

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО

Приложение към
разрешение за употреба № 11-6850/30.01.03.

031/17.12.02 *[Signature]*

Diclac[®]retard

100 mg

Modified-Release Tablets

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА



1. Търговско име на лекарствения продукт:

Dicloac®retard

/Диклак ретард/

2. Количествен и качествен състав:

1 таблетка с изменено освобождаване съдържа:

100 mg diclofenac sodium

3. Лекарствена форма:

Таблетки с изменено освобождаване

4. Клинични данни:

4.1. Показания:

За симптоматично лечение при хронични и обострени възпалителни, дегенеративни и травматични заболявания на мускулно скелетния апарат:

- остър артрит, включително пристъпи на подагра
- хроничен артрит, хроничен полиартрит/ревматоиден артрит
- анкилозиращ спондилит, възпалително-ревматични заболявания на гръбначния стълб
- възпалителни процеси при дегенеративни заболявания на ставите и гръбначния стълб (артроза и спондилоартроза)
- ревматизъм на меките тъкани
- възпаление след травми или операции

4.2. Дозировка и начин на приложение:

Възрастни

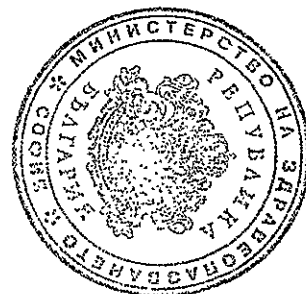
Препоръчителната дневна дозировка в зависимост от тежестта на заболяването е между 50 и 150 mg diclofenac sodium.

При възрастни се прилага 1 таблетка с изменено освобождаване веднъж дневно.

Ако е необходимо, дневната доза може да бъде увеличена до 2 таблетки с изменено освобождаване веднъж дневно.

Деца и подрастващи

Таблетките с изменено освобождаване не са подходящи за деца и подрастващи поради високото съдържание на активната съставка.



Таблетките с модифицирано освобождаване се приемат без да се съдвкват с достатъчно количество течност.

Продължителността на приложение зависи от индивидуалното показание.

4.3. Противопоказания:

Diclac не трябва да се прилага при случаи на:

- известна свръхчувствителност към активната съставка diclofenac и други НСПВС
- необратими нарушения в кръвообразуването
- язва на стомаха и дванадесетопръстника
- при деца и подрастващи
- през последните три месеца на бременността

4.4. Специални противопоказания и специални предупреждения за употреба:

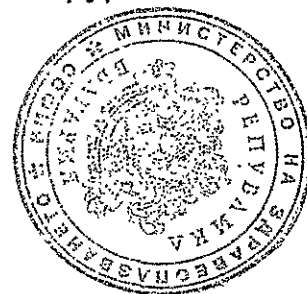
Diclac трябва да се прилага само след внимателна преценка на съотношението риск/полза при:

- индуцирана порфирия
- пациенти, страдащи от системен лупус еритематозус (SLE) и смесени колагенози (смесено заболяване на съединителната тъкан)
- през първото и второ тримесечие на бременността
- по време на кърмене

Употребата на диклофенак може да наруши фертилитета и не се препоръчва при жени, очакващи да забременеят. При жени, които имат трудности при забременяване или са подложени на изследване за инфертилитет, се препоръчва да се спре приема на диклофенак.

Необходимо е особено внимателно наблюдение от лекар при:

- пациенти с анамнеза на гастроинтестинални оплаквания, язва на стомаха, червата или чревни възпаления (улцерозен колит, болест на Крон)
- пациенти с чернодробни или бъбречни увреждания, високо кръвно налягане и/или сърдечна недостатъчност
- пациенти непосредствено след големи хирургични интервенции



- пациенти в напреднала възраст

Diclofenac може да се прилага само при спазване на определени предпазни мерки (готовност за спешна реакция) при пациенти, които проявяват свръхчувствителност към нестероидни противовъзпалителни продукти или аналгетици, напр. астматични пристъпи, кожни реакции или остър алергичен ринит. Пациенти с астма, хронични обструктивни респираторни заболявания, сенна хрема или назални полипи реагират с астматични пристъпи, локализирани отоци на кожата, мукозната мембрана (Едема на Квинке) или уртикария при приложение на нестероидни противовъзпалителни продукти много по-често, отколкото други пациенти.

4.5. Лекарствени и други взаимодействия:

Едновременното приложение на diclofenac с дигоксин или литиеви препарати може да повиши плазмените концентрации на дигоксин или литий.

Diclofenac може да понижи ефикасността на диуретиците и антихипертензивните продукти.

Едновременното приложение на ацетилсалицилова киселина води до редуция в концентрацията на диклофенак в серума.

Едновременното приложение на diclofenac и калий-съхраняващи диуретици може да доведе до хиперкалиемия.

Едновременното приложение на diclofenac заедно с глюкокортикоиди или други противовъзпалителни продукти повишава риска от гастроинтестинално кървене. Приложението на diclofenac 24 часа преди или след приложение на метотрексат може да доведе до повишената му концентрация и повишаване на токсичните му ефекти.

Клинични проучвания не са показали взаимодействия между diclofenac и антикоагуланти. Независимо от това се препоръчва съответно проследяване на коагулационния статус като предпазна мярка при такава комбинирана терапия.

Нестероидните противовъзпалителни продукти (като diclofenac sodium) могат да засилят бъбречната токсичност на циклоспорин.

Съобщени са отделни случаи на влияние върху нивото на глюкозата в кръвта след приложение на diclofenac. При такива случаи е необходимо определяне дозата на антидиабетичните продукти.



4.6. Бременност и кърмене:

Няма достатъчно данни по отношение на сигурността при приложение при бременни жени. Тъй като не е изяснено как влияе инхибицията на простагландиновата синтеза върху бременността, diclofenac sodium не трябва да се прилага през първите 6 месеца на бременността. Diclofenac е противопоказан през последните три месеца на бременността. В резултат на неговия механизъм на действие могат да възникнат инхибиране на раждането, преждевременно затваряне на протока на Botallo, засилена тенденция към хеморагии при майката и детето и засилено образуване на едема.

Малки количества от diclofenac преминават в майчиното мляко. По възможност приложението по време на кърмене трябва да се избягва.

4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини:

Този продукт, дори приет в нормални дози, може да доведе до съществени промени в способността Ви да реагирате и да наруши способността Ви за шофиране и работа с машини. Това е възможно особено при комбиниране с алкохол.

4.8. Нежелани лекарствени реакции:

Панкреас

Съобщени са били отделни случаи на възпаление на панкреаса (панкреатит).

Кръв

В редки случаи терапията може да доведе до нарушения в кръвообразуването (агранулоцитоза, анемия, левкопения, тромбоцитопения). Начални симптоми могат да бъдат: силно изтощение, повишена температура, грипозни оплаквания, болки в гърлото, кървене от кожата или носа и суперфициален соор в устата. При продължителна терапия трябва да бъде проследен броят на кръвните клетки през регулярни интервали. В отделни случаи терапията е довела до хемолитична анемия.

Кожа

Рядко са били наблюдавани реакции на свръхчувствителност като кожни обриви, сърбеж, косопад или уртикария. В отделни



случаи са наблюдавани кожни обриви с везикуляция, екзема, еритема, свръхчувствителност към светлина, малки точковидни кожни хеморагии (също алергично обусловени) и тежки кожни реакции (синдром на Lyell, синдром на Stevens-Johnson).

Имунна система

Възможни са тежки реакции на свръхчувствителност. Те могат да се манифестират с фациална едема, подуване на езика, оток на ларинкса с констрикция на респираторния тракт, диспнея до астматичен пристъп, тахикардия, спадане на кръвното налягане до животозастрашаващ шок. Ако възникнат някои от тези симптоми, което е възможно дори и при първото приложение, е необходимо незабавно да се потърси консултация от лекар.

В отделни случаи са били наблюдавани симптоми на асептичен менингит като скованост на врата, тежко главоболие, гадене, повръщане, повишена температура или замъглено съзнание. Предразположени са пациенти с автоимунни заболявания (системен лупус еритематозус, смесени колагенози).

Черен дроб

Рядко може да се очаква чернодробно увреждане (повишени серумни трансаминази, хепатит с или без иктерус, с фулминантно протичане при отделни случаи). Поради това стойностите на чернодробните параметри трябва да бъдат проследявани през регулярни интервали.

Нервна система

Рядко могат да се очакват нарушения в централната нервна система като сънливост, възбуда, главоболие, умора, раздразнителност, безсъние и вертиго. В отделни случаи са били съобщени нощни кошмари, страх, депресия, дезориентация, нарушения в паметта, спазми, шум в ушите и преходни слухови нарушения, нарушено виждане (замъглено или двойно виждане), нарушена чувствителност, промени във вкусовите усещания и тремор.

Бъбреци

В отделни случаи терапията може да доведе до остра хематурия, бъбречна инсуфициенция, протеинурия или бъбречно увреждане (интерстициален нефрит, нефротичен



синдром, папиларна некроза). Поради това бъбречната функция трябва да бъде проследявана при регулярни интервали.

Гастроинтестинален тракт

Често може да се очаква поява на гастроинтестинални оплаквания като диария, повръщане и гадене, както и слаба кръвозагуба от стомашно-чревния тракт, която по изключение може да предизвика анемия. Рядко могат да се наблюдават липса на апетит, коремни крампи, образуване на газове, нарушения в храносмилането, както и язва на стомаха или червата (възможно е да е свързана с кървене и руптура), рядко повръщане на кръв, кръв в изпражненията или кървава диария. Съществуват отделни съобщения за оплаквания в зоната на хипогастриума (напр. кървящи възпаления на дебелото черво, влошаване на болестта на Крон или колит, придружен с язви), възпаление на устната лигавица, езофагеални лезии, констипация и възпаление на езика.

Други нежелани лекарствени реакции

Рядко могат да възникнат едема (напр. периферна едема), особено при пациенти с високо кръвно налягане. Съобщени са били отделни случаи на палпитации, болка в гърдите и високо кръвно налягане.

4.9. Предозиране:

Симптоми на предозиране

Възможни са следните симптоми: нарушения на ЦНС (замъглено съзнание, хипервентилация, главоболие, вертиго, при деца също миоклонични крампи), гастроинтестинални оплаквания (болка в корема, кървене, повръщане, гадене), както и чернодробна и бъбречна дисфункция.

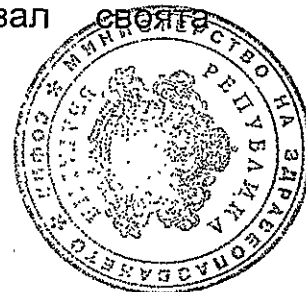
Терапевтични мерки при предозиране

Не съществува специфичен антидот.

5. Фармакологични данни:

5.1. Фармакодинамични свойства:

Diclofenac sodium е нестероиден
противовъзпалително/аналгетичен продукт, доказал своята



ефикасност при обичайни модели на възпаление при опити с животни чрез инхибиция на простагландиновата биосинтеза.

При хора Diclofenac sodium намалява болката, отока и понижава температурата при възпалителния процес.

Diclofenac инхибира АДФ-индуцираната агрегация на тромбоцитите.

5.2. Фармакокинетични свойства:

След перорално приложение на обичайните стомашно-резистентни фармацевтични форми активната съставка diclofenac се абсорбира изцяло от дисталната част на стомаха. Максималните плазмени нива се достигат след 1-16 часа в зависимост от продължителността на стомашния пасаж, средно след 2-3 часа.

Перорално приложеният diclofenac sodium показва значителен ефект на първо преминаване. Само 35-70% от абсорбираната активна съставка достигат постчернодробната циркулация в непроменена форма. Около 30% от активната съставка се метаболизира и екскретира чрез изпражненията. Около 70% се елиминират чрез бъбреците след чернодробно метаболизиране (хидроксилиране и конюгация) като фармакологично неактивни метаболити.

В по-голямата си част независим от чернодробната и бъбречна функция, елиминационният полу-живот е около 2 часа. Свързването с плазмените протеини е в 99%.

5.3. Предклинични данни за безопасност:

Остра токсичност

Проучвания на острата токсичност не са показали особена чувствителност при различни животински видове. За симптомите на интоксикация виж т.4.9. Предозиране.

Хронична токсичност

Хроничната токсичност е била изследвана при плъхове, кучета и маймуни. При токсични дози, различни при различните видове, при дози над 0,5 или 2,0 mg/kg телесно тегло са наблюдавани язви в гастроинтестиналния тракт и промени в броя на кръвните клетки.



Мутагенен и туморогенен потенциал

В резултат на *in vivo* и *in vitro* тестове се изключва мутагенна активност на diclofenac sodium. Проучвания на канцерогенността при плъхове и мишки не са показали туморогенни ефекти.

Репродуктивна токсичност

Ембриотоксичният потенциал на diclofenac sodium е бил изследван при три животински вида (плъх, мишка, заек). При токсични за майката дози са наблюдавани фетална смърт и забавен растеж. Не са били наблюдавани деформации. При употреба на diclofenac са били удължени гестационния период и продължителността на раждане. Не е регистрирано отрицателно влияние върху фертилността.

Дози под токсичните за майката не са оказали влияние върху постнаталното развитие на зародиша.

6. Фармацевтични данни:

6.1. Списък на помощните вещества и техните количества:

Lactose 1 H ₂ O	98,10 mg
Methylhydroxypropylcellulose	39,50 mg
Magnesium stearate	2,40 mg

6.2. Физико-химични несъвместимости:

Не са известни.

6.3. Срок на годност:

Срокът на годност на препарата е 3 години от датата на производство. Да не се прилага след изтичане на датата, означена върху опаковката.

6.4. Специални условия на съхранение:

Няма специални инструкции за съхранение.

6.5. Данни за опаковката:

Оригинална опаковка, съдържаща 20, 50 и 100 таблетки с изменено освобождаване.

6.6. Препоръки за употреба:

Няма специални инструкции за употреба.



7. Име и адрес на притежателя на разрешението за употреба:

Hexal AG

Industriestrasse 25

D-Holzkirchen, Germany

Tel.: 08024/908-0, Fax: 08024/908 290

8. Регистрационен номер в регистъра:

9. Дата на първо разрешаване за употреба на лекарствения продукт:

10. Дата на актуализация на текста:

Октомври, 2001

