

ДИКОРТАН

Инструкция по медицинскому применению лекарственного средства

Торговое название: Дикортан.

Международное непатентованное название: Бетаметазон + Диклофенак + Витамин В12.

Лекарственная форма: раствор для инъекций.

Состав: каждая ампула содержит:

Бетаметазон (в виде бетаметазона натрия фосфата) 2 мг;

Диклофенак натрия 75 мг;

Гидрококсобаламин (в виде гидрококсобаламина сульфата) 10 мг.

Вспомогательные вещества: бензиловый спирт, пропиленгликоль, бисульфит натрия, вода для инъекций до 3 мл.

Фармакотерапевтическая группа: Нестероидные противовоспалительные средства, Диклофенак, комбинации.

Код АТХ: M01AB55.

Фармакологическое действие:

Фармакодинамика:

Бетаметазон ГКС, тормозит высвобождение интерлейкина1; интерлейкина2, интерферона гамма из лимфоцитов и макрофагов. Оказывает противовоспалительное, противоаллергическое, десенсибилизирующее, противошоковое, антитоксическое и иммунодепрессивное действие. Подавляет высвобождение гипофизом АКГТ и бета-липотропина, но не снижает уровень циркулирующего бета-эндорфина. Угнетает секрецию ТТГ и ФСГ. Повышает возбудимость ЦНС, снижает количество лимфоцитов и эозинофилов, увеличивает - эритроцитов (стимулирует выработку эритропоэтина). Взаимодействует со специфическими цитоплазматическими рецепторами и образует комплекс, проникающий в ядро клетки, и стимулирует синтез мРНК; последняя индуцирует образование белков, в т.ч. липокортина, опосредующих клеточные эффекты. Липокортин угнетает фосфолипазу А2, подавляет высвобождение арахидоновой кислоты и подавляет синтез эндоперексидов, ПГ, лейкотриенов, способствующих процессам воспаления, аллергии и др.

Диклофенак нестероидное противовоспалительное, анальгетическое, противоревматическое средство. Механизм действия обусловлен угнетением биосинтеза простагландинов путем обратной блокировки циклооксигеназы, уменьшением образования кининов и других медиаторов воспаления и боли, стабилизирующим влиянием на лизосомальные мембраны. При ревматических заболеваниях уменьшает отек, гиперемию и боль в состоянии покоя и при движении, утреннюю скованность и припухлость суставов, способствует увеличению объема движений пораженных суставов. В посттравматическом и послеоперационном периодах эффективно уменьшает боль (как в состоянии покоя, так и во время физической активности), припухлость и отеки.

Витамин В12 длительного действия (гидрококсобаламин) участвует в клеточном делении, нормализуя деление эритроцитов по нормобластическому пути. Предупреждает гемолиз эритроцитов при пернициозной анемии. Обеспечивает миелинизацию нервных волокон. Препятствует жировому перерождению клеток и тканей паренхиматозных органов. Повышает фагоцитарную активность лейкоцитов и активизируя деятельность ретикулоэндотелиальной системы, гидрококсобаламин усиливает иммунитет.

Фармакокинетика:

Бетаметазона натрия фосфат хорошо растворим и после в/м введения быстро подвергается гидролизу и практически сразу абсорбируется из места введения, что обеспечивает быстрое начало терапевтического действия. Практически полностью выводится в течение одного дня после введения.

Связывание бетаматезона с белками плазмы составляет 62.5%. Метаболизируется в печени с образованием в основном неактивных метаболитов. Выводится преимущественно почками.

Диклофенак после внутримышечного введения 75 мг максимальная концентрация достигается приблизительно через 15-30 мин и составляет в среднем 2,7 мкг/мл. Поглощенное количество находится в линейной пропорции к величине дозы. Выше 99 % диклофенака связывается с белками крови. Диклофенак хорошо распределяется в тканях и жидкостях организма. В синовиальной жидкости высокие концентрации достигаются и поддерживаются на протяжении 3-6 часов. Биотрансформируется в печени путем гидроксилирования и глюкуронизации при участии ферментной системы цитохрома Р450 СYP2С9. Фармакологическая активность метаболитов ниже, чем у диклофенака. Период полувыведения из плазмы крови составляет приблизительно 2 часа. Экскреция происходит преимущественно почками (приблизительно 60 % введенной дозы), главным образом, в виде метаболитов, в неизменном состоянии – 1 %. Остальное выделяется кишечником в виде метаболитов. При соблюдении рекомендуемого режима дозирования накопление препарата не происходит.

Гидрококсобаламин в крови связывается с белками крови и транспортируется в ткани. Накапливается в печени, с желчью поступает в кишечник и снова всасывается, выделяясь с мочой, желчью и в неизменном виде. Обнаруживается также в почках, сердце, селезенке и мозге. Процесс энтерогепатической циркуляции препарата нарушается при заболеваниях кишечника, особенно при заражении широким лентецом, который является активным потребителем витамина.

Гидрококсобаламин метаболизируется в организме, превращаясь в кофактор кобаламина, который входит в состав ферментов (редуктаз), восстанавливающих фолиевую кислоту до тетрагидрофолиевой, активирующей деление клеток. Кобаламид необходим для образования дезоксирибозы, ДНК и нуклеотидов. Восстанавливающие ферменты сохраняют активность сульфгидрильных групп в белках и ферментах, например, в козиме А и глутатионе. Названные механизмы активируют процессы нормобластного кроветворения и регенерации тканей, предупреждают гемолиз эритроцитов, нормализуют обмен веществ.

Показания к применению:

Ревматизм (обострение ревматизма), ревматоидный артрит, цервикальная брахиалгия, люмбашиалгия, синдром Рейтера, анкилозирующий спондилоартрит, острый тендовагинит.

Противопоказания:

- повышенная чувствительность к компонентам препарата или другим НПВП;
- кровотечение или перфорация желудочно-кишечного тракта в анамнезе, связанная с предыдущим лечением нестероидными противовоспалительными средствами (НПВС);
- активная форма язвенной болезни/кровотечения или рецидивирующая язвенная болезнь/кровотечение в анамнезе (два или более отдельных эпизодов установленной язвы или кровотечения);
- тяжелая почечная и печеночная недостаточность;
- декомпенсированная сердечная недостаточность;
- тяжелая форма гипертонической болезни;
- системный микоз;
- активный туберкулез;
- остеопороз
- синдром Ищенко-Кушинга;
- сахарный диабет
- гепатит А, В и гепатит НЕ А, не в и другие вирусные инфекции;
- иммунодефицитные состояния (в т.ч. СПИД или ВИЧ-инфекция);
- период вакцинации;
- период беременности и кормления грудью
- внутримышечное введение пациентам с идиопатической тромбоцитопенической пурпурой;
- подагра;
- лечение системными коагулянтами;
- детский возраст;
- застойная сердечная недостаточность (NYHA II–IV);
- ишемическая болезнь сердца у пациентов, имеющих стенокардию, перенесших инфаркт миокарда;
- цереброваскулярные заболевания у пациентов, которые перенесли инсульт или имеют эпизоды транзиторных ишемических атак;
- заболевания периферических артерий.
- Лечение периоперационной боли при аорто-коронарном шунтировании (или использование аппарата искусственного кровообращения).

Период беременности и лактации:

Препарат Дикортан противопоказан женщинам в период беременности и кормления грудью.

Способ применения и дозы:

Взрослым, внутримышечно.

Доза препарата Дикортан обычно составляет 1 ампулу в сутки, которую вводят путем глубокой инъекции в верхний внешний сектор большой ягодичной мышцы. В тяжелых случаях суточную дозу можно увеличить до двух инъекций, между которыми соблюдают интервал в несколько часов (по одной инъекции в каждую ягодицу).

Препарат Дикортан, раствор для инъекций не применять более 2 дней.

Препарат следует применять в самых эффективных дозах в течение короткого периода времени, учитывая задачи лечения у каждого отдельного пациента.

Побочное действие:

Со стороны желудочно-кишечного тракта: тошнота, рвота, анорексия, метеоризм, запоры, диарея, острые медикаментозные эрозии и язвы ЖКТ, желудочно-кишечные кровотечения.

Со стороны нервной системы: судороги, повышение внутричерепного давления с отеком диска зрительного нерва (обычно после завершения лечения), головокружение, головная боль, сонливость, раздражительность.

Со стороны печени: иногда - повышение трансаминаз или редко - гепатиты с / без желтухи.

Со стороны кожного покрова: иногда - эритема и высыпания на коже, дерматит, высыпания, ангионевротический отек. Редко - крапивница. Описаны отдельные случаи синдрома Стивенса-Джонсона, эксудативная полиморфная эритема и токсический эпидермолиз. Ухудшение заживления ран, истончение кожи, петехии и экхимозы, эритема лица. При введении - жжение, образование инфильтрата.

Со стороны почек: отдельные случаи острой почечной недостаточности, гематурии и протеинурии, олигурия, интерстициальный нефрит, папиллярный некроз, азотемия.

Со стороны кровеносной системы: отдельные случаи лейкопении, гемолитической анемии и агранулоцитоза.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: артериальная гипертензия, застойная сердечная недостаточность и учащенное сердцебиение.

Со стороны водно-электролитного баланса: задержка натрия, эдема, повышенное выделение калия и гипокалиемический алкалоз.

Со стороны скелетно-мышечной системы: мышечная слабость, миопатия, потеря мышечной массы, остеопороз, переломы позвоночника в результате компрессии, асептический некроз головки бедренной кости и / или патологические переломы длинных костей, разрывы сухожилий, нестабильность суставов (после многократных введений).

Со стороны эндокринной системы: нарушения менструального цикла, адrenaловая недостаточность, особенно при возникновении стрессовой ситуации (после травм, хирургических вмешательств, системных заболеваний). Снижена толерантность к углеводам.

Психоневрологические расстройства: эйфория, изменение настроения, депрессия (с выраженными психотическими реакциями), повышенная раздражительность, бессонница.

Со стороны органов чувств: задняя субкапсулярная катаракта, повышение внутриглазного давления, глаукома, экзофтальм и звон в ушах.

Расстройства метаболизма: отрицательный азотный баланс вследствие катаболизма белка.

Другие: бронхоспазм, системные анафилактические реакции.

Данные клинических исследований и эпидемиологические данные свидетельствуют о повышенном риске тромботических осложнений (например, инфаркта миокарда или инсульта), связанный с применением диклофенака в частности в высоких терапевтических дозах (150 мг в сутки) и при длительном применении.

Передозировка:

Симптомы: типичная клиническая картина при передозировке препарата отсутствует. Передозировка может вызвать такие симптомы как рвота, кишечные кровотечения, диарею, головокружение, звон в ушах или судороги. В случае тяжелого отравления возможна острая почечная недостаточность и поражение печени.

Лечение: лечение острого отравления НПВП состоит в первую очередь из поддерживающих мер и симптоматического лечения.

Форсированный диурез, диализ или гемоперфузия, не могут гарантировать вывода нестероидных противовоспалительных средств вследствие их высокого связывания с белками плазмы крови и интенсивным метаболизмом.

Симптомы передозировки бетаметазона:

Острая передозировка бетаметазона не создает ситуации, представляющей угрозу для жизни. Введение в течение нескольких дней высоких доз ГКС не влечет к нежелательным последствиям (за исключением случаев применения очень высоких доз или в случае применения при сахарном диабете, глаукоме, обострении эрозивно-язвенных поражений ЖКТ или у больных, одновременно проходят терапию препаратами наперстянки, диуретики, что выводит калий).

Лечение: нужен тщательный медицинский контроль над состоянием больного. Необходимо поддерживать оптимальное потребление жидкости и контролировать содержание электролитов в плазме и моче, уделяя при этом особое внимание балансу в организме натрия и калия. При обнаружении дисбаланса этих ионов необходимо проводить соответствующую терапию.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном назначении препарата Дикортан с другими системными НПВП увеличивается частота возникновения побочных эффектов. Рекомендуемый строгий контроль коагуляции у пациентов, которые лечатся пероральными антикоагулянтами, поскольку кортикостероиды и диклофенак повышают риск геморрагии.

Дикортан может ингибировать фармакологическое действие диуретиков. Он также может приводить к повышению уровня калия в сыворотке крови при назначении с калий диуретиками.

При назначении препарата Дикортан за 24 часа до и после приема метотрексата может повышаться уровень последнего в крови и его токсичность.

При одновременном приеме препарата Дикортан и препаратов лития может повышаться уровень последнего без видимых признаков передозировки.

Поскольку Дикортан содержит стероидный гормон (бетаметазон) в своем составе, следует принять во внимание следующее:

При одновременном приеме препарата с эритромицином, астемизолом, бепридиллом, галофантрином, пентамидином, терфенадином, сультопридом, витамином, амидароном, бретилиумом, дислопирамидом, гунидином, солатололом возникает риск развития двунаправленной веретенообразной желудочковой тахикардии (гипокалиемия, брадикардия и удлинение QT-интервала повышают риск развития аритмии).

Сочетания, требующие осторожности при применении:

Изониазид при одновременном применении с ГКС уровень изониазида в плазме крови снижается, поэтому нужен клинический и микробиологический контроль.

Фенобарбитал, фенитоин, примидон, карбамазепин, рифабурин, рифампицин является ферментативными индукторами, которые снижают эффективность кортикостероидов. Поэтому рекомендуется откорректировать дозу препарата в течение и после лечения этими медикаментами.

Ацетилсалициловая кислота: кортикостероиды ускоряют элиминацию салицилатов, поэтому после перерыва в лечении кортикостероидами существует риск передозировки салицилатов. Рекомендуется коррекция дозы салицилатов при прекращении лечения кортикостероидами.

Взаимодействия, которые необходимо принять во внимание:

Антигипертензивные препараты: кортикостероиды уменьшают терапевтические эффекты гипотензивных препаратов.

α-интерферон: кортикостероиды могут ингибировать его терапевтическое действие.

Вакцины с ослабленными микроорганизмами существует риск развития системных заболеваний, которые могут привести к летальному исходу. Риск увеличивается преимущественно у пациентов с иммунодепрессивными состояниями.

Несовместимость: препарат не следует смешивать в одном шприце с другими лекарственными средствами.

Особые указания:

Перед началом курса лечения следует тщательно обследовать пациента с целью исключения язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки. Для снижения риска развития побочных реакций необходимо, по возможности, назначать препарат в минимальных дозах, особенно для ослабленных пациентов и людей пожилого возраста.

Бетаметазон может маскировать признаки инфекций. Во время лечения препаратом Дикортан пациентам не следует проводить иммунизацию в связи с возможным изменением иммунного ответа. Препарат не следует применять пациентам с подозрением на инфекции, вызванные Strongyloides, поскольку можно спровоцировать распространение инфекции и вызвать состояние, представляющее угрозу для жизни. Пациентам большим латентным туберкулезом или с повышенной реактивностью к туберкулину необходимо находиться под наблюдением врача, поскольку болезнь может прогрессировать.

Дикортан содержит диклофенак, поэтому его следует назначать с осторожностью пациентам с расстройствами сердечно-сосудистой системы, почек и печени, пациентам, которым проводилось хирургическое вмешательство или пациентам, у которых уменьшен внутрисосудистый объем. Диклофенак может вызвать случаи обострения болезни у пациентов с печеночной порфирией и с бронхиальной астмой.

Назначать Дикортан, содержащий диклофенак, пациентам со значительными факторами риска кардиоваскулярных явлений (таких как 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 в более короткий период и в самой эффективной дозе.

Дикортан следует назначать с осторожностью пациентам с гемостатическими расстройствами, диверкулитом, со свежим анастомозом кишечника, язвой желудка, язвенным колитом, абсцессом или другими гнойными инфекциями, гипертонической болезнью, остеопорозом и мажестерной травме. С осторожностью следует назначать препарат при офтальмогерпесе, эмоциональной нестабильности или психотической склонности и гипотиреозидизме.

С осторожностью применять пациентам старше 65 лет.

Во время терапии не следует употреблять спиртные напитки.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с другими механизмами:

Следует воздерживаться от управления автотранспортом и работы с механизмами в период лечения.

Форма выпуска:

6 ампул раствора для инъекций по 3 мл, вместе с инструкцией по применению в картонной упаковке.

Условия хранения:

Хранить в сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25°С и в местах, недоступных для детей.

Срок годности:

3 года. Не употреблять после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска:

По рецепту врача.



Произведено для:
BELINDA Laboratories
Лондон, Великобритания
Производитель:
ООО «Биополус»
Грузия