

ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА
Декскетопрофен Органика

МИНЗДРАВ РОССИИ
000288-040620
СОГЛАСОВАНО

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Декскетопрофен Органика

Международное непатентованное наименование: декскетопрофен

Лекарственная форма: раствор для внутривенного и внутримышечного введения

Состав: 1 мл раствора содержит *действующее вещество*: декскетопрофена трометамол - 36,9 мг (в пересчете на декскетопрофен - 25,0 мг), *вспомогательные вещества*: этанол (этиловый спирт) 96 % - 100,0 мг, натрия хлорид - 4,0 мг, 1 М раствор натрия гидроксида - до pH 7,4, вода для инъекций - до 1 мл.

Описание: прозрачная бесцветная жидкость.

Фармакотерапевтическая группа: нестероидный противовоспалительный препарат (НПВП).

Код АТХ: M01AE17

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Декскетопрофен - действующее вещество препарата Декскетопрофен Органика, относится к нестероидным противовоспалительным препаратам (НПВП), оказывающее анальгезирующее, противовоспалительное и жаропонижающее действие. Механизм действия декскетопрофена связан с ингибированием синтеза простагландинов на уровне циклооксигеназ первого и второго типа (ЦОГ-1 и ЦОГ-2).

Анальгезирующее действие развивается через 30 мин после парентерального введения. Продолжительность терапевтического действия составляет 4-8 ч после введения 50 мг декскетопрофена.

При комбинированной терапии с анальгетиками опиоидного ряда декскетопрофен значительно (до 30-45 %) снижает потребность в опиоидах.

Фармакокинетика

Всасывание

Максимальная концентрация в сыворотке (C_{max}) после внутримышечного введения декскетопрофена достигается в среднем через 20 мин (10-45 мин). Площадь под кривой "концентрация-время" (AUC) после однократного введения в дозе 25-50 мг пропорциональна дозе, как при внутримышечном, так и при внутривенном введении.

Соответствующие фармакокинетические параметры сходны после однократного и повторного внутримышечного или внутривенного введения, что указывает на отсутствие кумуляции препарата.

Распределение

Для декскетопрофена характерен высокий уровень связывания с белками плазмы (99 %). Среднее значение объема распределения (V_d) составляет менее 0,25 л/кг, время полураспределения составляет около 0,35 ч.

Выведение

Метаболизм декскетопрофена главным образом происходит путем конъюгации его с глюкуроновой кислотой с последующим выделением почками. Период полувыведения ($T_{1/2}$) декскетопрофена составляет около 1-2,7 ч. У лиц пожилого возраста наблюдается удлинение периода полувыведения (как после однократного, так и после повторного внутримышечного или внутривенного введения) в среднем до 48 % и снижение общего клиренса препарата.

Показания к применению

- Купирование болевого синдрома различного генеза (в т.ч. послеоперационные боли, боль при метастазах в кости, посттравматические боли, боль при почечных коликах, альгодисменорея, ишиалгия, радикулит, невралгии, зубная боль);
- симптоматическое лечение острых и хронических воспалительных, воспалительно-дегенеративных и метаболических заболеваний опорно-двигательного аппарата (в т.ч. ревматоидный артрит, остеоартроз, остеохондроз, спондилоартриты: анкилозирующий спондилит, реактивный артрит, псориатический артрит).

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

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к декскетопрофену или другим НПВП или к любому из вспомогательных веществ, входящих в состав препарата (см. *Состав*);
- воспалительные заболевания кишечника (болезнь Крона, язвенный колит) в стадии обострения;
- эрозивно-язвенные поражения желудочно-кишечного тракта и двенадцатиперстной кишки (в том числе вызванные приемом НПВП);
- желудочно-кишечные кровотечения в анамнезе, другие активные кровотечения (в том числе подозрение на внутричерепное кровотечение) и склонность к ним;
- одновременный прием антикоагулянтов;
- гемофилия и другие нарушения свертывания крови;

- хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации;
- полное и неполное сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза носа и околоносовых пазух и непереносимости ацетилсалициловой кислоты (АСК) или других НПВП (в том числе и в анамнезе);
- период после проведения аортокоронарного шунтирования;
- нарушение функции почек тяжелой степени (клиренс креатинина <30 мл/мин);
- прогрессирующие заболевания почек;
- тяжелые нарушения функции печени (10-15 баллов по шкале Чайлд-Пью) или активное заболевание печени;
- подтвержденная гиперкалиемия;
- беременность и период грудного вскармливания;
- возраст до 18 лет (в связи с отсутствием данных по эффективности и безопасности)

Декскетопрофен Органика противопоказан для неврраксиального (эпидурального или подоболочечного, внутриволочечного) введения из-за входящего в состав препарата этанола.

С осторожностью

Язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, язвенный колит, болезнь Крона, заболевания печени в анамнезе, печеночная порфирия, хроническая почечная недостаточность (клиренс креатинина 30-60 мл/мин), хроническая сердечная недостаточность, артериальная гипертензия, значительное снижение объема циркулирующей крови (в том числе после хирургического вмешательства), пожилые пациенты (в том числе получающие диуретики, ослабленные пациенты и с низкой массой тела), бронхиальная астма, одновременный прием глюкокортикостероидов (в т. ч. преднизолона), антикоагулянтов (в т. ч. варфарина), антиагрегантов (в т. ч. ацетилсалициловой кислоты, клопидогрела), селективных ингибиторов обратного захвата серотонина (в т. ч. циталопрама, флуоксетина, пароксетина, сертралина), ишемическая болезнь сердца, цереброваскулярные заболевания, дислипидемия/гиперлипидемия, сахарный диабет, заболевания периферических артерий, курение, наличие инфекции *Helicobacter pylori*, системные заболевания соединительной ткани, длительное использование нестероидных противовоспалительных препаратов, туберкулез, выраженный остеопороз, алкоголизм, тяжелые соматические заболевания.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Беременность

Применение препарата Декскетопрофен Органика при беременности противопоказано.

Период грудного вскармливания

Нет данных о выделении декскетопрофена в грудное молоко. Препарат Декскетопрофен Органика не рекомендуется применять во время кормления грудью.

Способ применения и дозы

Препарат Декскетопрофен Органика предназначен для внутривенного и внутримышечного введения. Рекомендуемая доза для взрослых: 50 мг каждые 8-12 ч. При необходимости возможно повторное введение препарата с 6-часовым интервалом. Максимальная суточная доза составляет 150 мг.

Нарушение функции печени.

У пациентов с легким и умеренным нарушением функции печени (5 – 9 баллов по шкале Чайлд-Пью) суммарную суточную дозу препарата Декскетопрофен Органика следует снизить до 50 мг и проводить частый контроль функциональных показателей печени. Препарат не следует назначать больным с тяжелым поражением печени.

Нарушение функции почек.

У пациентов с легким нарушением функции почек (клиренс креатинина 30-60 мл/мин) суточную дозу снижают до 50 мг. Препарат Декскетопрофен Органика не следует назначать больным с умеренно выраженной или тяжелой почечной недостаточностью.

Пациенты пожилого возраста.

Корректировка дозы для пациентов пожилого возраста не требуется, однако в связи с физиологическим снижением функции почек дозировку препарата Декскетопрофена Органика рекомендуется снизить. Общая суточная доза составляет 50 мг при легких нарушениях функции почек у пациентов пожилого возраста.

Препарат Декскетопрофен Органика предназначен для краткосрочного (не более 2-х дней) применения в период острого болевого синдрома. В дальнейшем возможен перевод пациента на анальгетики для приема внутрь.

Внутримышечное введение

Содержимое одной ампулы (2 мл) препарата Декскетопрофен Органика медленно вводят глубоко внутримышечно.

Внутривенное введение

При необходимости, содержимое одной ампулы (2 мл) препарата Декскетопрофен Органика можно ввести путем медленной внутривенной инъекции продолжительностью не менее 15 сек.

Внутривенная инфузия

Содержимое одной ампулы (2 мл) препарата Декскетопрофен Органика разводят в 30-100 мл 0,9 % раствора натрия хлорида, раствора декстрозы (глюкозы) или раствора Рингера (лактата). Раствор следует готовить в асептических условиях и всегда защищать

от воздействия дневного света. Разбавленный раствор (должен быть прозрачным) вводят путем медленной внутривенной инфузии продолжительностью 10-30 мин.

Побочное действие

Ниже представленные побочные эффекты сгруппированы в соответствии с классами систем органов согласно MedDRA.

Частота развития побочных эффектов приведена в соответствии с классификацией ВОЗ: очень часто ($\geq 10\%$), часто ($\geq 1\%$ до $< 10\%$), нечасто ($\geq 0,1\%$ до $< 1\%$) редко ($\geq 0,01\%$ до $< 0,1\%$), очень редко ($< 0,01\%$), частота неизвестна (не может быть подсчитана на основе имеющихся данных).

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы

Нечасто: анемия.

Очень редко: нейтропения, тромбоцитопения.

Нарушения со стороны иммунной системы

Редко: отек гортани.

Очень редко: анафилактические реакции, в том числе анафилактический шок.

Нарушения метаболизма и питания

Редко: гипергликемия, гипогликемия, гипертриглицеридемия.

Нарушения со стороны нервной системы

Нечасто: головная боль, головокружение, бессонница, сонливость.

Редко: парестезия.

Нарушения со стороны органа зрения

Нечасто: нечеткость зрения.

Нарушения со стороны органа слуха и лабиринта

Редко: шум в ушах.

Нарушения со стороны сердца

Редко: экстрасистолия, тахикардия.

Нарушения со стороны сосудов

Нечасто: артериальная гипотензия, гиперемия кожных покровов, чувство жара.

Редко: артериальная гипертензия, периферический отек, поверхностный тромбофлебит.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения

Редко: брадикардия.

Очень редко: бронхоспазм, диспноэ.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта

Часто: тошнота, рвота.

Нечасто: боль в животе, диспепсия, диарея, запор, гематемезис, сухость во рту.

Редко: эрозивно-язвенные поражения органов ЖКТ, включая кровотечения и перфорации, анорексия.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей

Редко: повышение активности печеночных ферментов, желтуха.

Очень редко: поражение поджелудочной железы, поражение печени.

Нарушение со стороны кожи и подкожных тканей

Нечасто: дерматит, зуд, сыпь, повышенное потоотделение.

Редко: крапивница, угревая сыпь.

Очень редко: тяжелые кожные реакции (синдром Стивенса-Джонсона и токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла)), фотосенсибилизация.

Нарушения со стороны скелетно-мышечной и соединительной ткани

Редко: ригидность мышц, затруднение движений в суставах, мышечные спазмы, боли в спине.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей

Редко: острая почечная недостаточность, полиурия, почечная колика, кетонурия, протеинурия.

Очень редко: нефрит или нефротический синдром.

Нарушения со стороны репродуктивных органов и молочных желез

Редко: у женщин - нарушение менструального цикла, у мужчин - нарушение функции предстательной железы.

Общие нарушения и реакции в месте введения

Часто: боль в месте инъекции, реакции на месте инъекции.

Нечасто: воспалительная реакция, гематома, геморрагии в месте инъекции, озноб, чувство жара, утомление.

Редко: боль в спине, обморок, лихорадка.

Очень редко: анафилактический шок, отек лица.

Лабораторные и инструментальные данные

Редко: кетонурия, протеинурия.

Прочие

Асептический менингит, возникающий преимущественно у пациентов с системной красной волчанкой или смешанными заболеваниями соединительной ткани, гематологические нарушения (пурпура, апластическая и гемолитическая анемии, редко – агранулоцитоз и гипоплазия костного мозга).

Передозировка

Симптомы: тошнота, анорексия, абдоминальная боль, головная боль, головокружение, дезориентация, бессонница.

Лечение: симптоматическая терапия; при необходимости: промывание желудка, гемодиализ.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Общие виды взаимодействия, характерные для всех НПВП, включая декскетопрофен.

Препарат Декскетопрофен Органика нельзя смешивать в одном шприце с раствором допамина, прометазина, пентазоцина, петидина или гидроксизина (образуется осадок).

Препарат Декскетопрофен Органика можно смешивать в одном шприце с раствором гепарина, лидокаина, морфина и теofilлина.

Препарат Декскетопрофен Органика - приготовленный раствор для инфузии нельзя смешивать с прометазинном или пентазоцином.

Препарат Декскетопрофен Органика - приготовленный раствор для инфузии совместим со следующими растворами для инъекций: допамина, гепарина, гидроксизина, лидокаина, морфина, петидина и теofilлина.

Нежелательные комбинации

С другими НПВП, включая салицилаты в высоких дозах (более 3 г/сут) в том числе ЦОГ-2: одновременное применение нескольких НПВП вследствие синергического эффекта повышает риск возникновения желудочно-кишечных кровотечений и язв.

С пероральными антикоагулянтами, гепарином в дозах, превышающих профилактические, и тиклопидином: повышение риска возникновения кровотечений в связи с ингибированием агрегации тромбоцитов и поражением слизистой оболочки желудочно-кишечного тракта.

С препаратами лития: НПВП повышают концентрацию лития в крови (снижение почечной экскреции лития), вплоть до токсичного уровня, в связи с чем данный показатель необходимо контролировать при назначении, изменении дозы и после отмены препарата Декскетопрофена Органика.

С метотрексатом в высоких дозах (15 мг/нед и более): повышение гематологической токсичности метотрексата в связи со снижением его почечного клиренса на фоне терапии НПВП.

С глюкокортикостероидами: повышается риск развития язвы и желудочно-кишечного кровотечения.

С гидантоинами и сульфаниламидными препаратами: риск увеличения токсического действия этих препаратов.

Комбинации, требующие осторожности

С диуретиками, ингибиторами ангиотензинпревращающего фермента, антагонистами рецепторов ангиотензина II, антибактериальными препаратами (аминогликозиды): терапия НПВП связана с риском развития острой почечной недостаточности у обезвоженных пациентов (снижение гломерулярной фильтрации, обусловленное сниженным синтезом простагландинов). НПВП могут уменьшать антигипертензивный эффект некоторых препаратов. При одновременном назначении с диуретиками необходимо убедиться в том, что водно-электролитный баланс пациента адекватен, и провести контроль функции почек перед назначением НПВП.

С метотрексатом в низких дозах (менее 15 мг/нед): повышение гематологической токсичности метотрексата в связи со снижением его почечного клиренса на фоне терапии НПВП. Необходимо проводить еженедельный подсчет клеток крови в первые недели одновременной терапии. При наличии нарушения функции почек даже в легкой степени, а также у лиц пожилого возраста необходимо тщательное медицинское наблюдение.

С пентоксифиллином: повышение риска развития кровотечений. Необходим частый клинический мониторинг и частый контроль времени кровотечения или времени свертывания крови.

С зидовудином: риск повышения токсического действия на эритроциты, обусловленного воздействием на ретикулоциты, с развитием тяжелой анемии через неделю после назначения НПВП. Необходимо провести подсчет всех клеток крови и ретикулоцитов через 1-2 недели после начала терапии НПВП.

С гипогликемическими препаратами для приема внутрь: НПВП могут усиливать гипогликемическое действие этих препаратов вследствие вытеснения их из мест связывания с белками плазмы крови.

С препаратами низкомолекулярного гепарина: повышение риска развития кровотечений.

Комбинации, которые необходимо принимать во внимание

С β -адреноблокаторами: НПВП могут уменьшать антигипертензивный эффект β -адреноблокаторов, что обусловлено ингибированием синтеза простагландинов.

С циклоспорином и такролимусом: НПВП могут увеличивать нефротоксичность, что опосредовано действием почечных простагландинов. Во время проведения одновременной терапии необходимо контролировать функцию почек.

С тромболитиками: повышенный риск развития кровотечений.

С пробенецидом: концентрации НПВП в плазме могут повышаться, что может быть обусловлено ингибирующим эффектом на почечную канальцевую секрецию и/или конъюгацию с глюкуроновой кислотой, что требует коррекции дозы декскетопрофена.

С сердечными гликозидами: НПВП могут приводить к повышению концентрации гликозидов в плазме крови.

С мифепристоном: в связи с возможным риском изменения эффективности мифепристона под влиянием ингибиторов синтеза простагландинов, НПВП не следует назначать ранее, чем через 8-12 дней после отмены мифепристона.

С антибиотиками хинолонового ряда: высокий риск развития судорог при назначении НПВП в комбинации с высокими дозами хинолонов.

Особые указания

У лиц с симптомами желудочно-кишечных нарушений или с заболеваниями ЖКТ в анамнезе требуется наблюдение врача, особенно при желудочно-кишечных кровотечениях. В случаях развития желудочно-кишечного кровотечения у пациентов, принимающих декскетопрофен, препарат немедленно отменяют.

Следует с осторожностью назначать декскетопрофен пациентам, одновременно принимающим средства, которые могут увеличить риск возникновения язвы или кровотечения: кортикостероиды, антикоагулянты (например, варфарин), селективные ингибиторы обратного захвата серотонина или антиагреганты (в том числе, ацетилсалициловая кислота).

Декскетопрофен может вызывать обратимое угнетение агрегации тромбоцитов и увеличивать время кровотечения.

Декскетопрофен следует с осторожностью назначать пациентам с аллергией в анамнезе. Декскетопрофен следует с осторожностью назначать пациентам с хронической сердечной недостаточностью I – II функционального класса по NYHA.

Декскетопрофен может обусловить повышение уровня креатинина и азота в плазме крови, оказывать негативное действие на мочевыделительную систему, приводя к развитию гломерулонефрита, интерстициального нефрита, папиллярного некроза, нефротического синдрома и острой почечной недостаточности.

Как и при применении других НПВП, возможно незначительное преходящее повышение показателей некоторых печеночных проб, значительное повышение активности аспаратаминотрансферазы (АСТ) и аланинаминотрансферазы (АЛТ) в сыворотке крови. При этом контроль функций печени и почек необходим у пациентов пожилого возраста. В случае значительного повышения соответствующих показателей препарат Декскетопрофен Органика следует отменить.

Препарат Декскетопрофен Органика следует с осторожностью назначать пациентам с нарушением кроветворения, пациентам с системной красной волчанкой или другими заболеваниями соединительной ткани.

Как и другие НПВП, декскетопрофен может маскировать симптомы инфекционных заболеваний. Сообщалось о единичных случаях обострения инфекционных процессов, локализованных в мягких тканях при применении НПВП. Поэтому требуется врачебное наблюдение пациентов с признаками бактериальной инфекции или ухудшение состояния во время лечения декскетопрофеном.

Следует соблюдать осторожность при назначении препарата пациентам с нарушением функции печени, почек, сердца или с состояниями, которые могут обусловить задержку жидкости в организме. У этих пациентов применение НПВП может привести к ухудшению состояния и задержке жидкости в организме. Необходимо соблюдать осторожность также при назначении декскетопрофена пациентам, применяющим диуретики или предрасположенным к гиповолемии, поскольку у них повышается риск развития нефротоксичности.

Осторожность необходима при назначении препарата лицам пожилого возраста, поскольку у них чаще выявляют нарушения функции почек печени или сердечно-сосудистой системы, а также возникновение нежелательных реакций, например, желудочно-кишечные кровотечения или перфорация кишечника.

В каждой ампуле препарата содержится 200 мг этанола.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и работе с механизмами в связи с возможным головокружением и сонливостью в период приема препарата Декскетопрофен Органика.

Форма выпуска

Раствор для внутривенного и внутримышечного введения 25 мг/мл. По 2 мл препарата в ампулы светозащитного стекла 1-го гидролитического класса.

По 5 ампул в контурной ячейковой упаковке. 1 или 2 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения

В защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года.

Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

**Наименование, адрес производителя лекарственного препарата и адрес места
производства/ Организация, принимающая претензии потребителей**

АО «Органика», Россия, 654034, Кемеровская область, г. Новокузнецк, шоссе Кузнецкое,
д. 3, тел. (3843) 994-222, факс 994-200. www.organica-nk.ru.

Технический директор
АО «Органика»



Ф.В. Гусс