

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування препарату

ІНФЕНАК

(INFNAC)

Загальна характеристика:

міжнародна та хімічна назви: *aceclofenac*;

2-[(2,6-дихлорфеніл) аміно] феніл ацетооцтова кислота;

основні фізико-хімічні властивості: білі капсулоподібні таблетки, вкриті плівковою оболонкою, гладенькі з обох боків;

склад: 1 таблетка, вкрита плівковою оболонкою, містить 100 мг ацеклофенаку;

допоміжні речовини: целюлоза мікрокристалічна, кросповідон, гідроксипропіл целюлоза, гліцерил пальмітостеарат, сансел pH 102, Ac-Di-Sol, магнію стеарат, гіпромелоза 6 CP, титану діоксид, тальк, пропіленгліколь.

Форма випуску. Таблетки, вкриті плівковою оболонкою.

Фармакотерапевтична група. Не стероїдні протизапальні та протиревматичні засоби.
01AB 16.

Код АТС М

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Не стероїдний протизапальний та протиревматичний засіб, похідне феніл оцтової кислоти, за хімічним складом подібний до диклофенаку. Ацеклофенак справляє протизапальну, знеболюючу та жарознижуючу дії. Інгібуючи ЦОГ, ацеклофенак пригнічує синтез простагландинів і таким чином впливає на патогенез запалення, виникнення болю та гарячки. При ревматичних захворюваннях протизапальна та анальгезуюча дія ацеклофенаку сприяє значному послабленню болю, ранішній skutostі, припухлості суглобів, що покращує функціональний стан пацієнта.

Фармакокінетика.

Всмоктування

Ацеклофенак добре всмоктується після перорального застосування, його біодоступність дорівнює майже 100%. Пікова концентрація в плазмі крові досягається приблизно впродовж 1,25-3 год після застосування. Т_{max} (час досягнення максимальної концентрації) збільшується за одночасного вживання із їжею, в той час як на ступінь всмоктування це не впливає.

Розподіл

Ацеклофенак зв'язується із білками (>99,7). Препарат проникає в синовіальну рідину, де його концентрація становить 60% від концентрації у плазмі крові. Об'єм розподілу становить майже 30 л.

Виведення

Середній період напів виведення з плазми крові дорівнює 4-4,3 год. Кліренс, за оцінками, становить 5 л на годину. Приблизно дві третини застосованої дози виводиться із сечею у вигляді кон'югованих гідроксиметаболітів. Лише 1 % перорально застосованої разової дози виводиться у незміненому вигляді. Ацеклофенак метаболізується переважно в печінці в 4'-гідроксіяцеклофенак, а також в інші метаболіти, включаючи диклофенак. Ацеклофенак, вірогідно, метаболізується CYP2C9 до основного метаболіту 4'-гідроксіяцеклофенаку, внесок якого в клінічну активність, ймовірно, незначний.

Характеристика у різних групах пацієнтів

Не було виявлено жодних змін фармакокінетики ацеклофенаку в пацієнтів літнього віку.

Уповільнена швидкість виведення після разової дози ацеклофенаку відзначалася в пацієнтів зі зниженими функціями печінки. У дослідженні повторюваних доз, за використання 100 мг препарату раз на день, не спостерігалось жодних відмінностей у фармакокінетичних параметрах у пацієнтів із слабким та помірним цирозом печінки та у здорових осіб.

Показання для застосування.

Для полегшення болю та запалення у випадку остеоартриту, ревматоїдного артрити та анкілозуючого спондиліту.

Спосіб застосування та дози.

Максимальна рекомендована доза для дорослих дорівнює 200 мг на добу, що приймається як дві окремі дози по 100 мг, одна таблетка вранці та одна ввечері. Ацеклофенак можна вживати як до, так і після їжі.

Таблетки ацеклофенаку призначені для перорального застосування і їх слід ковтати цілими, запиваючи достатньою кількістю рідини.

При прийомі ацеклофенаку здоровими добровольцями їжа впливала тільки на швидкість, а не на ступінь всмоктування ацеклофенаку, таким чином, ацеклофенак можна приймати разом з їжею.

Рекомендовані дози:

Пацієнти літнього віку. Загалом не вимагається зменшення дози. Фармакокінетика ацеклофенаку в літніх осіб не змінюється, таким чином немає необхідності змінювати дозування чи частоту застосування.

Як і при застосуванні інших не стероїдних протизапальних препаратів (НПЗП), слід з обережністю лікувати пацієнтів літнього віку, які загалом більш схильні до проявів небажаних явищ, в яких із більшою вірогідністю будуть порушені ниркові, серцево-судинні та печінкові функції та які, швидше за все, вживатимуть супутні препарати.

Ниркова недостатність

Немає свідчень необхідності зміни дози ацеклофенаку у хворих із легким ступенем ниркової недостатності, проте, як і при застосуванні інших НПЗП, слід бути дуже обережними.

Печінкова недостатність

Легка і середня форма по 100 мг на добу, тяжка форма – не рекомендується.

Існують деякі докази того, що доза ацеклофенаку повинна бути зменшена для пацієнтів з печінковою недостатністю, і пропонується використовувати початкову дозу 100 мг.

Побічна дія.

Загалом ацеклофенак переноситься добре. Більшість побічних ефектів, що спостерігалися, були оборотними та незначними; до них належали шлунково-кишкові розлади (диспепсія, біль у животі, нудота та діарея) та інколи запаморочення. Дерматологічні побічні ефекти являли собою висипання та свербіж. Зрідка повідомлялося про аномальний рівень печінкових ферментів та підвищення креатиніну в сироватці крові.

Протипоказання.

Ацеклофенак протипоказаний:

1. пацієнтам із підвищеною чутливістю до ацеклофенаку чи будь-якої допоміжної речовини в складі препарату;
2. пацієнтам, в яких речовини подібної дії (наприклад ацетил саліцилова кислота або інші НПЗП), провокують напади астми, бронхоспазм, гострий риніт чи кропив'янку, а також пацієнтам із підвищеною чутливістю до цих препаратів;
3. пацієнтам із активною чи підозрюваною виразкою шлунка чи дванадцяти палої кишки, пацієнтам із рецидивною виразкою шлунка чи дванадцяти палої кишки в анамнезі, особам із шлунково-кишковою кровотечею чи іншими активними кровотечами або іншими порушеннями із кровотечею;
4. пацієнтам з тяжкою формою серцевої недостатності або с серйозним порушенням функції нирок;
5. III триместр вагітності.

Передозування.

У випадку гострого отруєння не стероїдними протизапальними препаратами слід вдатися до підтримуючого та симптоматичного лікування.

Відсутні дані про передозування ацеклофенаком у людини. Терапевтичні заходи, до яких слід вдатися: запобігання всмоктуванню якомога швидше після передозування шляхом промивання шлунка та застосування активованого вугілля; у випадках ускладнень, таких як артеріальна гіпотензія, ниркова недостатність, судоми, подразнення ШКТ та пригнічення дихання, слід вдатися до підтримуючого та симптоматичного лікування; специфічні заходи, такі як форсований діурез, діаліз чи гемодіаліз, вочевидь, не допоможуть у виведенні не стероїдних протизапальних препаратів через високий ступінь їх зв'язування із протеїнами та екстенсивний метаболізм.

Особливості застосування.

Ацеклофенак слід застосовувати із обережністю та під ретельним медичним наглядом особам із захворюваннями травного шляху та таким, які мають в анамнезі виразку шлунка і дванадцяти палої кишки, із церебро-васкулярними кровотечами, виразковими колітами, хворобою Крона, системним червоним вовчаком, порфірією, розладами гемопоезу та коагуляції.

З обережністю слід застосовувати препарат пацієнтам із слабкими та помірними порушеннями функції печінки, нирок чи серця, а також особам зі станами, що сприяють затриманню рідини. У таких пацієнтів НПЗП можуть призводити до розладу функції нирок та затримання рідини. Обережності також слід дотримуватися пацієнтам, котрі лікуються діуретиками, через ризик гіповолемії.

Слід з обережністю застосовувати препарат пацієнтам літнього віку, які взагалі більш схильні до прояву небажаних реакцій. Наслідки, такі як шлунково-кишкова кровотеча та/чи перфорація, часто серйозніші і можуть виникати в будь-який час у період лікування за відсутності тривожних симптомів чи попередніх подій. Особи літнього віку з більшою вірогідністю страждатимуть на порушення ниркових, кардіоваскулярних чи печінкових функцій.

Усі пацієнти, що знаходяться на тривалому лікуванні НПЗП, повинні перебувати під наглядом лікаря (наприклад, ниркові, печінкові функції та аналіз крові).

Використання ацеклофенаку, як і будь-якого іншого препарату, що пригнічує синтез циклооксигенази/простагландину, може зашкодити репродуктивній функції і не рекомендується для застосування жінкам, які планують завагітніти. У жінок, яким важко завагітніти чи які проходять обстеження у зв'язку із безпліддям, слід розглянути питання про припинення використання ацеклофенаку.

Діти. Клінічні дані щодо застосування ацеклофенаку у дітей відсутні. Безпечність та ефективність не встановлені.

Вагітність. Немає інформації щодо використання ацеклофенаку під час вагітності. Препарат не повинен призначатися у I та II триместрах вагітності.

Період годування груддю. Немає інформації щодо проникнення ацеклофенаку в грудне молоко. Ацеклофенак під час лактації повинен застосовуватися лише тоді, коли потенційна користь буде більшою за потенційний ризик для дитини.

Вплив на здатність керувати автомобілем і працювати зі складними механізмами. Пацієнти, які страждають на запаморочення або інші порушення центральної нервової системи, під час лікування ацеклофенаком повинні утримуватися від керування автомобілем та праці зі складними механізмами.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами.

Не проводилося жодних досліджень фармакокінетичної взаємодії, окрім як із варфарином.

Ацеклофенак метаболізується системою цитохромів P 450 2C 9 та дані вивчення *in vitro* показують, що ацеклофенак може інгібувати цей фермент. Таким чином, існує ризик фармакокінетичної взаємодії із фенітоїном, циметидином, тол бутамідом, фенілбутазоном, аміодароном, міконазолом та фульфафеназолом. Як і у випадку інших препаратів класу НПЗП, існує також ризик фармакокінетичної взаємодії із препаратами, що активно виводяться сечовим шляхом, такими як метотрексат та літій. Ацеклофенак майже повністю зв'язується альбуміном плазми крові, отже слід враховувати ймовірність взаємодії за типом витискання із іншими препаратами, що значною мірою зв'язуються протеїнами.

Виходячи із недостатньої кількості досліджень фармакокінетичної взаємодії, подальше спирається на загальну інформацію про інші НПЗП:

Слід уникати таких комбінацій:

НПЗП пригнічують тубулярну секрецію метотрексату і може спостерігатися незначна метаболічна взаємодія із подальшим зниженням кліренсу метотрексату. Таким чином, під час лікування високими дозами метотрексату слід завжди уникати призначення НПЗП.

Деякі НПЗП пригнічують нирковий кліренс літію, що призводить до підвищення його концентрації у сироватці крові. Слід уникати даного поєднання, якщо немає можливості проводити частий моніторинг рівнів літію у крові.

Препарати класу НПЗП пригнічують накопичення тромбоцитів і ушкоджують слизову оболонку травного шляху, що може посилити активність антикоагулянтів та підвищити ризик кровотечі у травному шляху в пацієнтів, що застосовують антикоагулянти. Слід уникати поєднання ацеклофенаку із антикоагулянтами кумаринової групи, тиклопідином, тромболітиками та гепарином, якщо немає можливості ретельного спостереження.

Подальші комбінації можуть вимагати корекції дози та обережності

Слід враховувати можливу взаємодію НПЗП із метотрексатом, навіть за використання малих доз метотрексату, особливо в пацієнтів із послабленими нирковими функціями.

Якщо необхідно вдатися до комбінованої терапії, слід стежити за нирковими функціями. Необхідно дотримуватися обережності, якщо НПЗП та метотрексат застосовуються у 24-годинний період, оскільки рівні метотрексату можуть зрости, що призводить до підвищеної токсичності.

Застосування НПЗП із циклоспорином або такролімусом може збільшити ризик нефротоксичності внаслідок зниженого синтезу проста цикліну в нирках.

Таким чином, у період комбінованої терапії необхідно ретельно контролювати ниркові функції.

Супутне застосування аспірину та інших не стероїдних протизапальних препаратів може підвищити частоту побічних ефектів.

НПЗП можуть послаблювати діуретичну дію фуросеміду, буметаніду та гіпотензивну дію тіазидів. Супутнє лікування калій зберігаючи ми діуретиками може призвести до підвищених рівнів калію, тому слід контролювати вміст калію у сироватці.

НПЗП також можуть послаблювати дію певних протигіпертензивних препаратів. Інгібітори ангіотензин-конвертуючого ферменту чи антагоністи ангіотензин II-рецепторів у поєднанні із НПЗП можуть спричинити погіршення ниркових функцій. Ризик гострої ниркової недостатності, зазвичай оборотної, може зростати в деяких пацієнтів із порушеннями ниркових функцій, таких як особи літнього віку чи зі зневодненням. Тому поєднання із НПЗП слід застосовувати з обережністю, пацієнти мають споживати достатню кількість рідини, а також слід зважати на можливість контролю ниркових функцій.

Не було помічено, щоб ацеклофенак впливав на контроль кров'яного тиску за одночасного застосування із бендрофлюазидом, хоча не можна виключати взаємодію із іншими протигіпертензивними засобами, такими як бета-блокатори.

Інші можливі взаємодії.

Були окремі повідомлення про гіпоглікемічні та гіперглікемічні ефекти. Тому у випадку застосування ацеклофенаку слід розглянути корекцію дози препаратів, що можуть спричинити гіпоглікемію.

Умови та термін зберігання. Зберігати у недоступному для дітей місці при температурі від 15 до 25 °С. Термін придатності – 3 роки.

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка. 10 таблеток у блістері, по 1 блістеру в картонній коробці.

Виробник. "Туліп Лаб Прайвіт Лімітед", Індія.

Адреса. Туліп Лаб Прайвіт Лімітед.

Індія, 215, Ананд радж індастріал естет Офф Л. Б. С марг, Бхандуп (w), Мумбаї – 400 078.

Заявник. “Тулп Лаб Прайвіт Лімітед”, Індія.

Адреса. Тулп Лаб Прайвіт Лімітед.

Індія, 215, Ананд радж індастріал естет Офф Л. Б. С марг, Бхандуп (w), Мумбаї – 400 078.