

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВОТА	
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1	
Към Рег. №	20060381
Разрешение №	19510 / 18. 09. 2012
Одобрение №	/

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

VOLTFAST® 50 mg powder for oral solution / ВОЛТФАСТ 50 mg прах за перорален разтвор

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Лекарственото вещество е калий [o-[(2,6-дихлорофенил)-амино]-фенил]-ацетат (= диклофенак калий (diclofenac potassium)). Едно саше Voltfast съдържа 50 mg диклофенак калий. За пълния списък на помощните вещества вижте точка 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Прах за перорален разтвор.
Бял до леко жълт хомогенен прах.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

Краткосрочно лечение на следните остри състояния:

- Постоперативна болка, възпаление и оток, например след стоматологична или ортопедична хирургична интервенция.
- Посттравматична болка, възпаление и оток, например при навяхване.
- Болезнени и/или възпалителни гинекологични състояния, например първична дисменорея или аднексит.
- Мигренозни пристъпи.
- Болезнени синдроми на гръбначния стълб.
- Извънставен ревматизъм.
- Като допълнение при лечението на болезнени инфекции на ухото, носа или гърлото, напр. тонзилофарингит, отит. Съгласно общите терапевтични принципи, за общо заболяване трябва да се прилага съответното подходящо лечение. Сама по себе си повишената температура не е терапевтично показание.

4.2 Дозировка и начин на приложение

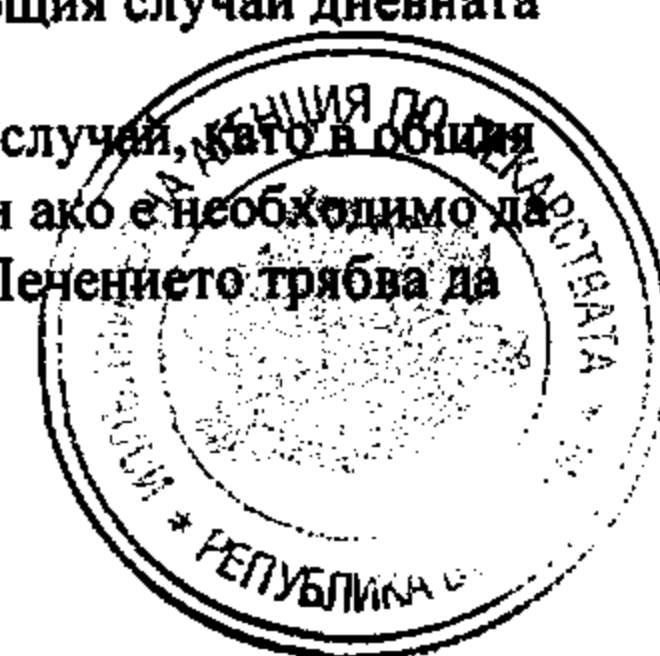
Дозировка

Препоръчително е дозата да бъде съобразена с индивидуалния случай и да е възможно най-ниската, за възможно най-краткия период от време.

Възрастни

Препоръчителната начална дозировка е 2-3 сашета Voltfast (100 до 150 mg) дневно. При по-леките случаи 1-2 сашета Voltfast (50 до 100 mg) дневно обикновено са достатъчни. В общия случай дневната доза трябва да се раздели на до 3 отделни приема.

При първична дисменорея дневната доза трябва да се съобрази с индивидуалния случай, като в общия случай е 50 до 150 mg. Първоначално трябва да се назначи доза от 50 до 100 mg и ако е необходимо да се увеличи до максимум 200 mg дневно в хода на няколко менструални цикъла. Лечението трябва да



започне при появата на първите симптоми и в зависимост от симптоматиката да продължи няколко дни.

При мигрена началната доза от 50 mg се препоръчва да се приеме при първите признаци на предстоящ пристъп. В случаи, когато облекчаването на болката в рамките на първите 2 часа след приема на първата доза не е достатъчно, може да се приеме още една доза от 50 mg. При необходимост може да се приемат допълнително дози от по 50 mg на интервали от 4 до 6 часа, като не се превишава общата доза от 200 mg дневно.

Специални групи пациенти

Педиатрична популация

Voltfast 50 mg прах за перорален разтвор не се препоръчва за употреба при деца и подрастващи до 14-годишна възраст. За лечение на деца и подрастващи до 14-годишна възраст се предлагат капки за перорална употреба и супозитории diclofenac 12.5 mg и 25 mg.

За подрастващи над 14 години, 50 до 100 mg дневно, разделени на 1 до 2 дози, обикновено са достатъчни.

Не трябва да се превишава максималната дневна доза от 150 mg.

Употребата на Voltfast 50 mg прах за перорален разтвор при мигренозни пристъпи при деца и подрастващи не е проучено.

Пациенти в напреднала възраст (на 65 и повече години)

Не се налага промяна в началната дозировка при пациенти в напреднала възраст (вж. т. 4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба).

Бъбречно увреждане

Не се налага промяна в началната дозировка при пациенти с бъбречно увреждане (вж. т. 4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба).

Чернодробно увреждане

Не се налага промяна в началната дозировка при пациенти с чернодробно увреждане (вж. т. 4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба).

Начин на приложение

Съдържанието на сашето трябва да се разтвори в чаша натурална (негазирана) вода чрез разбъркване. Разтворът може да е леко опалесциращ, но това не влияе на ефикасността на лекарствения продукт. Разтворът трябва да се приема за предпочитане преди хранене.

4.3 Противопоказания

- Анамнеза за свръхчувствителност към лекарственото вещество или към някое от помощните вещества
- Активно кървяща или перфорирана стомашна или интестинална язва (вж. т. 4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба и т.4.8 Нежелани лекарствени реакции).
- Употреба по време на третия триместър на бременността (вж. точка 4.6 Фертилитет, бременност и кърмене)
- Тежка чернодробна, бъбречна или сърдечна недостатъчност (вж. точка 4.4 Специални противопоказания и специални предупреждения при употреба)
- Подобно на други нестероидни противовъзпалителни средства (НСПВС), Voltfast също е противопоказан при пациенти, при които пристъпите на астма, уртикария и остър ринит предизвикват след прием на ацетилсалицилова киселина или други НСПВС (вж. т. 4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба).



Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба и т. 4.8 Нежелани лекарствени реакции)..

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Гастро-интестинални ефекти

При всички НСПВС, включително и при диклофенак, са съобщавани случаи на кървене от стомашно-чревния тракт, язви или перфорация, които могат да бъдат фатални и могат да настъпят на всеки етап от лечението, със или без предупредителни симптоми или данни за анамнеза за сериозни стомашно-чревни инциденти. Последствията са по-тежки при пациенти в напреднала възраст. Ако при пациенти, лекувани с Voltfast настъпи кървене от стомашно-чревния тракт или се образува язва, приема на лекарството трябва да се преустанови.

Както и при останалите НСПВС, включително диклофенак, се налага строг медицински контрол, и трябва да се обръща специално внимание, когато се предписва Voltfast на пациенти с гастроинтестинални нарушения (ГН) или с анамнестични данни, предполагащи стомашна или интестинална улцерация, кървене или перфорация (вж. точка 4.8 Нежелани лекарствени реакции). При пациенти увеличаващи дозата НСПВС, или такива с анамнеза за язва, особено при наличие на хеморагии или перфорация, както и при хора в напреднала възраст рискът от гастроинтестинално кървене се увеличава. При пациенти в напреднала възраст има по-голям риск от по-честа поява на нежелани реакции при лечение с НСПВС, особено на кървене от стомашно-чревния тракт или перфорация, които могат да бъдат фатални.

Лечението трябва да започне и да се поддържа с най-малката ефективна доза, за да се намали риска от гастроинтестинална токсичност при пациенти с анамнеза за язва с хеморагии или перфорация, както и при пациенти в напреднала възраст.

За тези пациенти трябва да се има в предвид комбинирана терапия с предпазващи ЛВ (напр. мизопропростол или инхибитори на протонната помпа) а също и за пациенти имащи едновременна нужда от лекарства съдържащи ниски дози от ацетилсалицилична киселина (ASA)/аспирин или други лекарства за които е възможно да увеличат гастроинтестиналния риск.

Пациенти с анамнеза за гастроинтестинално отравяне, особено при хора в напреднала възраст, трябва да съобщят за появата на необичайни коремни симптоми (особено гастроинтестинално кървене). При пациенти получаващи едновременно лекарства, които могат да увеличат риска от улцерация или кървене, като системни кортикостероиди, антикоагуланти, анти-тромбоцитни или селективни серотонин-реџптейк инхибитори (вж. точка 4.5. Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие)

Необходим е строг медицински контрол при пациенти с улцерозен колит или болест на Crohn, тъй като състоянието им може да екзацербира (вж. точка 4.8. Нежелани лекарствени реакции).

Съпътстваща астма

При пациенти с астма, сезонни алергични ринити, оток на носната лигавица (т.е. носни полипи), хронични обструктивни белодробни заболявания или хронични инфекции на дихателните пътища (особено, ако са свързани със симптоми подобни на алергичен ринит), реакциите спрямо НСПВС като екзацербация на астмата (т. нар. непоносимост към аналгетици/ аналгетична астма), едем на Квинке или уртикария, са по-чести в сравнение с други пациенти. Поради това при тези пациенти са необходими специални предпазни мерки (готовност за спешна помощ). Това се отнася също така и за пациенти, алергични към други субстанции, напр. с кожни реакции, сърбеж или уртикария.

Кожни реакции



Тежки кожни реакции, някои от които фатални, включващи ексфолиативен дерматит, синдром на Стивънс-Джонсън, токсична епидермална некролиза са съобщавани много рядко във връзка с прима на НСПВС, в това число и Voltfast, (вж. 4.8. Нежелани лекарствени реакции). Изглежда, че пациентите са с най-висок риск от настъпване на тези реакции рано в хода на лечението, тъй като в повечето случаи началото на реакцията настъпва в първия месец. Приемът на Voltfast трябва да се преустанови при първите прояви на кожен обрив, лигавични лезии или каквито и да било други прояви на свръхчувствителност.

Както и при останалите НСПВС, в редки случаи могат да се проявят алергични реакции с диклофенак, включително анафилактични/ анафилактоидни реакции, без предходна експозиция на лекарството.

Чернодробни ефекти

Необходим е строг медицински контрол, когато се предписва Voltfast на пациенти с увредена бъбречна функция, тъй като състоянието им може да се екзацерира.

Както при другите НСПВС, включително диклофенак, нивата на един или повече чернодробни ензими може да се повишат по време на лечението с Voltfast. Като предпазна мярка се препоръчва редовно наблюдение на чернодробната функция, при продължително лечение с Voltfast. При абнормно или персистиращо влошаване на чернодробната функция или ако се развият клинични признаци или симптоми на чернодробно заболяване (напр. еозинофилия, обрив), употребата на Voltfast трябва да се преустанови. Хепатит може да настъпи при употребата на диклофенак и без продромални симптоми.

Повишено внимание е необходимо при пациенти с чернодробна порфирия, поради възможността Voltfast да отключи пристъп на заболяването.

Бъбречни ефекти

Тъй като са докладвани случаи на задържане на течности и едем по време на лечение с НСПВС, включително диклофенак, е необходимо особено внимание при пациенти с увредена сърдечна или бъбречна функция, с анамнеза за хипертония, пациенти в напреднала възраст, пациенти приемащи едновременно лечение с диуретици или лекарства, които сериозно могат да засегнат бъбречната функция, както и при пациентите със съществено изчерпване на екстрацелуларния обем, независимо от причината, напр. пери-/постоперативни фази на сериозна хирургична интервенция (вж. 4.3. Противопоказания). В тези случаи се препоръчва проследяване на бъбречната функция, като предпазна мярка при употреба на Voltfast. Спирането на терапията обикновено се последва от възстановяване на предишното състояние.

Сърдечно-съдови ефекти

Лечението с НСПВС, включително диклофенак, особено във високи дози и при продължително лечение, може да бъде свързано с леко повишен риск от сериозни сърдечно-съдови тромботични събития (включително инфаркт на миокарда и инсулт). За да се сведе до минимум потенциалния риск от нежелани сърдечно-съдови събития при пациенти, приемащи НСПВС, особено при тези със сърдечно-съдови рискови фактори, трябва да се използва най-ниската ефективна доза за възможно най-кратък срок.

Необходимо е да се осигурят подходящо наблюдение и съвет за пациенти с анамнеза за хипертония и/или лека до умерена конгестивна сърдечна недостатъчност, тъй като има съобщения за отоци и задръжка на течности, свързани с лечението с НСПВС.

Клинични проучвания и епидемиологични данни показват, че употребата на диклофенак, особено във висока доза (150 mg дневно) и при продължително приложение може да бъде свързана с леко повишен риск от артериални тромботични събития (например миокарден инфаркт или инсулт) (вижте т. 4.4).



Пациенти с неконтролирана хипертония, конгестивна сърдечна недостатъчност, установена исхемична болест на сърцето, заболяване на периферните артерии и/или мозъчно-съдова болест трябва да се лекуват с диклофенак само след внимателно обмисляне. Такова обмисляне трябва да се прави преди започване на дългосрочно лечение на пациенти с рискови фактори за сърдечно-съдови събития (напр. хипертония, хиперлипидемия, захарен диабет, тютюнопушене).

Хематологични ефекти

Употребата на Voltfast се препоръчва само за краткосрочна употреба. Все пак, ако се прилага за по-продължително време, е препоръчително (както при останалите НСПВС) редовно да се следи броя кръвни клетки.

Както останалите НСПВС, Voltfast може временно да инхибира агрегацията на тромбоцитите. Пациентите с хемостатични нарушения трябва да бъдат внимателно наблюдавани.

Пациенти в напреднала възраст

При пациентите в напреднала възраст е необходимо внимание поради основни медицински съображения. По-специално, препоръчва се при чувствителни пациенти в напреднала възраст или при пациенти с ниско телесно тегло да се прилага най-ниската ефективна доза.

Взаимодействие с други НСПВС

Едновременната употреба на Voltfast с НСПВС, включително селективни инхибитори на циклооксигеназа-2 трябва да се избягва, поради възможната поява на допълнителни нежелани ефекти (вж т. 4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие).

Специални помощни вещества

Voltfast съдържа източник на фенилаланин и поради тази причина може да е опасен при пациенти, страдащи от фенилкетонурия.

Маскиране признаците на инфекции

Подобно на останалите НСПВС, поради фармакодинамичните си свойства Voltfast може да маскира признаците и симптомите на инфекции.

4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Изброените по-долу взаимодействия включват взаимодействия, наблюдавани с Voltfast прах за перорален разтвор и/или други фармацевтични форми на диклофенак

Наблюдавани взаимодействия, които трябва да се вземат под внимание

Мощни CYP2C9 инхибитори: Препоръчва се повишено внимание при едновременната употреба на диклофенак и мощни CYP2C9 инхибитори (като вориконазол), което може да доведе до значително увеличение на пиковите плазмени концентрации и експозицията на диклофенак поради инхибиране на неговия метаболизъм.

Литий: ако се използва едновременно, диклофенак може да повиши плазмените концентрации на лития. Препоръчва се проследяване на серумните нива на лития.

Дигоксин: ако се използва едновременно, диклофенак може да повиши плазмените концентрации на дигоксина. Препоръчва се проследяване на серумните нива на дигоксина.

Диуретици и антихипертензивни лекарства: Както останалите НСПВС, едновременната употреба на диклофенак с диуретици или антихипертензивни лекарства (напр. бета блокери, ангиотензин



конвертиращ ензим (АСЕ) инхибитори) може да намали антихипертензивният им ефект. Поради това тази комбинация трябва да бъде приемана с особено внимание и на пациенти, най-вече тези в напреднала възраст, трябва периодично да им се измерва кръвното налягане. Поради повишения риск от нефротоксичност (вж. точка 4.4. Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба) пациентите трябва да бъдат добре хидратирани, и да им бъде проследявана бъбречната функция при започване на комбинирано лечение с диуретици и АСЕ инхибитори, както и периодично след това.

Циклоспорин: Както останалите НСПВС, диклофенак може да повиши нефротоксичността на циклоспорин поради ефекта на бъбречните простагландини. Поради тази причина той трябва да се приема на по-ниски дози отколкото при пациенти, които не приемат циклоспорин.

Лекарства, причиняващи хиперкалиемия: Едновременното приложение с калий-съхраняващи диуретици, циклоспорин, такролимус или триметоприм може да бъде свързано с повишени серумни нива на калий, които следва да се проследяват често (вж т. 4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки за при употреба).

Хинолонови антибактериални лекарствени продукти: Съобщени са изолирани случаи на гърчове, които може да са били предизвикани от едновременното приложение на хинолони и НСПВС.

Очаквани взаимодействия, които трябва да се вземат под внимание

Други НСПВС и кортикостероиди: Успоредната употреба на диклофенак с други системни НСПВС или кортикостероиди може да повиши честотата на гастринтестиналните нежелани лекарствени реакции (вж. точка 4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба).

Антикоагуланти и анти-тромбоцитни лекарства: Необходимо е повишено внимание при едновременната им употреба тъй като може да се повиши риска от кървене (вж. точка 4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба). Въпреки, че клиничните проучвания не сочат, че диклофенак повлиява действието на антикоагулантите, има епизодични съобщения за повишен риск от хеморагии при пациенти, приемащи едновременно диклофенак и антикоагуланти. Поради това се препоръчва непосредствено наблюдение на подобни пациенти.

Селективни инхибитори на обратното захващане на серотонина (SSRIs): Едновременния прием на системни НСПВС, включително диклофенак, и SSRIs може да увеличи риска от гастроинтестинално кървене (вж. точка 4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба).

Антидиабетни лекарствени продукти: Клинични проучвания показват, че диклофенак може да се приема едновременно с перорални антидиабетни лекарства без това да повлиява техния клиничен ефект. Все пак, има изолирани съобщения за хипогликемични и хипергликемични ефекти по време на лечението с диклофенак, при които е необходимо коригиране на дозировката на антидиабетните лекарствени продукти. Поради тази причина, като предпазна мярка се препоръчва наблюдение на нивата на кръвната глюкоза по време на комбинираното лечение.

Фенитоин: Препоръчва се мониториране плазмената концентрация на фенитоин при едновременната му употреба с диклофенак, поради очаквано увеличение на екпозицията на фенитоин.

Methotrexate: Диклофенак може да инхибира тубуларния бъбречен клирънс на метотрексат, като така повишава нивата на метотрексат. Необходимо е внимание, когато НСПВС, включително диклофенак, се прилагат по-малко от 24 часа преди или след лечение с метотрексат, тъй като кръвните концентрации на methotrexate може да се повишат и токсичността на това лекарствено вещество да си повиши.



4.6 Фертилитет, бременност и кърмене

Жени с детероден потенциал

Няма достатъчно данни, за да се направят конкретни препоръки за лечение на жени с детероден потенциал.

Бременност

Няма достатъчно данни за употребата на диклофенак при бременни жени. Затова Voltfast не трябва да се използва по време на първите два триместъра от бременността, освен ако очакваните ползи за майката надвишават рисковете за плода. Както при останалите НСПВС, употребата на диклофенак по време на третия триместър на бременността е противопоказана поради възможността на маточна инерция и/ или преждевременно затваряне на дуктус артериозус (вж. т. 4.3 Противопоказания и 5.3 Предклинични данни за безопасност).

Кърмене

Като всички останали НСПВС, диклофенак, преминава в кърмата в малки количества. Поради тази причина Voltfast, не трябва да се приема по време на кърмене, за да се избегнат нежеланите лекарствени ефекти за кърмачето.

Фертилитет

Не се препоръчва при жени които се опитват да забременеят, тъй като употребата на Voltfast, както и на всички НСПВС, може да увреди женския фертилитет. При жени, които имат трудности при забременяването или са изследвани за безплодие, трябва да се обсъди прекратяване на употребата на Voltfast.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Пациентите, които имат зрителни нарушения, чувстват замаяване, световъртеж, сънливост или други нарушения на централната нервна система, докато приемат Voltfast, трябва да се въздържат от шофиране или работа с машини.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Нежеланите лекарствени реакции (Таблица 1) докладвани при клинични изпитвания и/или от спонтанни съобщения или от литературни източници са изброени съгласно MedDRA – по системно-органични класове. Във всеки системно-органичен клас нежеланите лекарствени реакции са подредени според честотата, като най-честите са на първо място. При всяко групиране в зависимост от честотата, нежеланите реакции са изброени в низходящ ред по отношение на тяхната сериозност. В допълнение честотите са определени като е използвана следната конвенция (CIOMS III): много чести ($\geq 1/10$), чести ($\geq 1/100$, $< 1/10$), нечести ($\geq 1/1,000$, $< 1/100$), редки ($\geq 1/10,000$, $< 1/1,000$), много редки ($< 1/10,000$).

Изброените по-долу нежелани лекарствени ефекти, включват тези докладвани при употребата на Voltfast прах за перорален разтвор и/или други фармацевтични форми на употребата диклофенак при краткосрочна или продължителна употреба.

Таблица 1: Нежелани лекарствени реакции

Нарушения на кръвта и лимфната система



Много редки:	Тромбоцитопения, левкопения, анемия (включително хемолитична анемия и апластична анемия), агранулоцитоза.
Нарушения на имунната система	
Редки:	Свръхчувствителност, анафилактични и анафилактоидни реакции (вкл. хипотония и шок).
Много редки:	Ангиедем (вкл. оток на лицето)
Психиатрични нарушения	
Много редки:	Дезориентация, депресия, безсъние, кошмари, раздразнение, психотични нарушения
Нарушения на нервната система	
Чести:	Главоболие, замаяност.
Редки:	Сънливост
Много редки:	Парестезии, нарушения на паметта, конвулсии, тревожност, тремор, асептичен менингит, промяна във вкуса (дисгеузия), цереброваскуларен инцидент.
Зрителни нарушения	
Много редки:	Зрителни нарушения, замъглено виждане, диплопия.
Нарушения на ухото и лабиринта	
Чести:	Световъртеж
Много редки:	Влошен слух, тинитус.
Сърдечни нарушения	
Много редки:	Палпитации, гръдна болка, сърдечна недостатъчност, инфаркт на миокардата
Съдови нарушения:	
Много редки:	Хипертония, васкулит
Респираторни, гръдни и медиастинални нарушения:	
Редки:	Астма (вкл. диспнея)
Много редки:	Пневмонит
Стомашно-чревни нарушения	
Чести:	Гадене, повръщане, диария, диспепсия, коремна болка, флатуленция, намален апетит
Редки:	Гастрит, гастроинтестинално кървене, хематемеза, мелена, хеморагична диария, стомашна или с чревна язва със или без кървене или перфорация
Много редки:	Колит (вкл. хеморагичен колит и екзацербации на улцеративен колит или болест на Crohn), констипация, стоматит (вкл. улцерозен стоматит), глосит, езофагеални нарушения, диафрагма-подобни стеснения на червата, панкреатит.
Хепатобилиарни нарушения	
Чести:	Увеличение на трансаминази.
Редки:	Хепатит, жълтеница, чернодробни нарушения.



Много редки:	Фулминантен хепатит, чернодробна некроза, чернодробна недостатъчност.
Нарушения на кожата и подкожната тъкан	
Чести:	Обрив.
Редки:	Уртикария.
Много редки:	Булозен дерматит, екзема, еритем, erythema multiforme, синдром на Stevens-Johnson, токсична епидермолиза (синдром на Lyell), ексфолиативен дерматит, косопад, реакции на фоточувствителност, пурпура, пурпура на Schonlein-Henoch, сърбеж.
Нарушения на бъбреците и пикочните пътища	
Много редки:	Остра бъбречна недостатъчност, хематурия, протеинурия, тубулоинтерстициален нефрит, нефротичен синдром, бъбречна папиларна некроза.
Общи нарушения и ефекти на мястото на приложение	
Редки:	Едем

4.9 Предозиране

Симптоми

Няма типична клинична картина, асоциирана с предозиране на диклофенак. Предозирането може да предизвика симптоми като: повръщане, гастринтестинално кървене, диария, замаяност, тинитус или конвулсии. Възможни са остра бъбречна криза и увреждане на черния дроб при значително предозиране.

Терапевтични мерки

Лечението на остро отравяне с НСПВС, включително диклофенак, включва главно поддържащи мерки и симптоматично лечение. За усложнения като хипотония, бъбречна недостатъчност, конвулсии, гастроинтестинално смущение и респираторна депресия се прилагат поддържащи мерки и симптоматично лечение.

Малко вероятно е специални мерки като форсирана диуреза, диализа или хемоперфузия да помогнат за елиминиране на НСПВС, включително диклофенак, тъй като степента на тяхното свързване с протеините е висока и метаболизмът им е екстензивен.

При поглъщане на животозастрашаваща свръхдоза, може да се използва активен въглен след изследване на потенциалното токсично предозиране и гастрална деконтаминация (повръщане, стомашна промивка).

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства

Нестероидно противовъзпалително и антиревматично средство, производни на оцетната киселина и сродни вещества (АТС код: M01A B05)

Механизъм на действие



Диклофенак – лекарственото вещество на Voltfast, е нестероидно противовъзпалително средство с антиревматични, аналгетични, противовъзпалителни и антипиретични свойства.

Поради бързата си абсорбция, Voltfast е подходящ за употреба при лечение на остра болка и възпалителни състояния. Инхибирането на биосинтеза на простагландини, демонстрирано експериментално, се счита за основополагащо за механизма му на действие. Простагландините играят основна роля за предизвикване на възпаление, болка и висока температура.

Диклофенак натрий *in vitro* не потиска биосинтеза на протеогликан в хрущялите в концентрации, еквивалентни на концентрациите у човека.

Фармакодинамични свойства

Voltfast също така има доказан аналгетичен ефект при други умерено тежки и тежки болкови състояния. При посттравматични и постоперативни възпалителни състояния, диклофенак бързо облекчава както спонтанната, така и болката при движение и намалява възпалителния оток и отока в областта на оперативната рана. Клинични изпитвания доказват, че лекарственото вещество може да облекчава болката и да понижава кървенето при първична дисменорея. При мигренозни пристъпи, Voltfast е ефективен при облекчаване както на главоболието, така и на гаденето и повръщането, които го придружават.

5.2 Фармакокинетични свойства

Абсорбция

Диклофенак бързо и напълно се резорбира от праха diclofenac potassium. Средни пикови плазмени концентрации от 5,5 micromol/l се достигат 5 – 20 минути след прием на едно саше от 50 mg.

Приемът на лекарството с храна не оказва ефект на резорбираното количество диклофенак, макар че скоростта и степента на резорбция може леко да се забавят.

Площта под концентрационната крива (AUC) след мускулно или венозно приложение е около 2 пъти по-голяма от тази след перорално или ректално приложение, защото половината от активното вещество се метаболизира по време на първото преминаване през черния дроб ("first pass" effect), когато се използват пероралния или ректален начин на приложение.

Фармакокинетичното поведение не се променя при повтарящо се приложение. Не се наблюдава кумулиране при спазване на препоръчаните дозови интервали.

Разпределение

99,7% от диклофенак се свързва със серумните протеини, главно с албумина (99,4%). Установеният обем на разпределение се изчислява на 0,12 до 0,17 l/kg.

Диклофенак навлиза в синовиалната течност, където максималните концентрации са измерени 2-4 часа след достигането на максималните плазмени концентрации. Установеният елиминационен полуживот от синовиалната течност е 3 до 6 часа. Два часа след достигането на максималните плазмени нива концентрациите на лекарственото вещество вече са по-високи в синовиалната течност в сравнение с плазмата и остават по-високи за период до 12 часа.

Диклофенак е бил открит в ниска концентрация (100 ng/ml) в кърмата на една майка. Очакваното количество, приемано от детето при консумация на мляко е еквивалентно на доза от 0,03 mg/kg/дневно.

Биотрансформация/ метаболизъм



Биотрансформацията на диклофенак настъпва частично чрез глюкуронизация на цялата молекула, но главно чрез единична и многократна хидратация и метоксиация, които дават в резултат няколко фенолни метаболита (3'-hydroxy-, 4'-hydroxy-, 5'-hydroxy-, 4',5'-dihydroxy- и 3'-hydroxy-4'-methoxydiclofenac), повечето от които се конвертират до глюкуронови конюгати. Два от тези фенолови метаболити са биологично активни, но в много по-малка степен от диклофенак.

Елиминиране

Общият системен клирънс на диклофенак от плазмата е 263 ± 56 ml/min (средна стойност \pm стандартно отклонение). Терминалният елиминационен полуживот от плазмата е 1 до 2 часа. Четири от метаболитите, включително двата активни метаболита, също имат кратък плазмен елиминационен полуживот от 1 до 3 часа. Един от метаболитите, 3'-hydroxy-4'-methoxy-diclofenac има много по-голям на плазмен елиминационен полуживот, но той е практически неактивен.

Около 60% от приетата доза се екскретират в урината като метаболити, като по-малко от 1% се екскретират в непроменен вид. Останалото количество от дозата се елиминира като метаболити през жлъчката във фецеса.

Линейност/ нелинейност

Резорбираното количество е в линейна зависимост от големината наприложената доза.

Специални групи пациенти

Не са наблюдавани релевантни възрастово зависими разлики по отношение на резорбцията, метаболизма или екскрецията на лекарството.

При пациенти, с нарушена бъбречна функция, не може да се каже, че има кумулиране на непроменено активно лекарствено вещество вследствие на кинетиката на единична доза, приложена по обичайния график на прием. При креатининов клирънс по-малък от 10 ml/min, изчислените равновесни (steady-state) плазмени концентрации на хидрокси-метаболитите са около 4 пъти по-високи в сравнение с тези при нормални пациенти. Все пак, метаболитите в крайна сметка се елиминират с жлъчката. При пациенти с нарушена чернодробна функция (хроничен хепатит или недекомпенсирана цироза) кинетиката и метаболизмът на диклофенак са същите, както при пациенти без чернодробно заболяване.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Предклиничните данни от изследвания на повтаряща се еднаква доза за токсичност, генотоксичност, мутагенност и канцерогенност с диклофенак не показват риск за хората при определената терапевтична доза. Липсват доказателства от стандартни предклинични изпитвания върху животни, че диклофенак има тератогенен потенциал при мишки, плъхове или зайци.

Диклофенак не повлиява фертилитета при плъхове. С изключение на минимални ефекти върху плода в дози, токсични за майката, пре-, пери- и постнаталното развитие на поколението не са засегнати.

Приложението на НСПВС (вкл. диклофенак) потиска овулацията при зайци и имплантацията и плацентацията при плъхове, което може да доведе до преждевременно затваряне на дуктус артериозус при бременни плъхове. При плъхове токсичните за майката дози диклофенак са свързани с дистокия, увеличена продължителност на бременността, намалена преживяемост на плода и вътрематочно забавяне на растежа. Леките ефекти на диклофенак върху репродукционните показатели и раждането, както и вътреутробната констрикция на дуктус артериозус, са фармакологични последици от този клас на инхибитори на простагландиновия синтез (вж. т. 4.3 Противопоказания и т. 4.6 Фертилитет, бременност и кърмене).



6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Калиев хидроген карбонат, манитол, аспартам, захарин натрий, глицерил дибехенат, есенция мента, есенция анасон.

6.2 Несъвместимости

Няма

6.3 Срок на годност

2 години.

6.4 Специални условия на съхранение

Да не се съхранява над 25°C.

Да се съхранява в оригиналната опаковка, за да се предпази от влага.
Volfast трябва да се съхранява на недостъпни за деца места.

6.5 Вид и съдържание на опаковката

Всяка опаковка съдържа 3 сашета по 50 mg Volfast.

6.6 Инструкции за употреба/ изхвърляне

Няма специални изисквания.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Novartis Pharma GmbH, Roonstrasse 25, 90429, Nuernberg, Германия

8. РЕГИСТРАЦИОНЕН НОМЕР

20060381

9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШЕНИЕ ЗА УПОТРЕБА

14.08.2006 г.

10. ПОСЛЕДНА РЕДАКЦИЯ НА ТЕКСТА

10 февруари 2012 г.

