

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування препарату

ОЛФЕН™-100 РЕКТОКАПС (OLFEN™ -100 RECTOCAPS)

Загальна характеристика:

міжнародна назва: диклофенак;

основні фізико-хімічні властивості: капсули для ректального введення, рожевого кольору, торпедоподібної форми; вміст біла паста;

склад: 1 ректальна капсула містить диклофенаку натрію 100 мг;

допоміжні речовини: тригліцериди середньоланцюгові, тригліцериди гідрогенізовані, лецитин соєвий, желатин, гліцерин 85 %, титану діоксид, оксид заліза червоний Е 172, поліетиленгліколь 20000, поліетиленгліколь 1550, гліцерину моно- і діолеат, полівінілацетат, тальк.

Форма випуску.

Капсули ректальні.

Фармакотерапевтична група.

Нестероїдні протизапальні та протиревматичні засоби.

Код АТС M01A B05.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Препарат містить натрієву сіль диклофенаку – нестероїдну активну речовину з вираженими протиревматичними, протизапальними, аналгетичними 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 аналгетичним властивостям значною мірою поліпшує стан і підвищує функціональну здатність. При посттравматичних/ постопераційних запаленнях натрію диклофенак швидко послаблює спонтанний біль і 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 болях неревматичного характеру. При одночасному використанні для лікування післяопераційних болей засіб значно знижує потребу в опіоїдах.

При первинній дисменореї препарат може зменшувати біль.

Фармакокінетика.

Абсорбція.

Після введення у пряму кишку желатинове покриття розщеплюється протягом декількох хвилин. Активна речовина абсорбується протягом 30 хв, потрапляє у системний кровотік і розподіляється по тканинах та органах.

Капсули не подразнюють слизову оболонку прямої кишки. Желатинова оболонка стійка до підвищених температур.

Приблизно половина кількості активного інгредієнта зазнає метаболізму першого проходження.

Зв'язування з білками 99 %. Період напіввиведення з синовіальною рідиною 3 – 6 годин.

Розподіл.

Інструкцію завантажено з сайту www.dovgolit.com

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 протягом 12 год.

Метаболізм

Приблизно половина кількості активного інгредієнта зазнає метаболізму першого проходження. Як наслідок цього – площа під кривою концентрації (AUC), визначена 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, переважно, 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 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. 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 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, наприклад у стоматології, ортопедії;

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.

ОлфенTM-100 Ректокапс позитивно впливає на симптоми нападів мігрені.

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

Спосіб застосування та дози.

Інструкцію завантажено з сайту www.dovgolit.com

Капсули Олфен™-100 Ректокапс необхідно вводити в пряму кишку тупим кінцем. Для полегшення введення вони оброблені змазуючою речовиною. При необхідності перед введенням капсулу можна змочувати водою.

Дорослі.

Добова доза препарату звичайно складає 100 мг (1 капсула). Для попередження нічного болю та ранкової нерухомості суглобів, застосування Олфену™-100 Ректокапс перед сном можна поєднувати з прийомом Олфену™-50 Лактаб протягом дня (максимальна добова доза складає 150 мг). Лікування проводять до зникнення симптомів захворювання. Якщо лікування триває більш ніж 2 – 3 тижні, то в якості попереджувального заходу проводять контроль ниркової та печінкової функції, а також аналіз крові. При первинній дисменореї добова доза звичайно складає 100 мг, причому при необхідності її можна збільшити протягом 1 менструального циклу до максимальної дози, яка становить 200 мг/день. Терапію слід починати у випадку прояву перших симптомів захворювання та продовжувати ще декілька днів, в залежності від симптомів.

Діти.

Препарат Олфен™-100 Ректокапс не рекомендується застосовувати для лікування дітей через високий вміст діючої речовини – диклофенаку натрію.

Побічна дія.

Застосування препарату Олфен™-100 Ректокапс може викликати деякі побічні ефекти.

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 області, нудота, блювання, діарея, абдомінальні спазми, диспепсія, метеоризм, втрата апетиту та місцеве подразнення.

Рідко: шлунково-кишкові кровотечі (блювання із кров'ю, чорне забарвлення випорожнень, діарея із кров'ю), пептична виразка, що може супроводжуватись кровотечами, або перфорація. Якщо під час лікування Олфеном™-100 Ректокапс виникають виразки травного тракту або геморагії, застосування препарату слід припинити.

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

Центральна нервова система

Нечасто: головний біль, запаморочення, вертиго.

Рідко: стомлюваність.

Дуже рідко: порушення 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: кропивниця.

Дуже рідко: бульозний висип, екзема, мультиформна еритема, синдром Стівенса–Джонсона, синдром Лайела (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, гіпертензія, серцева недостатність.

Протипоказання.

Гіперчутливість до діючої речовини або інших компонентів препарату;

ОлфенTM-100 Ректокапс 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);

проктити;

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;

ОлфенTM-100 Ректокапс не слід застосовувати в поєднанні з високими дозами антикоагулянтів або з іншими протизапальними засобами;

ОлфенTM-100 Ректокапс не слід призначати дітям.

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 ОлфенTM-100 Ректокапс 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 попереджуючих симптомів та без будь-якої схильності в анамнезі.

Як і при застосуванні інших нестероїдних протизапальних препаратів, під час лікування Олфен™-100 Ректокапс необхідно регулярно контролювати функцію печінки. Якщо під час лікування із застосуванням Олфен™-100 Ректокапс 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, еозинofilії, шкірних висипів, тощо), лікування Олфен™-100 Ректокапс слід припинити. Хворим на печінкову порфірію Олфен™-100 Ректокапс слід застосовувати з обережністю, оскільки препарат може викликати напад цього захворювання.

Пацієнти з порушеннями функції серця, нирок, ослаблені пацієнти та пацієнти похилого віку під час лікування препаратом Олфен™-100 Ректокапс повинні знаходитись під наглядом лікаря.

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

Якщо Олфен™-100 Ректокапс застосовується протягом тривалого часу, як і у випадку застосування інших активних нестероїдних протизапальних препаратів (НПЗП), як попереджуючий захід рекомендується проводити контроль ниркової та печінкової функції, а також аналіз крові. Як і при застосуванні інших НПЗП, при такому лікуванні можуть виникнути алергічні реакції, включаючи анафілактичні/анафілактоїдні реакції, навіть якщо лікарський засіб застосовується вперше.

Подібно до інших нестероїдних протизапальних препаратів (НПЗП), Олфен™-100 Ректокапс 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, в тому числі порушеннями зору, 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, що приймали Олфен™-100 Ректокапс 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™-100 Ректокапс варто застосовувати тільки за наявності абсолютних показань і тільки в мінімальних ефективних дозах.

III триместр

Олфен™-100 Ректокапс не варто застосовувати в III триместрі вагітності, через те, що прийом інгібіторів простагландинсинтетази 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™-100 Ректокапс може підвищувати концентрації літію та дігосину в плазмі крові.

Діуретики

Подібно до інших НПЗП, Олфен™-100 Ректокапс може знижувати ефективність діуретиків. Одночасне

застосування препарату 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 Олфен™-100 Ректокапс не взаємодіє з антикоагулянтами. Однак при одночасному застосуванні Олфен™-100 Ректокапс 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 Олфен™-100 Ректокапс може застосовуватись одночасно з пероральними протидіабетичними засобами без будь-яких взаємодій. Однак повідомлялось про окремі випадки гіпоглікемічних та гіперглікемічних реакцій після застосування Олфен™-100 Ректокапс 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 Олфен™-100 Ректокапс 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 місці, недоступному для дітей, при температурі нижче 25 °С.

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

Умови відпуску.

За рецептом.

Упаковка.

По 5 капсул в блістері; по 1 блістеру в картонній коробці.

Виробник.

Р.П. Шерер ГмбХ, 69412

Адреса.

Ебербах-Баден, Німечина
для Мефа Лтд., Швейцарія.