

**І Н С Т Р У К Ц І Я**  
для медичного застосування препарату  
**ОЛФЕН -100 СР Депокапс**  
(**OLFEN -100 SR Depocaps**)

**Загальна характеристика:**

*міжнародна назва:* диклофенак;

*основні фізико-хімічні властивості:* тверді желатинові капсули з рожевою кришечкою та білим, непрозорим корпусом, з написом: Olfen 100 перша; вміст капсули – білі гранули;

*склад:* 1 капсула пролонгованої дії містить диклофенаку натрію 100 мг;

*допоміжні речовини:* лактоза, целюлоза мікрокристалічна РН 102, натрію карбоксиметилцелюлоза, триміристант гліцерину, 30 % дисперсія кополімеру метакрилової кислоти та етилакрилату (еудрагіт RS 30 D), цитрофлекс 2 (триетилцитрат), діоксид кремнію, желатин, титану діоксид Е 171, заліза оксид чорний Е 172, заліза оксид червоний Е 172, еритрозин Е 127.

**Форма випуску.**

Капсули пролонгованої дії.

**Фармакотерапевтична група.**

Нестероїдні протизапальні та протиревматичні засоби.

Код АТС М01А В05.

**Фармакологічні властивості.**

*Фармакодинаміка.*

Препарат містить натрієву сіль диклофенаку – нестероїдну активну речовину з вираженими протиревматичними, протизапальними, аналгетичними та антипиретичними властивостями. Важливим для механізму дії препарату є пригнічення біосинтезу простагландинів.

Простагландини суттєво впливають на розвиток запалення, болю та пропасниці. Препарат завдяки своїм протизапальним та аналгетичним властивостям, які стають клінічно очевидними у разі ревматичних порушень при таких симптомах, як біль, що виникає у стані спокою, біль при русі, ранкова скутість, припухлість суглобів, значною мірою поліпшує стан і підвищує функціональну здатність. При посттравматичних/післяопераційних запаленнях препарат сприяє швидкому полегшенню спонтанного болю і болю 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 болі неревматичного характеру.

При первинній дисменореї засіб може полегшувати біль.

Препарат показаний пацієнтам, яким для полегшення симптомів необхідна добова доза не менше 100 мг. Активний інгредієнт вивільняється з препарату протягом тривалого часу, забезпечуючи підтримуючу дію. Призначення препарату 1 раз на день спрощує процес довготривалого лікування.

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

*Фармакокінетика.*

*Абсорбція.*

Із капсул диклофенак абсорбується повністю. Внаслідок уповільненого вивільнення активного інгредієнта досягнута максимальна концентрація в плазмі нижча, ніж концентрація після застосування інших лікарських форм. З іншого боку, вимірювані концентрації можна виявити навіть через кілька годин. Якщо капсули приймаються під час або після їди, абсорбція відбувається пізніше, ніж при прийомі натще. Однак це не впливає негативно на кількість абсорбованого активного інгредієнта.

Після прийому 100 мг препарату середня максимальна концентрація в плазмі, що становить 0,43 мкг/мл (1,35 мкмоль/л), досягається, в середньому, через 3,5 години.

#### *Розподіл.*

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

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

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

Диклофенак проникає у синовіальну рідину, де максимальна концентрація його визначається через 2 – 4 години після одержання значень пікової концентрації в плазмі. Період напіввиведення із синовіальної рідини становить 3 – 6 годин. Як наслідок, навіть через 4 – 6 годин після прийому препарату концентрації активного інгредієнта вищі, ніж у плазмі, і вони залишаються вищими ще протягом 12 годин.

#### *Метаболізм.*

Приблизно половина кількості активного інгредієнта зазнає метаболізму першого проходження. Як наслідок – площа під кривою «концентрація-час» (AUC), визначена після перорального або ректального 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 глюкуронізації незміненої молекули, але переважно шляхом гідроксилування 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 години. Приблизно 60 % прийнятої дози виводиться нирками у вигляді метаболітів і менше 1 % – у незміненому вигляді. Решта дози виводиться з жовчю в 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, теоретичний сталий рівень метаболітів у плазмі крові був приблизно у 4 рази вищий, ніж у здорових людей. При цьому метаболіти також виводилися з жовчю.

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

### **Показання для застосування.**

Запальні та дегенеративні (суглобові та позасуглобові) ревматичні захворювання м'язів, суглобів, суглобових капсул, синовіальної сумки, сухожилля, синовіальної піхви та хребта, а саме: хронічні поліартрити, артрити, артрози, дегенеративні спондилоартрити, анкілозуючі спондиліти, ревматичні захворювання позасуглобових тканин, бурсити, тендовагініти, тендиніти, люмбаго, ішіас, цервікальний синдром;

гострий напад подагричного артрити;

болі в місцях запалень та набряків після травм та хірургічних втручань;

болі та/або запалення в гінекології: первинна дисменорея, аднексит;

як допоміжний засіб при гострих запальних інфекціях горла, носа або вуха, які супроводжуються болем: фаринготонзиліти, отити.

Відповідно до загальних медичних принципів, необхідно дотримуватися відповідних терапевтичних методів при лікуванні основних захворювань. Гарячка не є показанням для застосування даного препарату.

**Спосіб застосування та дози.**

Олфен<sup>™</sup>-100 СР Депокапс слід приймати перед вживанням їжі. Капсули ковтають не розжовуючи і запиваючи достатньою кількістю води.

Дорослі.

Добова доза препарату звичайно становить 1 капсула Олфен<sup>™</sup>-100 СР Депокапс.

Олфен<sup>™</sup>-100 СР Депокапс призначений для лікування пацієнтів, яким достатньо дозування 100 мг диклофенаку натрію на добу. Враховуючи повільне вивільнення діючої речовини, застосування капсул пролонгованої дії забезпечує підтримуючу терапію. Призначення препарату Олфен<sup>™</sup>-100 СР Депокапс один раз на день робить тривале лікування більш зручним.

Лікування препаратом проводять до зникнення симптомів захворювання. Якщо лікування триває більш ніж 2 – 3 тижні, то як попереджувальний захід проводять контроль ниркової та печінкової функції, а також аналіз крові.

Діти.

Препарат Олфен<sup>™</sup>-100 СР Депокапс не рекомендується застосовувати для лікування дітей через високий вміст діючої речовини – диклофенаку натрію.

**Побічна дія.**Частота

*Дуже часті (>1/10), часті (>1/100, <1/10), нечасті (>1/1000, <1/100), рідкі (>1/10 000, <1/1000), дуже рідкі (<1/10 000)*

Травний тракт

*Нечасто:* біль в епігастральній ділянці, 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:* неспецифічний геморагічний коліт та загострення виразкового коліту або хвороби Крона, афтозний стоматит, глосит, езофагеальні ураження, діафрагмоподібні кишкові стриктури, запор, панкреатит.

Центральна нервова система

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

*Рідко:* стомлюваність.

*Дуже рідко:* порушення тактильної чутливості, 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:* кропив'янка.

*Дуже рідко:* бульозний висип, екзема, мультиформна еритема, синдром Стівенса-Джонсона, синдром Лайєла (токсичний епідермальний некроліз), еритродермія (ексфолювативні 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, астма, анафілактичні/анафілактоїдні системні реакції, включаючи гіпотензію).

*Дуже рідко:* васкуліти, пневмонії.

#### Серцево-судинна система

*Дуже рідко:* прискорене серцебиття, біль у грудях, артеріальна гіпертензія, серцева недостатність.

### **Протипоказання.**

Гіперчутливість до діючої речовини або до інших компонентів препарату;

як і інші нестероїдні протизапальні засоби, Олфен<sup>™</sup>-100 СР Депокапс протипоказаний хворим на виразку шлунка та дванадцятипалої кишки, з нападами астми, кропив'ячкою або гострим ринітом, що з'явилися після курсу лікування із застосуванням ацетилсаліцилової кислоти або інших нестероїдних протизапальних препаратів (НПЗП);

ІІІ 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<sup>™</sup>-100 СР Депокапс не слід застосовувати в поєднанні з високими дозами антикоагулянтів або з іншими протизапальними засобами;

Олфен<sup>™</sup>-100 СР Депокапс не слід призначати дітям.

### **Передозування.**

Лікування гострих отруєнь, спричинених прийомом НПЗП, полягає у проведенні підтримуючих та симптоматичних медичних заходів. Типові клінічні симптоми передозування диклофенаку натрію не відомі.

У випадку передозування препарату якнайшвидше промивають шлунок та приймають активоване вугілля для запобігання абсорбції препарату.

Лікування таких ускладнень, як артеріальна 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 з білками плазми та піддаються екстенсивному метаболізму.

### **Особливості застосування.**

Оскільки Олфен<sup>™</sup>-100 СР Депокапс 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 літнього 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<sup>™</sup>-100 СР Депокапс виникають виразки або кровотечі в шлунково-кишковому тракті, слід припинити прийом препарату.

У випадку порушення функції печінки, а також при появі клінічних ознак та симптомів печінкових захворювань (наприклад, гепатиту) та інших проявів (наприклад, еозинофілії, шкірних висипів тощо), лікування Олфен<sup>™</sup>-100 СР Депокапс слід припинити. Хворим на печінкову порфірію препарат слід застосовувати з обережністю, оскільки він може спричинити напад цього захворювання.

Пацієнти з порушеннями функції серця, нирок, ослаблені пацієнти та пацієнти літнього віку під час лікування препаратом Олфен<sup>™</sup>-100 СР Депокапс повинні знаходитись під наглядом спеціаліста.

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

Якщо Олфен<sup>™</sup>-100 СР Депокапс застосовується протягом тривалого часу, як попереджуючий захід рекомендується проводити контроль ниркової та печінкової функції, а також аналіз крові.

Як і при застосуванні інших НПЗП, протягом лікування Олфен<sup>™</sup>-100 СР Депокапс можуть розвинути алергічні реакції, в тому числі анафілактичні та анафілактоїдні реакції, навіть у тих випадках, коли препарат призначається вперше.

Подібно до інших НПЗП, Олфен<sup>™</sup>-100 СР Депокапс може тимчасово пригнічувати агрегацію тромбоцитів. Тому пацієнти з порушеннями коагуляції повинні знаходитись під суворим медичним наглядом.

Пацієнтам з порушеннями серцевої або ниркової функції, пацієнтам літнього 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.

Пацієнти, які страждають на запаморочення або на інші розлади центральної нервової системи, в тому числі з порушеннями зору, під час лікування препаратом не повинні керувати транспортними засобами та працювати зі складними механізмами.

#### *Вагітність і лактація.*

I та II триместр.

Клінічні дані щодо жінок, які приймали Олфен<sup>™</sup>-100 СР Депокапс у період вагітності, відсутні. Досліди на тваринах не виявили прямої чи побічної дії, яка б шкодила вагітності, розвитку ембріону (плода), пологам чи постнатальному розвитку. У період вагітності Олфен<sup>™</sup>-100 СР Депокапс варто застосовувати тільки за наявності абсолютних показань і тільки в мінімальних ефективних дозах.

III триместр.

Олфен<sup>™</sup>-100 СР Депокапс не варто застосовувати в III триместрі вагітності, оскільки прийом інгібіторів простагландинсинтетази може призвести до передчасного закриття артеріальної протоки та відсутності скорочень матки.

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

#### **Взаємодія з іншими лікарськими засобами.**

##### *Літій, дигоксин*

При одночасному застосуванні з цими препаратами Олфен<sup>™</sup>-100 СР Депокапс може підвищувати концентрації літію та дігосину в плазмі крові.

##### *Діуретики*

Подібно до інших НПЗП, Олфен<sup>™</sup>-100 СР Депокапс може знижувати ефективність діуретиків. Одночасне застосування препарату з 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 Олфен<sup>TM</sup>-100 СР Депокапс із антикоагулянтами необхідно перевіряти бажаний антикоагулянтний ефект за допомогою лабораторних аналізів. Високі дози (200 мг) диклофенаку натрію можуть зворотно 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 застосовувати 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 Олфен<sup>TM</sup>-100 СР Депокапс 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 в сухому, недоступному для дітей місці при температурі до 25 °С.

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

#### **Умови відпуску.**

За рецептом.

#### **Упаковка.**

По 10 капсул пролонгованої дії по 100 мг у блістері; по 1 або 2 блістери в упаковці.

#### **Виробник.**

Мефа Лтд.,

#### **Адреса.**

Еш-Базель,  
Швейцарія.