

## **Состав**

*действующие вещества:* диклофенака натрия, лидокаина гидрохлорид;

1 ампула (2 мл) содержит диклофенака натрия 75 мг и лидокаина гидрохлорида 20 мг;

*вспомогательные вещества:* натрия эдетат, ацетилцистеин, пропиленгликоль, полиэтиленгликоль 400, натрия гидроксид, вода для инъекций.

## **Лекарственная форма**

Раствор для инъекций.

*Основные физико-химические свойства:* прозрачный, от практически бесцветного до слегка желтого цвета раствор.

## **Фармакотерапевтическая группа**

Нестероидные противовоспалительные средства.

Код АТХ М01А В55.

## **Фармакодинамика**

Препарат Олфен®-75 содержит натриевую соль диклофенака - нестероидные действующее вещество с выраженными противоревматическими, противовоспалительными, обезболивающими и жаропонижающее свойствами. Угнетение биосинтеза простагландинов считается основным механизмом его действия. Простагландины играют значительную роль в возникновении воспаления, боли и повышение температуры.

При ревматических заболеваниях противовоспалительные и обезболивающие свойства препарата обуславливают клиническую ответ, характеризуется выраженным исчезновением признаков и симптомов: боль в состоянии покоя, боль при движении, утренняя скованность и отек суставов, а также улучшение функциональных свойств суставов. При посттравматических / послеоперационных воспалениях диклофенак натрия вызывает быстрое уменьшение внезапной боли и боли при движениях, а также уменьшает отеки, вызванные воспалением и ранами.

При одновременном применении для лечения послеоперационной боли диклофенак натрия значительно снижает потребность в опиоидов. Олфен®-75 проявляет выраженный обезболивающий эффект при умеренных и тяжелых

болях неревматического происхождения через 15-30 минут после введения.

Препарат Олфен®-75 можно применять для начальной терапии воспалительных и дегенеративных ревматических заболеваний, а также для лечения боли, обусловленной неревматического воспалением.

### **Фармакокинетика**

*Абсорбция.* Средний объем распределения диклофенака натрия составляет 0,12-0,17 л / кг. Связывание препарата с белками плазмы крови происходит более чем на 99%.

После внутримышечного введения максимальная концентрация в плазме крови достигается через 10-20 мин. Терапевтическая концентрация Олфен®-75 в плазме крови составляет 0,7-2 мкг / мл. Повторное введение препарата не вызывает каких-либо изменений со стороны почек. При соблюдении рекомендуемых интервалов между приемами препарата не наблюдается его аккумуляции в организме.

*Распределение.* Олфен®-75 проникает в синовиальную жидкость, где максимальная концентрация определяется через 2-4 часа после того, как были получены значения максимальной концентрации. При этом период полувыведения из синовиальной жидкости составляет 3-6 часов. Благодаря этому даже через 4-6 часов после введения препарата концентрации действующего вещества в синовиальной жидкости выше, чем в плазме крови, и остаются на более высоких уровнях в течение 12 часов.

*Метаболизм.* Примерно половина всего количества введенной действующего вещества подвергается метаболизму первого прохождения. В результате равные площади под кривой «концентрация / время» (AUC) после перорального или ректального применения препарата примерно в два раза меньше AUC, которая наблюдается после парентерального введения эквивалентной дозы препарата. Метаболизм препарата происходит частично с помощью глюкуронирования и метоксилирования. Два с фенольных метаболитов, которые образовались при этом, являются фармакологически активными, но в меньшей степени, чем сам диклофенак натрия.

*Выведение.* Диклофенак натрия выводится из плазмы крови с уровнем системного клиренса  $263 \pm 56$  мл / мин (средний уровень  $\pm$  стандартное отклонение). Конечный период полувыведения составляет 1-2 часа. Примерно 60% введенной дозы выводится почками в виде метаболитов и менее 1% - в неизмененном виде. Часть введенной дозы осталась, выводится в метаболизированном виде с желчью, а затем с калом.

## Фармакокинетика у отдельных групп пациентов

Каких-либо значимых различий в абсорбции, метаболизме и элиминации препарата у разных пациентов не наблюдалось.

У пациентов с нарушениями функции почек после применения обычной дозы препарата не наблюдалось какого-либо увеличения количества неизмененной действующего вещества. Если клиренс креатинина был ниже 10 мл / мин, расчетный уровень метаболитов в плазме крови в равновесном состоянии был примерно в 4 раза выше, чем у здоровых пациентов. Несмотря на это, в конечном итоге метаболиты элиминировались с желчью.

В случаях нарушений функции печени (хронический гепатит, компенсированный цирроз печени) фармакокинетика и метаболизм препарата не отличаются от таковых у пациентов с нормальной функцией печени.

## **Показания**

Препарат назначать в виде внутримышечных инъекций при таких состояниях:

- воспалительные или дегенеративные формы ревматизма, ревматоидный артрит, анкилозирующий спондилит, остеоартрит, спондилоартрит, вертебральный болевой синдром, внесуставной ревматизм;
- острые приступы подагры;
- почечная и печеночная колики;
- боль, воспаление и отек после травм и хирургических вмешательств;
- тяжелые приступы мигрени.

## **Противопоказания**

- Повышенная чувствительность к действующим веществам или к другим компонентам препарата
- повышенная чувствительность к лидокаина или другим амидных местноанестезирующих средств;
- судорожные припадки в анамнезе, вызванные применением лидокаина;
- синдром Вольфа-Паркинсона-Уайта;

- порфирия;
- миастения;
- антикоагулянтная терапия;
- кровотечение или перфорация в области желудочно-кишечного тракта в анамнезе, связанная с предыдущим лечением нестероидными противовоспалительными препаратами (НПВП активная форма язвенной болезни / кровотечение или рецидивная язвенная болезнь / кровотечение в анамнезе (два или более отдельных эпизоды установленной язвы или кровотечения));
- как и другие НПВП, диклофенак также противопоказан пациентам, у которых применение ибупрофена, ацетилсалициловой кислоты или других НПВП провоцирует приступы;
- бронхиальной астмы, ангионевротический отек, крапивницу или острый ринит;
- воспалительные заболевания кишечника (например болезнь Крона или язвенный колит);
- печеночная недостаточность;
- почечная недостаточность;
- застойная сердечная недостаточность (NYHA II-IV);
- ишемическая болезнь сердца у пациентов, имеющих стенокардию, перенесенный инфаркт миокарда;
- цереброваскулярные заболевания у пациентов, перенесших инсульт или имеют эпизоды преходящих ишемических атак;
- заболевания периферических артерий;

- противопоказано для лечения периоперационной боли при коронарном шунтировании (или при использовании аппарата искусственного кровообращения);
- блокада II и III степени, синдром слабости синусового узла, синдром Адамса-Стокса, выраженная артериальная гипотензия, брадикардия, кардиогенный или гиповолемический шок, полная поперечная блокада сердца, высокий риск послеоперационного кровотечения, нарушений свертывания крови, неполного гемостаза, нарушений гемопоэза или цереброваскулярных кровотечений.

## **Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий**

Могут наблюдаться такие взаимодействия препарата Олфен®-75 и / или других препаратов диклофенака.

### *Литий, дигоксин*

При одновременном применении диклофенак может увеличивать концентрации лития и дигоксина в плазме крови. Рекомендуется контролировать уровень лития и дигоксина в сыворотке крови.

### *Диуретики и другие антигипертензивные препараты*

Как и другие НПВП, прием диклофенака натрия одновременно с другими диуретиками или антигипертензивными препаратами (например, бета-блокаторами, ингибиторами АПФ [АПФ]) может вызывать снижение антигипертензивного эффекта этих препаратов. Такие комбинации следует применять с осторожностью, артериальное давление у этих пациентов, особенно пожилого возраста, следует периодически контролировать. Пациентам необходимо принимать надлежащее количество жидкости и рекомендуется осуществлять контроль функции почек в начале сопутствующей терапии и периодически в дальнейшем, особенно в случае приема диуретиков и ингибиторов АПФ, учитывая возрастающий риск нефротоксичности.

### *Препараты, как известно, вызывают гиперкалиемию*

Сопутствующее лечение калийсберегающими диуретиками, циклоспорином, такролимусом или триметопримом может быть связано с увеличением уровня калия в сыворотке крови, поэтому мониторинг состояния пациентов следует проводить чаще.

Другие НПВП, включая селективные ингибиторы ЦОГ-2, и кортикостероиды. Одновременное назначение диклофенака и других системных НПВП или кортикостероидов может повысить риск желудочно-кишечного кровотечения или язвы. Следует избегать одновременного применения двух или более НПВП.

#### *Антикоагулянты и антитромботические препараты*

Рекомендуется с осторожностью принимать диклофенак натрия с антикоагулянтами и антитромбоцитарных препаратов, так как их комбинированное применение может повысить риск кровотечения.

Хотя доказательств влияния диклофенака на действие антикоагулянтов не обнаружено, поступали отдельные сообщения о риске геморрагических осложнений у пациентов, принимавших одновременно диклофенак и антикоагулянты. Поэтому рекомендуется тщательное наблюдение за пациентами, которые одновременно применяют диклофенак и антикоагулянты, и, в случае необходимости, коррекция дозы антикоагулянтов. Как и другие нестероидные противовоспалительные препараты, диклофенак в высоких дозах может обратимо угнетать агрегацию тромбоцитов.

#### *Селективные ингибиторы обратного захвата серотонина (СИОЗС)*

Одновременное применение системных НПВП и СИОЗС может увеличивать риск желудочно-кишечных кровотечений.

#### *Противодиабетические препараты*

Установлено, что диклофенак натрия можно назначать вместе с пероральными гипогликемическими препаратами, не влияя при этом на их клинические эффекты. Однако есть отдельные сообщения о гипогликемических и гипергликемических реакции после назначения диклофенака натрия, нуждающихся изменения доз гипогликемических препаратов. В связи с этим на фоне такой комбинированной терапии рекомендуется контролировать уровень сахара в крови.

#### *Метотрексат*

Диклофенак может подавлять клиренс метотрексата в почечных канальцах, что приводит к повышению уровня метотрексата. При введении НПВП, включая

диклофенак, менее чем за 24 часа до лечения метотрексатом рекомендуется быть осторожными, поскольку может расти концентрация метотрексата в крови и увеличиваться токсичность этого вещества. Были зарегистрированы случаи серьезной токсичности, когда метотрексат и НПВП, включая диклофенак, применяли с интервалом в пределах 24 часов. Это взаимодействие опосредовано через накопление метотрексата в результате нарушения почечной экскреции в присутствии НПВП.

**Циклоспорин.** Диклофенак, как и другие НПВП, может увеличивать нефротоксичность циклоспорина через влияние на простагландины почек. В связи с этим его следует применять в более низких дозах, чем для больных, циклоспорин не получают.

**Такролимус.** При применении НПВП с такролимусом возможно повышение риска нефротоксичности, что может быть опосредованно через почечные антипростагландин эффекты НПВП и ингибиторы кальциневрина.

#### Хинолоновые антибиотики

Существуют отдельные сообщения о развитии судорог, которые, возможно, были результатом одновременного применения хинолонов и НПВП. Это может наблюдаться у пациентов как с наличием, так и с отсутствием в анамнезе эпилепсии или судом. Таким образом, следует проявлять осторожность при рассмотрении вопроса о применении хинолонов пациентам, которые уже получают НПВП.

**Фенитоин.** При применении фенитоина одновременно с диклофенаком рекомендуется проводить мониторинг концентрации фенитоина в плазме крови в связи с ожидаемым увеличением экспозиции фенитоина.

**Колестипол и колестирамин.** Эти препараты могут вызвать задержку или уменьшения всасывания диклофенака. Таким образом, рекомендуется назначать диклофенак по крайней мере за 1 час до или через 4-6 ч после применения колестипола / колестирамина.

**Сердечные гликозиды.** Одновременное применение сердечных гликозидов и НПВП может усилить сердечную недостаточность, уменьшить скорость клубочковой фильтрации и повысить уровень гликозидов в плазме крови.

**Мифепристон.** НПВП не следует применять в течение 8-12 дней после применения мифепристона, поскольку НПВП могут уменьшить его эффект.

#### Мощные ингибиторы CYP2C9

Рекомендуется с осторожностью назначать диклофенак одновременно с ингибиторами CYP2C9 (такими как сульфинпиразон и вориконазол), поскольку это может привести к значительному увеличению максимальной концентрации в плазме крови и усилению действия диклофенака в связи с ингибированием его метаболизма.

### *Алкоголь*

Применение НПВП и одновременно употреблением алкоголя может усилить побочные эффекты действующего вещества, особенно со стороны пищеварительного тракта или центральной нервной системы.

Также могут наблюдаться такие взаимодействия, связанные с содержанием лидокаина гидрохлорида  $\beta$ -адреноблокаторы, пропранолол и другие, а также циметидин, пептидин, бупивакаин, хинидин, дизопирамид, амитриптилин, нортриптилин, хлорпромазин, имипрамин повышают уровень лидокаина в сыворотке крови, уменьшая его печеночный метаболизм.

При интоксикации сердечными гликозидами лидокаин может усугублять тяжесть АВ-блокады. Лидокаин ослабляет кардиотоническое эффект сердечных гликозидов.

При одновременном применении с антиаритмическими средствами (амиодароном, верапамилем, хинидином и другие) или ПСП (производными гидантоина) усиливается кардиодепрессивное действие.

При одновременном применении с седативными и снотворными средствами, средствами для наркоза (гексобарбитал, тиопентал натрия внутривенно) возможно усиление угнетающего действия на центральную нервную систему.

Фенитоин усиливает кардиодепрессивное действие лидокаина.

При одновременном применении с прокаинамидом возможны бред, галлюцинации.

Лидокаин может усиливать действие препаратов, обуславливающие блокаду нервно-мышечной передачи, поскольку последние уменьшают проводимость нервных импульсов.

Этанол усиливает угнетающее действие лидокаина на дыхание.

Норэпинефрин, мексилетин - усиливается токсичность лидокаина (снижается клиренс лидокаина).

Изадрин и глюкагон - повышается клиренс лидокаина.

Мидазолам умеренно повышает концентрацию лидокаина в крови.

Ингибиторы МАО, аминазин, бупивакаин, амитриптилин, нортриптилин, имипрамин - при комбинированном применении с лидокаином повышается риск развития артериальной гипотензии и пролонгируется местноанестезирующее действие последнего.

Наркотические анальгетики (например морфин) - при комбинированном применении с лидокаином усиливается анальгезирующий эффект наркотических анальгетиков, однако усиливается и угнетение дыхания.

Прениламин - повышается риск развития желудочковой аритмии типа «пируэт».

Пропафенон - возможно увеличение продолжительности и повышение тяжести побочных эффектов со стороны центральной нервной системы.

Рифампицин - возможно снижение концентрации лидокаина в крови.

Полимиксин В - следует контролировать функцию дыхания.

Прокаинамид - возможные галлюцинации.

Гликозиды наперстянки - на фоне интоксикации лидокаин может усугублять тяжесть

AV-блокады.

Вазоконстрикторы (эпинефрин, метоксамин, фенилэфрин) - при комбинированном применении с лидокаином способствуют замедлению всасывания лидокаина и пролонгируют действие последнего.

Гуанадрел, гуанетидин, мекамиламин, триметафан - при комбинированном применении для спинальной и эпидуральной анестезии повышается риск выраженной гипотензии и брадикардии.

Ацетазоламид, тиазидные и петлевые диуретики - при комбинированном применении с лидокаином, вызывающие гипокалиемию и уменьшают эффект последнего.

Антикоагулянты (в т. ч. ардепарин, далтепарин, данапароидом, эноксапарин, гепарин, варфарин и другие) - при комбинированном применении с лидокаином увеличивают риск развития кровотечений.

## **Особенности применения**

### Общие рекомендации

Побочные эффекты можно минимизировать путем применения минимальной эффективной дозы в течение наименьшего возможного срока, необходимого для контроля симптомов.

При лечении НПВП могут возникать язвы, кровотечения и перфорации желудочно-кишечного тракта, с или без предупредительных симптомов или серьезных желудочно-кишечных явлений в анамнезе.

Диклофенак натрия, как и другие НПВП, может увеличить риск возникновения серьезных сердечно-сосудистых тромботических явлений, инфаркта миокарда и инсульта.

При таких заболеваниях как клинически подтверждена ишемическая болезнь сердца, цереброваскулярная патология, облитерирующий атеросклероз периферических артерий или у пациентов, относящихся к группе риска (например, при наличии артериальной гипертензии, гиперлипидемии, сахарного диабета, при курении), диклофенак следует применять только после тщательного анализа возможных рисков и преимуществ такого лечения.

Поскольку Олфен®-75 содержит лидокаина гидрохлорид, перед применением необходимо провести кожную пробу на индивидуальную чувствительность. Введение лидокаина могут осуществлять только медицинские работники.

Следует соблюдать осторожность при назначении препарата пациентам пожилого возраста. В частности, для пациентов пожилого возраста со слабым здоровьем и для больных с низким показателем массы тела рекомендуется применять самые низкие эффективные дозы.

Как и другие лидокаин-содержащие лекарственные средства, препарат следует с осторожностью назначать больным эпилепсией, при нарушении проводимости сердца, при дыхательной недостаточности.

Следует избегать применения препарата Олфен®-75 с системными НПВП, включая селективные ингибиторы ЦОГ-2, из-за отсутствия какой-либо синергического пользы и возможности развития дополнительных побочных эффектов.

Как и в случае применения других НПВП, при применении диклофенака возможны аллергические реакции, включая анафилактические / анафилактоидные реакции.

Реакции гиперчувствительности могут также прогрессировать к синдрому Коунис, тяжелой аллергической реакции, которая может привести к инфаркту миокарда. Симптомами такой реакции является боль в груди, возникает в

сочетании с аллергической реакцией на диклофенак.

Очень редко в связи с применением НПВП могут наблюдаться серьезные кожные реакции, включая эксфолиативный дерматит, синдром Стивенса-Джонсона и токсический эпидермальный некролиз. Самый высокий риск возникновения данных реакций у пациентов существует в начале курса лечения, в большинстве случаев появление этих реакций происходит в пределах первого месяца лечения. При первых признаках появления сыпи на коже, поражениях слизистых оболочек или любых других проявлениях гиперчувствительности Олфен®-75 необходимо отменить.

Нестероидные противовоспалительные средства благодаря своим фармакодинамическим свойствам могут маскировать признаки и симптомы инфекции.

При длительном применении обезболивающих средств может возникать головная боль, которую нельзя лечить увеличением дозы этих препаратов.

#### *Влияние на пищеварительный тракт*

Сообщалось о кишечные кровотечения, язву или перфорацию, которая может привести к летальному исходу и которая может возникнуть в любой момент во время лечения, независимо от наличия или отсутствия предупредительных симптомов или серьезных проявлений в анамнезе со стороны желудочно-кишечного тракта, было это "связано со всеми НПВП, включая диклофенак. Диклофенак натрия следует назначать под контролем и с осторожностью пациентам с симптомами, указывающими на желудочно-кишечные заболевания, или с язвой желудка или кишечника, кровотечением, перфорацией желудочно-кишечного тракта в анамнезе. Риск желудочно-кишечных кровотечений выше при повышении доз НПВП у пациентов с язвой в анамнезе, особенно осложненной кровотечением или перфорацией, а также у лиц пожилого возраста. Если на фоне применения Олфен®-75 у пациентов развивается желудочно-кишечное кровотечение или язва желудочно-кишечного тракта, препарат необходимо отменить.

Чтобы уменьшить риск желудочно-кишечных нарушений у пациентов с язвой в анамнезе, особенно осложненной кровотечением или перфорацией, а также у лиц пожилого возраста, пациентов со слабым здоровьем или с малой массой тела, препарат необходимо назначать в минимальной эффективной дозе в течение как можно более короткого промежутка времени. Таким пациентам, а также пациентам, которые регулярно принимают низкие дозы ацетилсалициловой кислоты / аспирина или другие лекарственные средства, повышающие риск нежелательного воздействия на пищеварительный тракт,

целесообразно назначать комбинированную терапию со средствами, которые имеют защитное действие на слизистую оболочку желудка (например, ингибиторы протонной помпы или мизопростол).

У пациентов пожилого возраста лечение НПВП может иметь более серьезные последствия. Поэтому такие пациенты должны сообщать своему врачу о любых необычных симптомах со стороны желудочно-кишечного тракта (особенно кровотечения в пищеварительном тракте). Предостережение также нужно для больных, получающих сопутствующие препараты, которые могут повысить риск язвы или кровотечения, такие как системные кортикостероиды, антикоагулянты (например варфарин), антитромботические средства (например ацетилсалициловая кислота) или селективные ингибиторы обратного захвата серотонина.

При применении НПВП, включая диклофенак, риск утечки из желудочно-кишечного анастомоза, тщательное медицинское наблюдение и осторожность необходимы при применении диклофенака после оперативных вмешательств на желудочно-кишечном тракте.

#### *Влияние на печень*

Больным с нарушением функции печени при назначении диклофенака натрия необходим тщательный медицинский контроль, поскольку на фоне приема препарата могут усиливаться симптомы заболевания печени.

На фоне лечения НПВП может повышаться уровень одного или нескольких печеночных ферментов крови. Такие изменения редко сопровождаются клиническими симптомами. В большинстве таких случаев рост этих показателей остается в пределах предельных значений. Часто отмечалось умеренный рост этих показателей выше нормы (от  $\geq 3$  до  $<8 \times$  верхний предел нормы), в то время как частота значительного роста уровней этих ферментов ( $\geq 8 \times$  верхний предел нормы) составляла примерно 1%. В 0,5% пациентов, кроме повышения уровня печеночных ферментов, развились клинически манифестные поражения печени (эозинофилия, сыпь). После отмены препарата повышенный уровень этих показателей обычно возвращается к норме.

Если при приеме препарата функции печени сохраняются или ухудшаются, если возникают клинические признаки или симптомы заболеваний печени (например, гепатит) или другие проявления (например, эозинофилия, сыпь), диклофенак натрия нужно отменить.

Течение заболеваний, таких как гепатиты, может проходить без продромальных симптомов.

Необходимо с осторожностью применять Олфен®-75 пациентам с печеночной порфирией через вероятность провокации приступа.

### *Влияние на почки*

Поскольку при лечении НПВП, включая диклофенак, сообщалось о задержке жидкости и отек, особое внимание следует уделить больным с нарушением функции сердца или почек, артериальной гипертензией в анамнезе, больным пожилого возраста, больным, получающих терапию диуретиками или препаратами, которые существенно влияют на почечную функцию, и пациентам с существенным снижением внеклеточного объема жидкости с любой причине, например до или после серьезного хирургического вмешательства. В таких случаях в качестве меры предосторожности рекомендуется мониторинг функции почек. Прекращение терапии обычно приводит возвращение к состоянию, которое предшествовало лечению.

В общем частое и регулярное применение обезболивающих средств, особенно комбинации нескольких обезболивающих препаратов может привести к устойчивому поражению почек, сопровождающееся риском развития почечной недостаточности ( «анальгетическое нефропатия»).

### *Воздействие на кожу и подкожную клетчатку*

В редких случаях сообщалось о кожные реакции, иногда с летальным исходом, включая эксфолиативный дерматит, синдром Стивенса-Джонсона и токсический эпидермальный некролиз, связанные с приемом НПВП. Пациенты имеют высокий риск возникновения таких реакций в начале лечения: развитие реакции в большинстве случаев наблюдается в течение первого месяца лечения. В случае возникновения сыпи на коже, поражения слизистых оболочек или любого признака гиперчувствительности прием диклофенака следует прекратить.

### *Системная красная волчанка (СКВ) и смешанные заболевания соединительной ткани*

Пациенты с СКВ и смешанными заболеваниями соединительной ткани имеют повышенный риск асептического менингита.

### *Влияние на сердечно-сосудистую систему и на сосуды мозга*

Назначать диклофенак пациентам со значительными факторами риска кардиоваскулярных явлений (например, артериальная гипертония, гиперлипидемия, сахарный диабет, курение) можно только после тщательной клинической оценки. Поскольку кардиоваскулярные риски диклофенака могут расти с увеличением дозы и продолжительности лечения, его необходимо

применять как можно более короткий период и в самой эффективной дозе. Следует периодически просматривать потребности пациента в применении диклофенака для облегчения симптомов и ответ на терапию. С осторожностью применять пациентам в возрасте от 65 лет.

Для пациентов с наличием в анамнезе артериальной гипертензии и / или застойной сердечной недостаточности легкой или умеренной степени тяжести необходимо проведение соответствующего мониторинга и рекомендации, поскольку в связи с применением НПВП, включая диклофенак, были зарегистрированы случаи задержки жидкости и отеков.

Данные клинических исследований и эпидемиологические данные свидетельствуют, что применение диклофенака, особенно в высоких дозах (150 мг / сут) в течение длительного времени, может быть связано с незначительным увеличением риска развития артериальных тромботических событий (например инфаркта миокарда или инсульта).

Пациентам с неконтролируемой артериальной гипертензией, застойной сердечной недостаточностью, устойчивой ишемической болезнью сердца, заболеваниями периферических артерий и / или цереброваскулярной болезнью назначать диклофенак. Не рекомендуется при необходимости применение возможно только после тщательной оценки риск-пользы только в дозировке не более 100 мг в сутки. Подобную оценку следует провести перед началом долгосрочного лечения пациентов с факторами риска развития сердечно-сосудистых явлений (например артериальной гипертензией, гиперлипидемией, сахарным диабетом и курением).

Пациенты должны быть проинформированы о возможности возникновения серьезных случаев (боль в груди, одышка, слабость, нарушение речи), которое может произойти в любое время. В этом случае надо немедленно обратиться к врачу.

При наличии у пациента застойной сердечной недостаточности (NYHA II-IV) противопоказано применять препарат.

#### *Влияние на гематологические показатели*

Поскольку НПВП могут временно угнетать агрегацию тромбоцитов, при длительном применении диклофенака натрия, как и других НПВП, рекомендуется контролировать гематологические показатели. Пациенты с нарушениями гемостаза, геморрагическим диатезом или гематологическими отклонениями нуждаются пристального надзора.

#### *Астма в анамнезе*

У пациентов с бронхиальной астмой, сезонным аллергическим ринитом, отеком назальной слизистой оболочки (то есть полипами), хроническим обструктивным заболеванием легких или хроническими инфекциями респираторного тракта (особенно если они ассоциированы с симптомами, напоминающими аллергический ринит) чаще, чем у других пациентов, встречаются такие реакции на прием НПВП как обострение астмы (так называемая непереносимость анальгетиков, лейкотриенов астма, аспириновая астма), отек Квинке, крапивница. В связи с этим таким больным рекомендованы специальные меры (готовность к оказанию неотложной помощи). Это также касается больных с аллергией на другие вещества, проявляется кожными реакциями, зудом или крапивницей.

Как и другие препараты, подавляющие активность простагландинсинтетазы, диклофенак натрия и другие НПВП могут спровоцировать развитие бронхоспазма у пациентов, страдающих бронхиальной астмой или у пациентов с бронхиальной астмой в анамнезе.

### *Женская фертильность*

Олфен®-75 может влиять на женскую фертильность и поэтому не рекомендуется женщинам, планирующим беременность. Следует рассмотреть вопрос о прекращении применения препарата, которые не могут забеременеть, а также женщинам, которые проходят обследование относительно бесплодия.

### *Лидокаин*

Поскольку Олфен®-75 содержит лидокаин, следует учесть, что при обработке места инъекции дезинфицирующими растворами, содержащими тяжелые металлы, повышается риск развития местной реакции в виде болезненности и отека.

Поскольку лидокаин оказывает выраженное аритмогенное действие, следует с осторожностью применять препарат лицам с жалобами на аритмию в прошлом.

С осторожностью применять пациентам с сердечной недостаточностью умеренной степени, артериальной гипотонией умеренной степени, неполной АВ-блокадой, нарушением внутрижелудочковой проводимости, нарушениями функции печени и почек средней степени (клиренс креатинина 10 мл / мин), нарушением функции дыхания, эпилепсией, повышенной судорожной готовностью, тяжелой миастенией, после операций на сердце, при генетической предрасположенности к гипертермии, ослабленным больным и пациентам пожилого возраста; при осуществлении инъекции в воспаленную (инфицированную) участок.

При применении лидокаина обязательным является контроль ЭКГ. В случае нарушений деятельности синусового узла, удлинение интервала P-Q, расширение QRS или при развитии новой аритмии следует уменьшить дозу или отменить препарат.

Перед применением лидокаина при заболеваниях сердца (гипокалиемия снижает эффективность лидокаина) необходимо нормализовать уровень калия в крови.

### *Другое*

Это лекарственное средство содержит менее 1 ммоль (23 мг) / дозу натрия, то есть практически свободный от натрия.

Может вызвать симптомы, схожие с возникающими при употреблении алкоголя вследствие наличия в составе пропиленгликоля.

### **Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами**

Пациентам с нарушениями зрения, головокружением, сонливостью, вялостью, повышенной утомляемостью или другими нарушениями со стороны центральной нервной системы следует воздержаться от управления автомобилем или работы с механизмами.

### **Применение в период беременности или кормления грудью**

#### *Беременность*

Применение Олфен®-75, как и других препаратов, содержащих лидокаина гидрохлорид, противопоказано в период беременности.

#### *Кормление грудью*

В связи с проникновением НПВП в грудное молоко диклофенак натрия не следует назначать кормящим грудью. Если такое лечение крайне необходимо, следует прекратить кормление грудью.

#### *Женская фертильность*

Олфен®-75 может влиять на женскую фертильность и поэтому не рекомендуется женщинам, планирующим беременность. Следует рассмотреть вопрос о прекращении применения препарата, которые не могут забеременеть, а также женщинам, которые проходят обследование относительно бесплодия.

## **Способ применения и дозы**

Дозу подбирает врач индивидуально. Препарат следует применять в самых эффективных дозах в течение короткого периода времени, учитывая цель лечения для каждого пациента.

Перед применением препарата Олфен®-75 обязательно проведение кожной пробы на повышенную чувствительность к лидокаина гидрохлорида. Олфен®-75 применять в виде инъекций. В связи с возможным появлением анафилактических реакций, вплоть до развития шока, после введения препарата Олфен®-75 пациент должен находиться под наблюдением не менее 1 часа, при этом наготове должны быть средства, необходимые для оказания неотложной медицинской помощи.

Обычной разовой дозой препарата является содержимое 1 ампулы (т.е. 75 мг диклофенака натрия), который вводится внутримышечно 1 раз в сутки путем глубокой инъекции в верхний наружный квадрант ягодичной мышцы. Раствор должен быть использован сразу после открытия ампулы. Любое количество неиспользованного раствора нужно утилизировать.

При сильных болях (например, колики) препарат можно вводить 2 раза в сутки с интервалом в несколько часов, обязательно меняя при этом место инъекции. Сочетание парентерального введения препарата Олфен®-75 с другими лекарственными формами препаратов Олфен® (таблетки, капсулы, ректальные капсулы, гель или пластырь) допустимо при условии, что максимальная суточная доза диклофенака натрия не превышает 150 мг.

В условиях приступа мигрени клинический опыт ограничен случаями с начальным применением одной ампулы 75 мг, дозу вводить по возможности сразу же после применения суппозиторий по 100 мг в тот же день (в случае необходимости). Общая суточная доза не должна превышать 175 мг в первый день. Нет доступных данных по применению препарата Олфен®-75 для лечения приступов мигрени больше, чем 1 день.

Продолжительность парентерального применения Олфен®-75 не должен превышать 2 дней. Если это необходимо, лечение можно продолжить препаратами Олфен®-50 Лактаб, Олфен®-100 СР Депокапс, Олфен®-100 Ректокапс.

Олфен®-75 не применять для инъекции / инфузии.

*Пациенты пожилого возраста*

Корректировка дозы не требуется, но из-за возможного появления побочных реакций необходимо с особой тщательностью наблюдать за пациентами пожилого возраста.

#### *Пациенты с нарушением функции почек или печени*

У пациентов с нарушением функции почек или печени легкой и средней степени уменьшения дозы не требуется.

### **Дети**

Не предназначен для применения у детей.

### **Передозировка**

#### Диклофенак

*Симптомы.* Типичные клинические симптомы передозировки диклофенака натрия неизвестны. В случае передозировки может возникнуть головная боль, тошнота, рвота, боль в эпигастрии, желудочно-кишечные кровотечения, диарея, головокружение, дезориентация, возбуждение, кома, сонливость, звон в ушах, спутанность сознания, потеря сознания или судороги. В случае тяжелого отравления возможные острая почечная недостаточность и поражение печени. Передозировка может привести также к развитию артериальной гипотензии, угнетения дыхания и цианоза.

*Лечение.* В течение одного часа после применения потенциально токсичного количества препарата внутрь следует рассмотреть возможность применения активированного угля. Кроме того, у взрослых следует рассмотреть возможность промывания желудка в течение 1 часа после применения потенциально токсичного количества препарата. Поддерживающие меры и симптоматическое лечение для устранения таких осложнений как артериальная гипотензия, почечная недостаточность, судороги, раздражение слизистой оболочки желудочно-кишечного тракта и угнетение дыхания. Специфическая терапия, например форсированный диурез, диализ или гемоперфузия, не имеют особого значения при выводе НПВП, учитывая высокий уровень связывания этих препаратов с белками плазмы и экстенсивный метаболизм. При частых или длительных судорогах необходимо внутривенно ввести диазепам. С учетом клинического состояния пациента могут быть показаны другие мероприятия. Лечение симптоматическое.

#### Лидокаин

*Симптомы:* онемение языка и губ, возбужденное состояние, эйфория, тревожность, нечеткость зрения, тремор, депрессия, сонливость, головокружение, спутанность сознания, угнетение дыхания или остановка дыхания, брадикардия, нарушение проводимости сердца, поперечная блокада сердца, коматозное состояние, головокружение, общая слабость, снижение артериального давления до развития шока, тремор, тонико-клонические судороги, кома, коллапс, возможна блокада. Первые симптомы передозировки у здоровых людей возникают при концентрации лидокаина в крови более 0,006 мг / кг, судороги - при 0,01 мг / кг.

*Лечение:* прекращение введения препарата, оксигенотерапия, противосудорожные средства, вазоконстрикторы (норадреналин, мезатон), при брадикардии - холинолитики (0,5-1 мг атропина). Возможно проведение интубации, искусственной вентиляции легких, реанимационных мероприятий. Диализ не эффективен.

## **Побочные реакции**

В случае возникновения побочных эффектов необходимо обратиться к врачу.

Перечень возможных побочных эффектов приводится учитывая информацию о возможной действии активных веществ, входящих в состав препарата.

*Инфекции и инвазии:* абсцессы в месте инъекции.

*Со стороны крови и лимфатической системы:* тромбоцитопения, лейкопения, анемия (в том числе гемолитическая и апластическая), агранулоцитоз.

*Со стороны иммунной системы:* реакции гиперчувствительности (анафилактические и анафилактоидные реакции, в том числе артериальная гипотензия и шок), ангионевротический отек (в том числе отек лица), ощущение жара, холода или онемения конечностей.

*Со стороны психики:* дезориентация, депрессия, бессонница, ночные кошмары, раздражительность, неугомонность, психические расстройства.

*Со стороны нервной системы:* головная боль, головокружение, нарушение сна, сонливость, парестезии, нарушения памяти, судороги, беспокойство, тремор, асептический менингит, нарушение вкуса, инсульт, нарушение чувствительности, повышенная утомляемость, спутанность сознания, потеря сознания вплоть до комы, галлюцинации, мышечные подергивания, моторный блок, дизартрия, дисфагия, нистагм.

*Со стороны органа зрения:* нарушение зрения, нечеткость зрения, диплопия, неврит зрительного нерва, мелькание «мушек», светобоязнь, конъюнктивит.

*Со стороны органов слуха и вестибулярного аппарата:* вертиго, шум в ушах, нарушение слуха, гиперacusия.

*Со стороны сердечно-сосудистой системы:* тахикардия, боль в груди, инфаркт миокарда, сердечная недостаточность, артериальная гипертензия, артериальная гипотензия, васкулит, аритмия, брадикардия, замедление проводимости сердца, поперечная блокада сердца, остановка сердечной деятельности, коллапс, тахикардия, приливы, синдром Коунис.

*Со стороны органов дыхания:* астма (в том числе одышка), бронхоспазм, пневмонит, угнетение или остановка дыхания, ринит.

*Со стороны желудочно-кишечного тракта:* боль в животе, тошнота, рвота, диарея, спазмы, диспепсия, метеоризм, гастрит, рвота с кровью, желудочно-кишечные кровотечения, геморрагическая диарея, мелена, язвы желудка и кишечника, в том числе с кровотечением или с перфорацией (иногда с летальным исходом, особенно у пациентов пожилого возраста), колит (в том числе геморрагический колит и обострение язвенного колита или болезни Крона), запор, стоматит (в том числе язвенный стоматит), глоссит, поражения пищевода, диафрагмоподобные кишечные стриктуры, панкреатит.

*Гепатобилиарной системы:* повышенный уровень трансаминаз, гепатит, желтуха, дисфункция печени, молниеносный гепатит, некроз печени, печеночная недостаточность.

*Со стороны кожи и подкожной клетчатки:* сыпь, крапивница, буллезная сыпь, экзема, эритема, мультиформная эритема, синдром Стивенса-Джонсона, синдром Лайелла (токсический эпидермальный некролиз), эксфолиативный дерматит, алопеция, фотосенсибилизация, пурпура, аллергическая пурпура, зуд.

*Со стороны почек и мочевыводящих путей:* задержка жидкости в организме, отеки, острая почечная недостаточность, гематурия, протеинурия, интерстициальный нефрит, нефротический синдром, почечный папиллярный некроз.

*Со стороны репродуктивной системы:* импотенция.

*Общие нарушения и реакции в месте введения:* общее недомогание, злокачественная гипертермия, слабость, реакции в месте инъекции, например боль, ощущение легкого жжения или уплотнение тканей, отек, некроз в месте инъекции, абсцесс в месте др ' инъекции.

Сообщалось о повышенном риске тромботических осложнений (например, инфаркт миокарда или инсульт), связанный с применением диклофенака, в частности в высоких терапевтических дозах (150 мг в сутки) и длительное время.

### **Срок годности**

5 лет.

Срок хранения после вскрытия ампулы - содержимое ампулы нужно использовать сразу же после ее раскрытия; все неиспользованные остатки раствора должны быть утилизированы.

### **Условия хранения**

Хранить при температуре не выше 25 ° C в коробке для защиты от света и недоступном для детей месте.

*Несовместимы.* Препарат Олфен®-75 нельзя смешивать с другими растворами для инъекций.

### **Упаковка**

По 2 мл в ампуле, по 5 ампул в коробке.

### **Категория отпуска**

По рецепту.

### **Производитель**

Меркле ГмбХ.

### **Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности**

Людвиг-Меркле-Штрассе 3, 89143 Блаубойрен, Германия.

### **Источник инструкции**

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).