічувальним впливом на

простагландинсинтетази.

III триместр вагітності.

Діти до 1 року (див. розділ “Особливості застосування”).

Передозування. Лікування гострих отруєнь, пов’язаних з НПЗП, полягає у проведенні підтримуючих та симптоматичних заходів. Типові клінічні симптоми передозування диклофенаку невідомі.

Терапевтичні заходи у разі передозування: після проковтування препарату необхідно якнайшвидше запобігти його абсорбції шляхом промивання шлунка і призначення активованого вугілля.

Лікування таких ускладнень, як гіпотензія, ниркова недостатність, конвульсії, подразнення шлунково-кишкового тракту і пригнічення дихання є підтримуючим і симптоматичним. Спеціальна терапія, така як форсований діурез, діаліз або гемоперфузія, можливо є незначною допомогою для виведення НПЗП через їх високий ступінь зв’язування з білками плазми та екстенсивного метаболізму.

Особливості застосування. Через високий вміст активної речовини Олфен -50 Лактаб не рекомендується до застосування у дітей, яким препарат може бути призначений у низьких дозах (Олфен -25 Лактаб, таблетки по 25 мг). Призначати, залежно від тяжкості захворювання, дітям віком від 1 року дозу від 0,5 - 2 мг/кг маси тіла на добу, розподілену на 2 – 3 окремі дози. Для лікування хронічного ювенільного поліартриту добову дозу, розподілену на декілька окремих доз, можна підвищувати до максимальної 3 мг/кг маси тіла.

У пацієнтів зі скаргами на захворювання шлунково-кишкового тракту, із показанням пептичної виразки в анамнезі, виразковим колітом, хворобою Крона або порушеннями функції печінки необхідне точне встановлення діагнозу та пильний медичний контроль.

У пацієнтів похилого віку шлунково-кишкові кровотечі або утворення виразок/перфорації часто мають серйозні наслідки. Вони можуть виникати під час лікування у будь-який час, навіть без симптомів-передвісників і без будь-яких показань в історії хвороби.

В окремих випадках, коли під час лікування Олфеном -50 Лактаб виникають виразки у шлунково-кишковому тракті або геморагії, прийом препарату слід припинити.

Як і при лікуванні іншими нестероїдними протизапальними засобами, під час лікування Олфеном -50 Лактаб може підвищуватися рівень одного або більше печінкових ферментів. Це підвищення спостерігалось у клінічних дослідженнях під час лікування диклофенаком і було відзначено у 15% пацієнтів, але рідко супроводжувалося клінічними симптомами. Клінічне значення цього феномену невідоме. У більшості випадків таке підвищення перебувало в межах допустимих. Помірне підвищення рівня печінкових ферментів (3 - 8 x верхню межу), значне підвищення (> 8 x верхню межу) - в межах 1%. У вищезгаданих клінічних дослідженнях 0,5% пацієнтів, крім підвищеного рівня печінкових ферментів, мали клінічно виражені ураження печінки. Після припинення лікування підвищений рівень ферментів поступово повертався до нормального.

Як і при лікуванні іншими НПЗП, під час тривалої терапії Олфеном -50 Лактаб необхідно регулярно контролювати функцію печінки.

У разі порушення функції печінки, якщо з’явилися клінічні ознаки чи симптоми її захворювання (наприклад, гепатит) або інші прояви (наприклад, еозинофілія, шкірні висипання тощо), лікування Олфеном -50 Лактаб слід припинити. Окрім підвищення рівня печінкових ферментів, повідомлялося про поодинокі випадки тяжких реакцій з боку печінки, включаючи жовтяницю, і в окремих випадках, – фатальний блискавичний гепатит. Гепатит може виникати без продромальних симптомів. У пацієнтів, які страждають на печінкову порфірію, Олфен -50 Лактаб повинен застосовуватися з обережністю, оскільки препарат може спричинити напад. Простагландини відіграють важливу роль у підтриманні

ниркового кровообігу, тому особливу увагу слід приділяти пацієнтам з порушеною функцією серця або нирок; похилого віку та тим, хто приймає діуретики, а також особам, які страждають на дефіцит рідини у позаклітинному просторі внаслідок певних причин, наприклад, в перед- або післяопераційному періоді при більшості хірургічних втручань. Якщо у таких випадках застосовується Олфен -50 Лактаб,

рекомендується проводити моніторинг функції нирок як застережний захід. У разі припинення терапії відновлюється початковий стан пацієнта.

Враховуючи основні властивості лікарського засобу, слід дотримуватись обережності при призначенні цього препарату пацієнтам похилого віку.

Зокрема, рекомендовано застосування мінімальних доз для лікування ослаблених пацієнтів похилого віку або пацієнтів з низькою масою тіла.

Якщо Олфен -50 Лактаб застосовується досить тривалий час, рекомендується, як і при лікуванні іншими високоактивними НПЗП, моніторинг функції нирок і печінки, а також картини крові як застережні заходи.

Як і при лікуванні іншими НПЗП, при застосуванні препарату можуть виникати алергічні реакції, включаючи анафілактичні/анафілактоїдні реакції (навіть якщо лікарський засіб застосовується вперше).

Подібно до інших НПЗП, Олфен -50 Лактаб може тимчасово пригнічувати агрегацію тромбоцитів. Тому пацієнти з порушенням коагуляції мають перебувати під пильним контролем.

Завдяки своїм фармакодинамічним властивостям Олфен -50 Лактаб може приховувати симптоми інфекції.

Особлива примітка: Пацієнти з вертиго або іншими розладами центральної нервової системи, включаючи порушення зору, не повинні керувати транспортними засобами та працювати з механізмами.

Вагітність/лактація

I і II триместр.

Дослідження на тваринах не показали ніякого ризику для плода; однак, контрольовані дослідження у вагітних жінок не проводилися.

III триместр.

Олфен -50 Лактаб не слід призначати у III триместрі вагітності, тому що застосування простагландинсинтетази може спричинити передчасне закриття артеріальної протоки і відсутність скорочень матки.

Після застосування пероральної дози 50 мг з інтервалами 8 год. кількість активного інгредієнта Олфену -50 Лактаб, яка проникає в молоко матері, така мізерна, що ніякого несприятливого впливу на немовлят препарат не чинить.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами.

Літій, дигоксин

При супутньому застосуванні Олфен -50 Лактаб може підвищувати концентрацію літію або дигоксину у плазмі крові.

Діуретики

Подібно до інших НПЗП, Олфен -50 Лактаб може знижувати ефективність діуретиків. Сумісне застосування з калійзберігаючими діуретиками може призвести до гіперкаліємії і тому необхідно регулярно визначати концентрацію калію у сироватці.

Нестероїдні протиревматичні засоби

Супутнє застосування різних системних нестероїдних протиревматичних засобів або глюкокортикоїдів може сприяти появі небажаних ефектів.

Антикоагулянти

Клінічні дослідження показали, що Олфен -50 Лактаб не вступає у взаємодію з антикоагулянтами. Однак, якщо Олфен -50 Лактаб призначається разом з антикоагулянтами, як застережний захід рекомендується перевіряти бажаний антикоагулянтний ефект шляхом лабораторних аналізів. Високі дози (200 мг) диклофенаку можуть оборотно пригнічувати агрегацію тромбоцитів.

Протидіабетичні засоби

Клінічні дослідження показали, що Олфен -50 Лактаб може застосовуватися разом з пероральними протидіабетичними засобами, не вступаючи при цьому у взаємодію один з одним. Однак, були окремі повідомлення про гіпоглікемічні та гіперглікемічні реакції після застосування Олфен -50 Лактаб, що вимагало врегулювання його доз з дозами протидіабетичних засобів.

Метотрексат

Слід дотримуватись обережності при застосуванні нестероїдних протиревматичних засобів менше, ніж за 24 години до або після лікування метотрексатом, оскільки концентрація метотрексату в крові і токсичність його можуть підвищуватися.

Циклоспорин

При одночасному застосуванні з Олфен -50 Лактаб може підвищуватися нефротоксичність циклоспорину.

Квінолонові антибіотики

Були окремі повідомлення про конвульсії, які, можливо, стали наслідком сумісного застосування квінолонів та НПЗП.

Умови та термін зберігання. У сухому місці недоступному для дітей, при температурі до 25 С.
Термін зберігання – 5 років.

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка. Таблетки, вкриті оболонкою, по 50 мг № 20 у блістерах у картонній упаковці.

Виробник. Мефа Лтд., Швейцарія.

Адреса. Мефа Лтд.

Donacherstrasse 114

CH – 4147 Aesch - Basel

Switzerland