

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Вольтарен, 25 мг, суппозитории ректальные.

Вольтарен, 50 мг, суппозитории ректальные.

Вольтарен, 100 мг, суппозитории ректальные.

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество – диклофенак натрия.

1 суппозиторий ректальный (25 мг) содержит 25 мг диклофенак натрия;

1 суппозиторий ректальный (50 мг) содержит 50 мг диклофенак натрия;

1 суппозиторий ректальный (100 мг) содержит 100 мг диклофенак натрия.

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Суппозитории ректальные.

От белого до белого с желтоватым оттенком цвета торпедообразной формы суппозитории с гладкой или слегка неровной поверхностью, со слабым характерным запахом.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1 Показания к применению

Препарат Вольтарен показан к применению у взрослых (для дозировок 25 мг, 50 мг и 100 мг), детей в возрасте от 6 до 14 лет (для дозировки 25 мг), подростков в возрасте от 14 до 18 лет (для дозировок 25 мг и 50 мг) при:

- Воспалительные и дегенеративные заболевания опорно-двигательного аппарата, в том числе:

- ревматоидный, ювенильный хронический артрит;

- анкилозирующий спондилит и другие спондилоартропатии;
- остеоартроз;
- подагрический артрит;
- бурсит, тендовагинит.
- Болевые синдромы со стороны позвоночника (люмбаго, ишиалгия, оссалгия, невралгия, миалгия, артрапалгия, радикулит).
- Посттравматический и послеоперационный болевой синдром, сопровождающийся воспалением, например в стоматологии и ортопедии.
- Альгодисменорея; воспалительные процессы в малом тазу, в том числе аднексит.
- Приступы мигрени.
- Инфекционно-воспалительные заболевания ЛОР органов с выраженным болевым синдромом (в составе комплексной терапии): фарингит, тонзиллит, отит.

Изолированная лихорадка не является показанием к применению препарата.

Препарат предназначен для симптоматической терапии, уменьшения боли и воспаления на момент применения, на прогрессирование заболевания не влияет.

4.2 Режим дозирования и способ применения

Режим дозирования.

Доза препарата подбирается индивидуально, при этом с целью снижения риска развития побочных эффектов рекомендуется применение минимальной эффективной дозы по возможности с максимально коротким периодом лечения, в соответствии с целью лечения и состоянием пациента.

Рекомендуемая начальная доза - 100-150 мг/сут. В относительно легких случаях заболевания, а также для длительной терапии бывает обычно достаточно 75-100 мг в сутки. Суточную дозу следует разделить на несколько приемов. Для облегчения ночной боли или утренней скованности препарат Вольтарен применяют в суппозиториях ректальных перед сном, в дополнение к применению препарата в виде таблеток в течение дня; при этом суммарно суточная доза не должна превышать 150 мг.

При *первичной дисменорее* суточную дозу подбирают индивидуально; обычно она составляет 50-150 мг. Начальная доза должна составлять 50-100 мг; при необходимости в течение нескольких менструальных циклов ее можно повысить до 150 мг/сут. Лечение

следует начинать при появлении первых симптомов. В зависимости от динамики клинических симптомов лечение можно продолжать в течение нескольких дней.

При *приступе мигрени* начальная доза составляет 100 мг. Препарат применяют при первых симптомах приближающегося приступа. При необходимости в тот же день можно дополнительно применить препарат Вольтарен в ректальных суппозиториях в дозе до 100 мг. При необходимости продолжения лечения в последующие дни суточная доза препарата не должна превышать 150 мг (в несколько введениОсобые группы пациентов.

Лица пожилого возраста (≥ 65 лет) Коррекции начальной дозы у пациентов в возрасте 65 лет и старше, как правило, не требуется. Однако, исходя из общих медицинских соображений, следует соблюдать осторожность у ослабленных пожилых пациентов или пациентов с низкой массой тела.

Пациенты с заболеваниями сердечно-сосудистой системы или высоким риском заболеваний сердечно-сосудистой системы

Следует с особой осторожностью применять препарат у пациентов с заболеваниями сердечно-сосудистой системы или высоким риском развития заболеваний сердечно-сосудистой системы. При необходимости длительной терапии (более 4 недель) у таких пациентов следует применять препарат в суточной дозе, не превышающей 100 мг.

Пациенты с почечной недостаточностью

Нет данных о необходимости коррекции дозы при применении препарата у пациентов с нарушениями функции почек в связи с отсутствием исследований безопасности применения препарата у пациентов данной категории. Следует соблюдать осторожность при применении препарата у пациентов с нарушением функции почек.

Применение препарата у пациентов с почечной недостаточностью (СКФ менее 15 мл/мин/1,73м²), противопоказано.

Пациенты с печеночной недостаточностью

Нет данных о необходимости коррекции дозы при применении препарата у пациентов с нарушениями функции печени легкой и средней степени тяжести в связи с отсутствием исследований безопасности применения препарата у данной категории пациентов.

Применение препарата у пациентов с нарушениями функции печени тяжелой степени противопоказано.

Дети

Рекомендуемая доза препарата Вольтарен суппозитории у детей в возрасте от 6 лет и старше на данный момент составляет 0,5 - 2 мг/кг массы тела в сутки (суточную дозу, в зависимости от тяжести проявлений заболевания, следует разделить на 2-3 разовые дозы). По показанию ювенильный ревматоидный артрит у детей в возрасте от 6 лет и старше суточная доза может быть максимально увеличена до 3 мг/кг (в несколько введений). Максимальная суточная доза – 150 мг не должна быть превышена.

Способ применения

Суппозитории необходимо вводить в прямую кишку. Рекомендуется применять препарат после опорожнения кишечника.

4.3 Противопоказания

- Обострение язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки, кровотечения из органов желудочно-кишечного тракта (ЖКТ), перфорация органов ЖКТ.
- Гиперчувствительность к диклофенаку или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1.
- Беременность в сроке более 20 недель.
- Как и другие НПВП (нестероидные противовоспалительные препараты), препарат Вольтарен противопоказан пациентам с полным или неполным сочетанием бронхиальной астмы, ангионевротического отека, крапивницы, острого ринита, рецидивирующего полипоза носа или околоносовых пазух и непереносимости ацетилсалициловой кислоты или других нестероидных противовоспалительных препаратов (в том числе в анамнезе).
- Нарушение функции печени тяжелой степени, почечная недостаточность (СКФ менее 15 мл/мин/1,73м²), хроническая сердечная недостаточность (II-IV функциональный класс по классификации NYHA).
- Клинически подтвержденная ишемическая болезнь сердца.
- Заболевания периферических артерий и сосудов головного мозга.
- Неконтролируемая артериальная гипертензия.
- Состояния, сопровождающиеся риском развития кровотечений.
- Подтвержденная гиперкалиемия.
- Аортокоронарное шунтирование (периоперационный период).

- Воспалительные заболевания кишечника (болезнь Крона, язвенный колит) в фазе обострения.
- Активные заболевания печени.
- Проктит.
- Период грудного вскармливания.
- Не рекомендовано применение суппозиториев в дозе 25 мг у детей в возрасте до 6 лет, 50 мг у детей в возрасте до 14 лет, в дозе 100 мг – у детей до 18 лет.

4.4 Особые указания и меры предосторожности при применении

С осторожностью

Особые указания, общие для системных нестероидных противовоспалительных препаратов:

При применении нестероидных противовоспалительных препаратов (НПВП), независимо от того, являются они селективными ингибиторами ЦОГ-2 или нет, в любое время могут возникнуть язвы желудочно-кишечного тракта, кровотечение или перфорация даже при отсутствии симптомов-предвестников или отягощенного анамнеза. Чтобы снизить риск данных осложнений, препарат следует применять в наименьшей эффективной дозе в течение минимального срока лечения.

В ходе плацебо-контролируемых исследований при применении некоторых селективных ингибиторов ЦОГ-2 был выявлен повышенный риск тромботических сердечно-сосудистых и цереброваскулярных осложнений. В настоящее время не известно, коррелирует ли этот риск напрямую с селективностью отдельных НПВП в отношении ЦОГ-1/ЦОГ-2. Поскольку сопоставимые данные клинических исследований длительного применения диклофенака в максимальной дозе отсутствуют, возможность сходного повышения риска исключить нельзя. До тех пор, пока такие данные не будут получены, перед применением диклофенака у пациентов с клинически подтвержденной ишемической болезнью сердца, нарушением мозгового кровообращения, окклюзионным заболеванием периферических артерий или значимыми факторами риска (например, артериальной гипертензией, гиперлипидемией, сахарным диабетом, курением) следует проводить тщательную оценку соотношения пользы и риска. Вследствие указанного риска препарат также следует применять в наименьшей эффективной дозе в течение минимального срока лечения.

К почечным эффектам НПВП относят задержку жидкости с развитием отека и/или артериальной гипертензии. По этой причине диклофенак следует с осторожностью применять у пациентов с сердечной недостаточностью и другими заболеваниями с повышенным риском задержки жидкости. Препарат также следует назначать с осторожностью пациентам, которые принимают диуретики или ингибиторы АПФ или имеют повышенный риск гиповолемии.

Более серьезные последствия обычно возникают у пожилых людей. Если у пациентов, принимающих Вольтарен, возникает желудочно-кишечное кровотечение или язва, лекарственный препарат следует отменить.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта

При применении препарата Вольтарен и других НПВП необходимо соблюдать осторожность и тщательно наблюдать пациентов с симптомами/признаками, указывающими на поражения/заболевания ЖКТ, или с анамнестическими данными, позволяющими заподозрить язвенное поражение желудка или кишечника, кровотечение или перфорацию; у пациентов с инфекцией *Helicobacter pylori* в анамнезе, язвенным колитом, болезнью Крона, с нарушением функции печени в анамнезе, и у пациентов с жалобами, позволяющими заподозрить заболевания ЖКТ. Риск развития желудочно-кишечного кровотечения возрастает при увеличении дозы НПВП или при наличии язвенного поражения в анамнезе, особенно кровотечений и перфорации язвы и у пожилых пациентов.

Прием НПВП, включая диклофенак, может быть связан с повышенным риском протечки анастомоза, расположенного в желудочно-кишечном тракте. При применении препарата Вольтарен после оперативного вмешательства на желудочно-кишечном тракте рекомендуется тщательное медицинское наблюдение и осторожность.

Следует соблюдать особую осторожность при применении препарата Вольтарен у пациентов, получающих препараты, увеличивающие риск желудочно-кишечных кровотечений: системные глюкокортикоиды (в том числе преднизолон), антикоагулянты (в том числе варфарин), антиагреганты (в том числе клопидогрел, ацетилсалициловая кислота) или селективные ингибиторы обратного захвата серотонина (в том числе циталопрам, флуоксетин, пароксетин, сертралин).

Нарушение функции печени

Осторожность необходима при применении препарата Вольтарен у пациентов с нарушением функции печени легкой и средней степени, а также у пациентов с печеночной порфирией, так как препарат может провоцировать приступы порфирии.

Следует с осторожностью применять препарат у пациентов с бронхиальной астмой, сезонным аллергическим ринитом, отеком слизистой оболочки носовой полости (в том числе с носовыми полипами), хронической обструктивной болезнью легких, хроническими инфекционными заболеваниями дыхательных путей (особенно ассоциированными с аллергическими ринитоподобными симптомами).

Нарушения со стороны сердечно-сосудистой системы

Особая осторожность требуется при лечении пациентов с сердечно-сосудистыми заболеваниями, нарушениями функции почек, включая хроническую почечную недостаточность (СКФ 15-60 мл/мин/1,73м²), дислипидемией/гиперлипидемией, сахарным диабетом, артериальной гипертензией, при лечении курящих пациентов или пациентов, злоупотребляющих алкоголем, при лечении пожилых пациентов, пациентов, получающих диуретики или другие препараты, влияющие на функцию почек, а также пациентов со значительным уменьшением объема циркулирующей крови (ОЦК) любой этиологии, например в периоды до и после массивных хирургических вмешательств.

Гемостаз

Следует с осторожностью применять препарат Вольтарен у пациентов с дефектами системы гемостаза.

Возраст > 65 лет

Следует соблюдать осторожность при применении препарата Вольтарен у пациентов пожилого возраста. Это особенно актуально для ослабленных или имеющих низкую массу тела пожилых людей – у пациентов данной категории рекомендуется применять препарат в минимальной эффективной дозе.

4.5 Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Взаимодействие с участием ингибиторов изофермента CYP2C9

Следует соблюдать осторожность при одновременном применении диклофенака и ингибиторов изофермента CYP2C9 (таких как вориконазол) из-за возможного увеличения

концентрации диклофенака в сыворотке крови и его экспозиции.

Взаимодействие с литием, дигоксином

Диклофенак может повышать содержание лития и концентрацию дигоксина в плазме крови. Рекомендуется контроль содержания лития и концентрации дигоксина в сыворотке крови.

Взаимодействие с диуретическими и гипотензивными средствами

При одновременном применении с диуретиками и гипотензивными препаратами (например, бета-адреноблокаторами, ингибиторами ангиотензин-превращающего фермента – АПФ) диклофенак может снижать их гипотензивное действие. В связи с вышесказанным у пациентов, особенно пожилого возраста, при одновременном применении диклофенака и диуретиков или гипотензивных средств следует регулярно измерять артериальное давление (АД), контролировать функцию почек и степень гидратации (вследствие повышения риска нефротоксичности).

Взаимодействие с циклоспорином и таクロлимусом

Влияние диклофенака на активность простагландинов в почках может усиливать нефротоксичность циклоспорина и таクロлимуса. В связи с вышесказанным доза диклофенака у пациентов, получающих циклоспорин или таクロлимус, должна быть ниже, чем у пациентов, не получающих указанные препараты.

Взаимодействие с препаратами, способными вызывать гиперкалиемию

Одновременное применение диклофенака с калий-сберегающими диуретиками, циклоспорином, таクロлимусом и триметопримом может привести к повышению содержания калия в плазме крови, (в случае такого одновременного применения данный показатель следует часто контролировать).

Взаимодействие с антибактериальными средствами - производные хинолона

Имеются отдельные сообщения о развитии судорог у пациентов, получавших одновременно производные хинолона и диклофенак.

Взаимодействие с НПВП и глюкокортикоидами

Одновременное системное применение диклофенака и других системных НПВП или глюкокортикоидов может увеличивать частоту возникновения НЯ (нежелательных явлений) (в частности, со стороны ЖКТ).

Взаимодействие с антикоагулянтами и антиагрегантами

Необходимо с осторожностью применять диклофенак с препаратами этих групп из-за риска

развития кровотечений. Несмотря на то, что в клинических исследованиях не было установлено влияния диклофенака на действие антикоагулянтов, существуют отдельные сообщения о повышении риска кровотечений у пациентов, принимавших данную комбинацию препаратов. Следует тщательно наблюдать пациентов, получающих одновременное лечение данными лекарственными препаратами.

Взаимодействие с селективными ингибиторами обратного захвата серотонина
Одновременное применение диклофенака с селективными ингибиторами обратного захвата серотонина повышает риск развития желудочно-кишечных кровотечений.

Взаимодействие с гипогликемическими препаратами

В клинических исследованиях установлено, что возможно одновременное применение диклофенака и гипогликемических препаратов, при этом эффективность последних не изменяется. Однако, известны отдельные сообщения о развитии в таких случаях как гипогликемии, так и гипергликемии, что обусловливало необходимость изменения дозы гипогликемических препаратов на фоне применения диклофенака. В связи с вышесказанным во время одновременного применения диклофенака и гипогликемических препаратов рекомендуется проводить контроль концентрации глюкозы в крови.

Получены отдельные сообщения о развитии метаболического ацидоза при одновременном применении диклофенака с метформином, в особенности у пациентов с нарушением функции почек.

Взаимодействие с метотрексатом

Следует соблюдать осторожность при применении диклофенака менее, чем за 24 часа до или через 24 часа после приема метотрексата, так как в таких случаях может повышаться концентрация метотрексата в крови и усиливаться его токсическое действие.

Взаимодействие с фенитоином

При одновременном применении фенитоина и диклофенака необходимо контролировать концентрацию фенитоина в плазме крови из-за возможного усиления его системного воздействия.

Взаимодействие с индукторами изофермента CYP2C9

Следует соблюдать осторожность при применении диклофенака одновременно с индукторами изофермента CYP2C9 (такими, как рифампицин), поскольку это может привести к значительному уменьшению концентрации диклофенака в плазме крови и

уменьшению его экспозиции.

4.6 Фертильность, беременность и лактация

Беременность

При применении НПВП у женщин, начиная с 20-й недели беременности, возможно развитие маловодия и/ или патологии почек у новорожденных (неонатальная почечная дисфункция). Недостаточно данных о безопасности применения диклофенака у беременных женщин, в связи с чем применять препарат Вольтарен до 20-й недели беременности следует только по назначению врача в тех случаях, когда ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

Диклофенак, как и другие НПВП (ингибиторы синтеза простагландинов), противопоказан в последние 3 месяца беременности (возможно подавление сократительной способности матки и/или преждевременное закрытие артериального протока у плода).

Лактация

Несмотря на то, что диклофенак, как и другие НПВП, проникает в грудное молоко в малом количестве, препарат не следует применять в период грудного вскармливания во избежание нежелательного влияния на ребенка. При необходимости применения препарата у женщины в этот период грудное вскармливание прекращают.

Фертильность

Поскольку диклофенак, как и другие НПВП, может оказывать отрицательное действие на фертильность, женщинам, планирующим беременность, не рекомендуется применять препарат.

Пациенткам, проходящим обследование и лечение по поводу бесплодия, препарат следует отменить.

4.7 Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

Пациентам, у которых на фоне применения препарата Вольтарен возникают зрительные нарушения, головокружение, сонливость, вертиго или другие нарушения со стороны центральной нервной системы, не следует управлять транспортными средствами и работать с механизмами.

4.8 Нежелательные реакции

Резюме профиля безопасности

Ниже приведены нежелательные лекарственные реакции (НР), которые были выявлены в ходе клинических исследований, а также при применении диклофенака в клинической практике.

Для оценки частоты НР использованы следующие критерии: «очень часто» ($\geq 1/10$); «часто» ($\geq 1/100, < 1/10$); «нечасто» ($\geq 1/1000, < 1/100$); «редко» ($\geq 1/10\ 000, < 1/1000$); «очень редко» ($< 1/10\ 000$). НР сгруппированы в соответствии с системно-органным классом медицинского словаря для нормативно-правовой деятельности MedDRA, в пределах каждого класса НР перечислены в порядке убывания частоты встречаемости; в пределах каждой группы, выделенной по частоте встречаемости, НР распределены в порядке уменьшения их важности.

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы

Очень редко – тромбоцитопения, лейкопения, гемолитическая анемия, апластическая анемия, агранулоцитоз.

Нарушения со стороны иммунной системы

Редко – гиперчувствительность, анафилактические/анафилактоидные реакции, включая снижение АД и шок;

Очень редко – ангионевротический отек (включая отек лица).

Психические нарушения

Очень редко – дезориентация, депрессия, бессонница, кошмарные сновидения, раздражительность, психические нарушения.

Нарушения со стороны нервной системы

Часто – головная боль, головокружение;

Редко – сонливость;

Очень редко – нарушения чувствительности, включая парестезии, расстройства памяти, трепор, судороги, ощущение тревоги, острые нарушения мозгового кровообращения, асептический менингит.

Нарушения со стороны органа зрения

Очень редко – нарушения зрения (затуманивание зрения), диплопия.

<p><i>Нарушения со стороны органа слуха и лабиринта</i></p> <p>Часто – вертиго;</p> <p>Очень редко – нарушения слуха, шум в ушах.</p>
<p><i>Нарушения со стороны сердца</i></p> <p>Нечасто – инфаркт миокарда, сердечная недостаточность, ощущение сердцебиения, боль в груди;</p> <p>Частота неизвестна - Синдром Коуниса (аллергический острый коронарный синдром).</p>
<p><i>Нарушения со стороны сосудов</i></p> <p>Очень редко – повышение АД, васкулит.</p>
<p><i>Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения</i></p> <p>Редко – бронхиальная астма (включая одышку);</p> <p>Очень редко - пневмонит.</p>
<p><i>Желудочно-кишечные нарушения</i></p> <p>Часто – абдоминальная боль, тошнота, рвота, диарея, диспепсия, метеоризм, снижение аппетита;</p> <p>Редко – гастрит, желудочно-кишечное кровотечение, рвота кровью, мелена, диарея с примесью крови, язвы желудка и кишечника (с или без кровотечения, стеноза или перфорации, с возможным развитием перитонита);</p> <p>Очень редко – стоматит, глоссит, повреждения пищевода, возникновение диафрагмоподобных структур в кишечнике, колит (неспецифический геморрагический колит, ишемический колит, обострение язвенного колита или болезни Крона), запор, панкреатит, дисгевзия.</p>
<p><i>Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей</i></p> <p>Часто – повышение активности аминотрансфераз в плазме крови;</p> <p>Редко – гепатит, желтуха, нарушения функции печени;</p> <p>Очень редко – молниеносный гепатит, некроз печени, печеночная недостаточность.</p>
<p><i>Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей</i></p> <p>Часто – кожная сыпь; редко – крапивница;</p> <p>Очень редко – буллезный дерматит, экзема, эритема, многоформная эритема, синдром Стивенса-Джонсона, синдром Лайелла (токсический эпидермальный некролиз),</p>

эксфолиативный дерматит, зуд, алопеция, реакции фоточувствительности, пурпур, пурпур Шенлейна-Геноха.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей

Очень редко – острое поражение почек (острая почечная недостаточность), гематурия, протеинурия, тубуло-интерстициальный нефрит, нефротический синдром, папиллярный некроз.

Общие расстройства и нарушения в месте введения

Часто – раздражение в месте введения;

Редко – отеки.

Описание отдельных нежелательных реакций

Нарушения со стороны органов зрения

Зрительные расстройства, такие как нарушение зрения, затуманивание зрения или диплопия, по-видимому, являются класс-эффектами НПВП, и обратимы после прекращения применения. Возможным механизмом развития таких расстройств является ингибирование синтеза простагландинов и других сопутствующих веществ, что изменяет регуляцию кровотока в сетчатке, которое проявляется потенциальными зрительными расстройствами. При развитии таких симптомов на фоне терапии диклофенаком следует рассмотреть возможность офтальмологического обследования для исключения каких-либо других причин.

Нарушения со стороны сердца и сосудов

Данные клинических исследований указывают на небольшое увеличение риска развития сердечно-сосудистых тромботических осложнений (например, инфаркта миокарда), особенно при длительном применении диклофенака в высоких дозах (суточная доза более 150 мг).

Сообщения о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации лекарственного препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза – риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата

через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств – членов Евразийского экономического союза.

Российская Федерация

Адрес: 109074, Москва, Славянская площадь, д. 4, стр. 1

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения Российской Федерации

Телефон: +7 (499) 578-06-70, +7 (499) 578-02-20

Факс: +7 (495) 698-15-73

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт: <https://www.roszdravnadzor.gov.ru>

4.9 Передозировка

Симптомы

Рвота, желудочно-кишечное кровотечение, диарея, головокружение, шум в ушах, судороги.

В случае значительного отравления, возможно развитие острой почечной недостаточности и поражения печени.

Лечение

Поддерживающее и симптоматическое лечение показано при таких осложнениях как снижение АД, почечная недостаточность, судороги, нарушения со стороны ЖКТ и угнетение дыхания. Форсированный диурез, гемодиализ или гемоперфузия для выведения НПВП, в т.ч. диклофенака, из организма неэффективны, так как действующие вещества этих препаратов в значительной степени связываются с белками плазмы крови и подвергаются интенсивному метаболизму.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: нестериоидный противовоспалительный препарат (НПВП).

Код ATХ: M01AB05

Механизм действия

Препарат Вольтарен содержит диклофенак натрия, вещество нестериоидной структуры, оказывающее выраженное противовоспалительное, анальгезирующее и жаропонижающее действие. Основным механизмом действия диклофенака, установленным в исследованиях, считается торможение биосинтеза простагландинов. Простагландины играют важную роль в генезе воспаления, боли и лихорадки.

In vitro диклофенак натрия в концентрациях, эквивалентным тем, которые достигаются при применении у человека, не подавляет биосинтез протеогликанов хрящевой ткани.

При ревматических заболеваниях противовоспалительное и анальгезирующее свойства препарата обеспечивают клинический эффект, характеризующийся значительным уменьшением выраженности таких проявлений, как боль в покое и при движении, утренняя скованность и припухлость суставов, а также улучшением функционального состояния. При посттравматических и послеоперационных воспалительных явлениях диклофенак быстро купирует боль (как в покое, так и при движении), уменьшает воспалительный отек и отек послеоперационной раны.

При применении препарата отмечен выраженный анальгезирующий эффект при умеренной и сильной боли неревматического происхождения. Также установлено, что диклофенак способен уменьшать болевые ощущения и снижать кровопотерю при первичной дисменорее. Препарат облегчает приступы мигрени при применении в ректальных суппозиториях.

5.2 Фармакокинетические свойства

Абсорбция

Всасывание диклофенака из ректальных суппозиториев начинается быстро, хотя скорость его всасывания меньше по сравнению с аналогичным показателем при приеме внутрь таблеток, покрытых кишечнорастворимой оболочкой. После применения ректального суппозитория, содержащего 50 мг активного вещества, максимальная концентрация его в плазме достигается в среднем в пределах 1 часа, но величина максимальной концентрации, рассчитанная на единицу принимаемой дозы, составляет примерно 2/3 от соответствующего показателя, регистрирующегося после приема внутрь для кишечнорастворимой таблетки. Количество всасывающегося действующего вещества находится в прямой зависимости от величины дозы препарата. Так как около половины

диклофенака метаболизируется во время первого прохождения через печень (эффект «первого прохождения»), площадь под кривой «концентрация – время» (AUC) после применения препарата внутрь или ректально составляет примерно половину от эквивалентной дозы, применяемой парентерально.

При повторных введениях препарата в виде суппозиториев фармакокинетические показатели не изменяются. При условии соблюдения рекомендуемого режима дозирования препарата кумуляции не отмечается.

Распределение

Связь с белками сыворотки крови – 99,7%, преимущественно с альбумином (99,4%). Кажущийся объем распределения составляет 0,12-0,17 л/кг.

Диклофенак проникает в синовиальную жидкость, где его максимальная концентрация достигается на 2-4 часа позже, чем в плазме крови. Кажущийся период полувыведения из синовиальной жидкости составляет 3-6 часов. Через 2 часа после достижения максимальной концентрации в плазме крови концентрация диклофенака в синовиальной жидкости выше, чем в плазме крови, и ее значения остаются более высокими на протяжении периода времени до 12 часов.

Диклофенак был обнаружен в низких концентрациях (100 нг/мл) в грудном молоке одной из кормящих матерей. Предполагаемое количество диклофенака, попадающего с грудным молоком в организм ребенка, эквивалентно 0,03 мг/кг/сутки.

Биотрансформация

Метаболизм диклофенака осуществляется частично путем глюкуронизации неизмененной молекулы, но, преимущественно, посредством однократного и многократного гидроксилирования и метоксилирования, что приводит к образованию нескольких фенольных метаболитов (3'-гидрокси-, 4'-гидрокси-, 5'-гидрокси-, 4',5-дигидрокси- и 3'-гидрокси-4'-метоксидиклофенака), большинство из которых превращается в глюкуронидные коньюгаты. Два из этих фенольных метаболитов биологически активны, но в значительно меньшей степени, чем диклофенак.

Элиминация

Общий системный плазменный клиренс диклофенака составляет 263 ± 56 мл/мин. Конечный период полувыведения составляет 1-2 часа. Период полувыведения 4-х метаболитов, включая два фармакологически активных, также непродолжителен и составляет 1-3 часа.

Один из метаболитов, 3'-гидрокси-4'-метокси-диклофенак, имеет более длительный период полувыведения, однако этот метаболит полностью неактивен.

Около 60% дозы выводится почками в виде глюкуроновых конъюгатов неизмененного действующего вещества, а также в виде метаболитов, большинство из которых тоже представляют собой глюкуроновые конъюгаты. В неизмененном виде выводится менее 1% диклофенака. Оставшаяся часть дозы выводится в виде метаболитов с желчью.

Концентрация действующего вещества в плазме крови линейно зависит от величины принятой дозы.

Почечная недостаточность

При соблюдении рекомендованного режима дозирования кумуляции неизмененного действующего вещества не отмечается. При клиренсе креатинина менее 10 мл/мин расчетные равновесные концентрации гидроксиметаболитов диклофенака примерно в 4 раза выше, чем у здоровых добровольцев, при этом метаболиты выводятся исключительно с желчью.

Печеночная недостаточность

У пациентов с хроническим гепатитом или компенсированным циррозом печени показатели фармакокинетики диклофенака аналогичны таковым у пациентов с сохранный функцией печени.

Лица пожилого возраста

У некоторых пациентов пожилого возраста после 15-минутной внутривенной инфузии отмечено увеличение концентрации диклофенака в плазме крови на 50% по сравнению с таковым показателем у здоровых добровольцев более молодого возраста.

Особые группы пациентов

Всасывание, метаболизм и выведение диклофенака не зависят от возраста.

Дети

Концентрации диклофенака в плазме крови при применении эквивалентных доз препарата (мг/кг массы тела) сходны с соответствующими показателями у взрослых.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1 Перечень вспомогательных веществ

Вольтарен, 25 мг, суппозитории ректальные

Твердый жир до 1,0 г.

Вольтарен, 50 мг, суппозитории ректальные

Твердый жир до 2,0 г.

Вольтарен, 100 мг, суппозитории ректальные

Твердый жир до 2,0 г.

6.2 Несовместимость

Не применимо.

6.3 Срок годности (срок хранения)

3 года.

6.4 Особые меры предосторожности при хранении

Хранить при температуре не выше 30°C.

6.5 Характер и содержание первичной упаковки

Суппозитории ректальные 25 мг или 50 мг: по 5 суппозиторий в блистере из ПВХ, ламинированного с внутренней стороны ПЭ низкой плотности. По 2 блистера вместе с листком-вкладышем в картонную пачку.

Суппозитории ректальные 100 мг: по 5 суппозиторий в блистере из ПВХ, ламинированного с внутренней стороны ПЭ низкой плотности. По 1 блистеру вместе с листком-вкладышем в картонную пачку.

Допускается наличие контроля первого вскрытия на картонной пачке.

6.6 Особые меры предосторожности при уничтожении использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения

лекарственного препарата и другие манипуляции с препаратом

Особые требования отсутствуют.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Новартис Фарма АГ, Лихтштрассе 35, 4056 Базель, Швейцария / Novartis Pharma AG, Lichtstrasse 35, 4056 Basel, Switzerland

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

ООО «Новартис Фарма»

125315 г. Москва, Ленинградский проспект, 70

тел.: +7 495 967 12 70

факс: +7 495 967 12 68

эл. почта: drug.safety_russia@novartis.com

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

Дата первой регистрации:

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата Вольтарен доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-коммуникационной сети «Интернет» <http://eec.eaeunion.org/>