

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування лікарського засобу

ДЕСКЕТ
(DESKET)

Склад:

діюча речовина: декскетопрофену трометамол;

1 мл розчину для ін'єкцій містить декскетопрофену трометамолу 36,9 мг, що еквівалентно декскетопрофену 25 мг (1 ампула по 2 мл містить декскетопрофену трометамолу 73,8 мг, що еквівалентно декскетопрофену 50 мг);

допоміжні речовини: етанол 96 %, натрію хлорид, натрію гідроксид, вода для ін'єкцій.

Лікарська форма. Розчин для ін'єкцій.

Основні фізико-хімічні властивості: прозорий, безбарвний розчин.

Фармакотерапевтична група. Нестероїдні протизапальні та протиревматичні засоби. Похідні пропіонової кислоти. Декскетопрофен. Код АТХ M01A E17.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Декскетопрофену трометамол – це сіль пропіонової кислоти, що чинить анальгетичну, протизапальну та жарознижувальну дію і належить до класу нестероїдних протизапальних засобів (НПЗЗ). Механізм її дії базується на зменшенні синтезу простагландинів за рахунок пригнічення циклооксигенази. Зокрема гальмується перетворення арахідонової кислоти у циклічні ендопероксиди PGG₂ та PGH₂, з яких утворюються простагландини PGE₁, PGE₂, PGF_{2α}, PGD₂, а також простациклін PGI₂ та тромбоксани TxA₂ і TxB₂. Крім цього, пригнічення синтезу простагландинів може впливати на інші медіатори запалення, такі як кініні, що може також опосередковано впливати на основну дію препарату. Була виявлена

пригнічувальна дія декскетопрофену трометамолу на активність циклооксигенази-1 та циклооксигенази-2. Клінічні дослідження при різних видах болю продемонстрували, що декскетопрофену трометамол має виражену анагетичну дію. Знеболювальна дія декскетопрофену трометамолу при внутрішньом'язовому та внутрішньовенному введенні пацієнтам із болем середньої та сильної інтенсивності була вивчена при різних видах болю при хірургічних втручаннях (ортопедичні та гінекологічні операції, операції на черевній порожнині), а також при болю в опорно-руховому апараті (гострий біль у попереку) та ниркових коліках. Тривалість знеболювальної дії після застосування 50 мг декскетопрофену трометамолу, як правило, становить 8 годин. Якщо пацієнтам, яким призначали з метою купірування післяопераційного болю морфій за допомогою приладу для знеболювання, що контролюється пацієнтом, призначали і декскетопрофену трометамол, їм було потрібно значно менше морфію (на 30-45 %), ніж пацієнтам, які отримували плацебо.

Фармакокінетика.

Після внутрішньом'язового введення декскетопрофену трометамолу максимальна концентрація досягається приблизно через 20 хвилин (10-45 хвилин). Доведено, що при одноразовому внутрішньом'язовому або внутрішньовенному введенні 25-50 мг препарату площа під кривою AUC («концентрація – час») пропорційна до дози. Фармакокінетичні дослідження багаторазового застосування препарату довели, що AUC та C_{max} (середнє максимальне значення) після останнього внутрішньом'язового та внутрішньовенного введення не відрізняються від показників після одноразового застосування, що свідчить про відсутність кумуляції лікарського засобу. Аналогічно до інших лікарських засобів із високим ступенем зв'язування з білками плазми крові (99 %), об'єм розподілу декскетопрофену становить у середньому 0,25 л/кг. Період напіврозподілу становить приблизно 0,35 години, а період напіввиведення – 1-2,7 години. Метаболізм декскетопрофену в основному відбувається шляхом кон'югації з глюкуроновою кислотою та наступним виведенням нирками. Після введення декскетопрофену трометамолу у сечі виявляється тільки оптичний ізомер S-(+), що свідчить про відсутність трансформації препарату в оптичний ізомер R-(-). Після введення одноразових та багаторазових доз ступінь впливу препарату на здорових добровольцях літнього віку (від 65 років), які приймали участь у дослідженні, була значно вищою (до 55 %), ніж на молодих добровольцях, однак статистично значущої різниці у максимальній концентрації та часі її досягнення не спостерігалось. Середній період напіввиведення збільшувався (до 48 %), а визначений сумарний кліренс скорочувався.

Клінічні характеристики.

Показання.

Симптоматичне лікування гострого болю середньої та високої інтенсивності у випадках, коли пероральне застосування препарату недоцільне, наприклад, при післяопераційних болях, ниркових коліках та болю у попереку (біль у спині).

Протипоказання.

- Підвищена чутливість до декскетопрофену, до будь-якого іншого нестероїдного протизапального засобу (НПЗЗ) або до допоміжних речовин препарату;
- якщо речовини аналогічної дії, наприклад, ацетилсаліцилова кислота або інші НПЗЗ провокують розвиток нападів бронхіальної астми, бронхоспазму, гострого риніту або спричиняють розвиток носових поліпів, появу кропив'янки або ангіоневротичного набряку;
- в активній фазі виразкової хвороби або при кровотечі, підозрі на них або при рецидивуючій виразковій хворобі або кровотечі в анамнезі (не менше двох підтверджених фактів виразки або кровотечі) або хронічна диспепсія;
- при шлунково-кишковій кровотечі, іншій кровотечі в активній фазі або при підвищеній кровоточивості;
- при шлунково-кишковій кровотечі або перфорації в анамнезі, пов'язаних із попередньою терапією НПЗЗ;
- при хворобі Крона або при неспецифічному виразковому коліті;
- при бронхіальній астмі в анамнезі;
- при тяжкій серцевій недостатності;
- при порушенні функції нирок середнього або тяжкого ступеня (кліренс креатиніну < 50 мл/хв);
- при тяжкому порушенні функції печінки (10-15 балів за шкалою Чайлда-П'ю);
- при геморагічному діатезі та при інших порушеннях згортання крові;
- у III триместрі вагітності та у період годування груддю;
- застосування з метою нейроаксіального (інтратекального або епідурального введення (через вміст етанолу).

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Одночасне застосування таких засобів з НПЗЗ не рекомендується:

– інші НПЗЗ, у тому числі саліцилати у високих дозах (≥ 3 г/добу). При одночасному застосуванні кількох НПЗЗ підвищується ризик виникнення виразки у травному тракті та шлунково-кишкової кровотечі внаслідок їх взаємно підсилюючої дії;

– антикоагулянти: НПЗЗ посилюють дію антикоагулянтів, наприклад, варфарину, внаслідок високого ступеня зв'язування декскетопрофену з білками плазми крові, а також пригнічення функції тромбоцитів та пошкодження слизової оболонки шлунка та дванадцятипалої кишки. Якщо одночасне застосування необхідне, його слід проводити під ретельним контролем лікаря та відповідних лабораторних показників;

– гепарин: підвищується ризик кровотеч (через пригнічення функції тромбоцитів та пошкодження слизової оболонки шлунка та дванадцятипалої кишки). Якщо одночасне застосування необхідне, його слід проводити під ретельним контролем лікаря та відповідних лабораторних показників;

– кортикостероїдні засоби: підвищується ризик розвитку виразки у травному тракті та шлунково-кишкової кровотечі;

– літій (були повідомлення для кількох НПЗЗ): НПЗЗ підвищують рівень літію у крові, що може призвести до інтоксикації (понижується виведення літію нирками). Тому на початку застосування декскетопрофену, при корекції дози або відміні препарату необхідно проконтролювати рівень літію у крові;

– метотрексат у високих дозах (не менше 15 мг на тиждень). За рахунок зменшення ниркового кліренсу метотрексату на тлі застосування НПЗЗ у цілому посилюється його негативний вплив на систему крові;

– похідні гідантоїну та сульфонаміди: можливе посилення токсичності цих речовин.

Одночасне застосування таких засобів з НПЗЗ вимагає обережності:

– діуретичні засоби, інгібітори ангіотензинперетворювального ферменту (АПФ), антибактеріальні аміноглікозиди та антагоністи рецепторів ангіотензину II. Декскетопрофен знижує ефективність діуретичних засобів та інших антигіпертензивних засобів. У деяких пацієнтів із порушенням функції нирок (наприклад, при зневодненні або в осіб літнього віку) застосування засобів, що пригнічують циклооксигеназу, одночасно з інгібіторами АПФ, антагоністами рецепторів ангіотензину II або антибактеріальними аміноглікозидами може погіршити функцію нирок, що,

як правило, є оборотним процесом. При застосуванні декскетопрофену разом із будь-яким діуретичним засобом слід переконатися у відсутності зневоднення у пацієнта, а на початку лікування необхідно контролювати функцію нирок;

– метотрексат у низьких дозах (менше 15 мг на тиждень): за рахунок зменшення ниркового кліренсу метотрексату на тлі застосування НПЗЗ посилюється його негативний вплив на систему крові загалом. У перші тижні одночасного застосування необхідно щотижня проводити аналіз крові. Навіть при незначному порушенні функції нирок, а також у пацієнтів літнього віку лікування слід проводити під суворим наглядом лікаря;

– пентоксифілін: існує ризик кровотечі. Необхідно посилити контроль і частіше перевіряти показник часу кровотечі;

– зидовудин: існує ризик збільшення токсичного впливу на еритроцити за рахунок впливу на ретикулоцити, що після першого тижня застосування НПЗЗ призводить до тяжкої анемії. Протягом 1-2 тижнів після початку застосування НПЗЗ слід зробити аналіз крові та перевірити вміст ретикулоцитів;

– препарати сульфонілсечовини: НПЗЗ здатні посилити гіпоглікемічну дію цих засобів за рахунок заміщення препаратів сульфонілсечовини у сполуках з білками плазми крові.

Слід врахувати можливі взаємодії при застосуванні таких засобів:

– бета-блокатори: НПЗЗ здатні послабити їх антигіпертензивну дію за рахунок пригнічення синтезу простагландинів;

– циклоспорин та такролімус: можливе посилення нефротоксичності за рахунок впливу НПЗЗ на ниркові простагландини. При комбінованій терапії слід контролювати функцію нирок;

– тромболітичні засоби: підвищується ризик кровотечі;

– антиагрегантні засоби та селективні інгібітори зворотного захоплення серотоніну: підвищується ризик шлунково-кишкової кровотечі;

– пробенецид: можливе збільшення концентрації декскетопрофену у плазмі крові, що, вірогідно, зумовлено пригніченням ниркової канальцевої секреції та кон'югації препарату з глюкуроноювою кислотою і вимагає корекції дози декскетопрофену;

– серцеві глікозиди: НПЗЗ здатні збільшити концентрацію глікозидів у плазмі крові;

– міфепристон: через теоретичну вірогідність зниження ефективності міфепристону під впливом інгібіторів простагландинсинтетази. НПЗЗ слід призначати тільки через

8-12 діб після терапії міфепристоном;

– хінолон: результати досліджень на тваринах показали, що при застосуванні похідних хінолону у високих дозах у комбінації з НПЗЗ підвищується ризик розвитку судом.

Особливості застосування.

З обережністю застосовувати пацієнтам з алергічними станами в анамнезі. Уникати застосування препарату Дескет, розчин для ін'єкцій 25 мг/мл, у комбінації з іншими НПЗЗ, у тому числі з селективними інгібіторами циклооксигенази-2. Побічні реакції можна скоротити за рахунок застосування найменшої ефективної дози протягом якомога коротшого часу, необхідного для покращення стану.

Шлунково-кишкові кровотечі, утворення виразки або її перфорація, у деяких випадках з летальним наслідком, спостерігалось для усіх НПЗЗ на різних етапах лікування незалежно від наявності симптомів-передвісників або наявності в анамнезі серйозної патології з боку травного тракту. При розвитку шлунково-кишкової кровотечі застосування препарату слід припинити. Ризик виникнення шлунково-кишкової кровотечі, утворення виразки або її перфорація підвищується зі збільшенням дози НПЗЗ у пацієнтів на виразку в анамнезі, особливо ускладненої кровотечею або перфорацією, а також у пацієнтів літнього віку. У пацієнтів літнього віку підвищена частота побічних реакцій НПЗЗ, особливо виникнення шлунково-кишкової кровотечі та перфорації, іноді з летальним наслідком. Лікування таких пацієнтів слід розпочинати з найменшої можливої дози. НПЗЗ слід з обережністю призначати пацієнтам із захворюваннями травного тракту в анамнезі, оскільки існує ризик їх загострення. Застосування НПЗЗ може призводити до рецидивів неспецифічного виразкового коліту, а також хвороби Крона у пацієнтів, які знаходяться у фазі ремісії. Перед початком застосування декскетопрофену трометамолу пацієнтам, які мають в анамнезі езофагіт, гастрит та/або виразкову хворобу, слід бути певним, що ці захворювання знаходяться у фазі ремісії. У пацієнтів із наявними симптомами патології травного тракту та із захворюваннями травного тракту в анамнезі протягом застосування препарату необхідно контролювати стан травного тракту на предмет виникнення можливих порушень, особливо це стосується шлунково-кишкової кровотечі.

Для таких пацієнтів та пацієнтів, які застосовують ацетилсаліцилову кислоту у малих дозах або інші засоби, що збільшують ризик виникнення

побічних реакцій з боку травного тракту, слід розглянути можливість комбінованої терапії з препаратами-протекторами, наприклад, мізопростолом або інгібіторами протонної помпи.

Пацієнтам, особливо літнього віку, які мають в анамнезі побічні реакції з боку травного тракту, необхідно сповістити лікаря про всі незвичні симптоми, пов'язані з травною системою, зокрема про шлунково-кишкові кровотечі, особливо на початкових етапах лікування.

Слід з обережністю призначати препарат пацієнтам, які одночасно застосовують засоби, що можуть збільшити ризик виникнення виразки або кровотечі, а саме – пероральні кортикостероїдні засоби, антикоагулянтні засоби (наприклад, варфарин), селективні інгібітори зворотного захоплення серотоніну або антиагрегантні засоби, такі як аспірин.

Неселективні НПЗЗ здатні зменшувати агрегацію тромбоцитів та збільшувати час кровотечі за рахунок пригнічення синтезу простагландинів. Одночасне застосування декскетопрофену трометамолу та низькомолекулярного гепарину у профілактичних дозах у післяопераційний період вивчали у клінічних дослідженнях і впливу на показники коагуляції не було виявлено. Однак пацієнтам, які застосовують декскетопрофену трометамол одночасно з препаратами, що впливають на гемостаз, наприклад, варфарин, інші кумаринові препарати або гепарини, необхідно перебувати під ретельним наглядом лікаря.

Пацієнтам з артеріальною гіпертензією та/або застійною серцевою недостатністю легкої або помірної тяжкості слід перебувати під ретельним наглядом лікаря через можливу затримку рідини в організмі та появу периферичних набряків.

Відповідно до наявних клінічних та епідеміологічних даних застосування деяких НПЗЗ, особливо у високих дозах та протягом тривалого часу, може супроводжуватися деяким збільшенням ризику виникнення станів, спричинених тромбозом артерій, наприклад, інфаркту міокарда або інсульту. Даних для виключення декскетопрофену трометамолу недостатньо.

При неконтрольованій артеріальній гіпертензії, застійній серцевій недостатності, підтвердженій ішемічній хворобі серця, захворюванні периферичних артерій та/або судин головного мозку декскетопрофену трометамол слід застосовувати тільки після ретельної оцінки стану пацієнта. Те саме слід робити перед початком тривалого лікування пацієнтам із факторами ризику щодо серцево-судинних захворювань, наприклад, артеріальна гіпертензія, гіперліпідемія, цукровий діабет, паління.

Були повідомлення про дуже рідкісні випадки розвитку серйозних шкірних реакцій (деякі – з летальним наслідком) на тлі застосування НПЗЗ, у тому

числі ексфоліативний дерматит, синдром Стівенса-Джонсона та токсичний епідермальний некроліз. Вірогідно, найбільший ризик їх виникнення спостерігається у пацієнтів на початку лікування, у більшості пацієнтів вони виникали протягом першого місяця терапії. При появі шкірних висипань, ознак ураження слизових оболонок або інших симптомів гіперчутливості препарат Дескет, розчин для ін'єкцій 25 мг/мл слід відмінити. Як і всі НПЗЗ, препарат здатний підвищувати рівень азоту сечовини та креатиніну у плазмі крові. Подібно до інших інгібіторів синтезу простагландинів його застосування може супроводжуватися побічними реакціями з боку нирок, що може призвести до гломерулонефриту, інтерстиціального нефриту, папілярного некрозу, нефротичного синдрому та гострої ниркової недостатності.

Як і інші НПЗЗ, препарат може спричинити тимчасове та незначне підвищення показників деяких печінкових проб, а також значне підвищення рівня АСТ та АЛТ. При відповідному збільшенні цих показників лікування слід припинити.

Слід з обережністю призначати препарат пацієнтам із порушенням функції печінки та/або нирок, а також пацієнтам з артеріальною гіпертензією та/або застійною серцевою недостатністю, оскільки у них на тлі застосування НПЗЗ можливе погіршення функції нирок, затримка рідини в організмі та поява периферичних набряків. Через підвищений ризик нефротоксичності препарат слід з обережністю застосовувати при лікуванні діуретичними засобами, а також пацієнтам, у яких можливий розвиток гіповолемії.

Особливої обережності слід дотримуватися при лікуванні пацієнтів із захворюваннями серця в анамнезі, зокрема з попередніми епізодами серцевої недостатності, оскільки на тлі застосування препарату підвищується ризик виникнення серцевої недостатності.

Найбільше порушень функції нирок, серцево-судинної системи та печінки виникає у пацієнтів літнього віку.

Дескет, розчин для ін'єкцій 25 мг/мл слід з обережністю вводити пацієнтам із порушенням кровотворення, системним червоним вовчаком та змішаними захворюваннями сполучної тканини.

Як і інші НПЗЗ, декскетопрофену трометамол здатний маскувати симптоми інфекційних захворювань під час його застосування. В ізольованих випадках під час застосування НПЗЗ були повідомлення про активізацію інфекційних процесів, що локалізуються у м'яких тканинах. Таким чином, якщо під час застосування з'являються або посилюються симптоми бактеріальної інфекції, пацієнтам рекомендується негайно звернутися до лікаря.

Як і всі інші НПЗЗ, декскетопрофену трометамол може знижувати жіночу фертильність, тому його не рекомендується застосовувати жінкам, які планують вагітність. Жінкам, які мають проблеми із зачаттям або проходять обстеження на предмет безпліддя, слід розглянути можливість відміни препарату. Призначення Дескету, розчину для ін'єкцій 25 мг/мл у I та II триместрах вагітності можливе у випадках крайньої необхідності.

Кожна ампула препарату Дескет, розчин для ін'єкцій 25 мг/мл містить 200 мг етанолу, що дорівнює 5 мл пива або 2,08 вина на дозу. Препарат може негативно впливати на осіб, які страждають на алкоголізм. Вміст етанолу слід враховувати при застосуванні препарату у I та II триместрах вагітності, дітям та пацієнтам із групи ризику, наприклад, при захворюваннях печінки, а також пацієнтам хворим на епілепсію. Лікарський засіб містить менше 1 ммоль натрію (23 мг) на дозу, тому практично не містить вільного натрію.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Застосування препарату Дескет, розчин для ін'єкцій 25 мг/мл, протипоказано у III триместрі вагітності та у період годування груддю.

Пригнічення синтезу простагландинів може негативно вплинути на вагітність та/або розвиток плода. Відповідно до результатів епідеміологічних досліджень застосування препаратів, що пригнічують синтез простагландинів, на ранніх термінах вагітності збільшує ризик викидня, виникнення у плода вади серця та незрощення передньої черевної стінки. Так абсолютний ризик розвитку аномалій серцево-судинної системи збільшувався з < 1% до приблизно 1,5 %. Вважається, що небезпека виникнення таких явищ підвищується зі збільшенням дози препарату та тривалості терапії. Застосування інгібіторів синтезу простагландинів у тварин спричиняло збільшення пре- та постімплантаційних втрат і підвищення ембріофетальної летальності. Крім того, у тварин, яким застосовували інгібітори синтезу простагландинів у період органогенезу, підвищувалася частота виникнення вад розвитку плода, у тому числі аномалій серцево-судинної системи. Тим не менше, дослідження декскетопрофену трометамолу на тваринах не виявили токсичності по відношенню до репродуктивних органів. Призначення декскетопрофену трометамолу у I та II триместрах вагітності можливе тільки при крайній необхідності. При призначенні декскетопрофену трометамолу жінкам, які планують вагітність, або у I та II триместрах вагітності слід застосовувати найменшу можливу ефективну дозу протягом якомога коротшого терміну лікування.

Під час III триместру усі інгібітори синтезу простагландинів спричиняють наступне:

Ризики для плода:

- кардіопульмональний токсичний синдром (із закупоркою артеріального протоку та легеневою гіпертензією);
- порушення функції нирок, що може прогресувати до ниркової недостатності з розвитком маловоддя;

Ризики для матері та дитини наприкінці вагітності:

- подовження часу кровотечі (ефект пригнічення агрегації тромбоцитів), що можливе навіть за умови застосування низьких доз;
- затримка скорочення матки з відповідною затримкою пологів та зтяжними пологами.

Даних щодо проникнення декскетопрофену у грудне молоко немає.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

На тлі застосування препарату Дескет, розчин для ін'єкцій 25 мг/мл можливе виникнення запаморочення, сонливості та підвищеної втомлюваності, тому не виключається слабкий або помірний вплив на здатність керувати автотранспортом або обслуговувати інші механізми. Пацієнти мають це враховувати та об'єктивно оцінювати свою здатність до виконання таких робіт.

Спосіб застосування та дози.

Дорослі. Рекомендована доза становить 50 мг з інтервалом 8-12 годин. При необхідності повторну дозу вводити через 6 годин. Максимальна добова доза не має перевищувати 150 мг. Препарат призначений для короточасного застосування, тому його слід застосовувати тільки у період гострого болю (не довше 2-х діб). Пацієнтів слід переводити на пероральне застосування аналгетиків, якщо це можливо. Побічні реакції можна скоротити за рахунок застосування найменшої ефективної дози протягом якомога коротшого часу, необхідного для покращення стану. При післяопераційних болях середнього або сильного ступеня тяжкості препарат можна застосовувати за показаннями у тих же самих рекомендованих дозах у комбінації з опіоїдними аналгетиками.

Пацієнти літнього віку. Коригування дози зазвичай не потрібне. Однак через фізіологічне зниження функції нирок рекомендується нижча доза препарату, а саме – максимальна добова доза становить 50 мг при легкому порушенні функції нирок.

Порушення з боку печінки. Для пацієнтів із патологією печінки з легким або середнім ступенем тяжкості (5-9 балів за шкалою Чайлда-П'ю) слід зменшити максимальну добову дозу до 50 мг та ретельно контролювати функцію печінки. При тяжких захворюваннях печінки препарат протипоказаний (10-15 балів за шкалою Чайлда-П'ю).

Порушення з боку нирок. Для пацієнтів із порушенням функції нирок легкого ступеня (кліренс креатиніну 50-80 мл/хв) максимальну добову дозу слід зменшити до 50 мг. При порушенні функції нирок середнього або тяжкого ступеня (кліренс креатиніну < 50 мл/хв) препарат протипоказаний.

Діти та підлітки. Препарат не слід застосовувати дітям та підліткам через відсутність даних щодо його ефективності та безпеки.

Внутрішньом'язове введення. Розчин для ін'єкцій слід повільно вводити глибоко у м'язи.

Внутрішньовенна інфузія.

Для проведення внутрішньовенної інфузії вміст ампули 2 мл розвести у 30-100 мл 0,9 % розчину натрію хлориду, розчині глюкози або розчині Рінгера-лактату. Розчин для інфузій слід готувати в асептичних умовах, не допускаючи впливу природного денного світла. Приготовлений розчин має бути прозорим. Інфузію необхідно проводити протягом 10-30 хвилин. Не допускати впливу природного денного світла на приготовлений розчин.

Дескет, розчин для ін'єкцій 25 мг/мл, розведений у 100 мл 0,9 % розчину натрію хлориду або у розчині глюкози можна змішувати з допаміном, гепарином, гідроксизиним, лідокаїном, морфіном, петидином та теофіліном.

Дескет, розчин для ін'єкцій 25 мг/мл не можна змішувати у розчині для інфузій з прометазином та пентазоцином.

Внутрішньовенна ін'єкція (болюсне введення).

При необхідності вміст 1 ампули (2 мл розчину для ін'єкцій) вводити внутрішньовенно протягом не менше 15 секунд.

Препарат можна змішувати у малих об'ємах (наприклад, у шприці) з розчинами для ін'єкцій гепарину, лідокаїну, морфіну та теофіліну.

Дескет, розчин для ін'єкцій 25 мг/мл не можна змішувати у малих об'ємах (наприклад, у шприці) з розчинами допаміну, прометазину пентазоцину, петидину та гідрокортизону, тому що утворюється білий осад.

Препарат можна змішувати тільки з лікарськими засобами, що вказані вище.

При внутрішньом'язовому або внутрішньовенному ін'єкційному застосуванні препарат слід негайно ввести після того, як він був набраний з ампули. Розчин для внутрішньовенної інфузії слід застосовувати одразу після його приготування.

При зберіганні розведених розчинів препарату у поліетиленових пакетах або у прилаштованих для введення виробач з етилвінілацетату, пропіонату целюлози, поліетилену низької щільності та полівінілхлориду змін вмісту діючої речовини внаслідок сорбції не спостерігалось.

Препарат Дескет, розчин для ін'єкцій 25 мг/мл призначений для одноразового застосування, тому залишки готового розчину слід утилізувати. Перед введенням препарату необхідно впевнитися, що розчин прозорий та безбарвний. Розчин, що містить тверді частки, застосовувати не можна.

Діти. Препарат не слід застосовувати дітям через відсутність даних щодо його ефективності та безпеки.

Передозування.

Симптоматика передозування невідома. Аналогічні лікарські засоби спричиняють порушення з боку травного тракту (блювання, анорексія, біль у животі) та нервової системи (сонливість, запаморочення, дезорієнтація, головний біль). При випадковому передозуванні слід негайно розпочати симптоматичне лікування відповідно до стану пацієнта. Декскетопрофену трометамол видаляється з організму за допомогою діалізу.

Побічні реакції.

У нижченаведеній таблиці 1 зазначені розподілені за органами та системами органів і частотою виникнення побічні дії, зв'язок яких із декскетопрофеном трометамолом визнаний як мінімум можливим.

Органи і системи органів	Часто (від 1/100 до 1/10)	Іноді (від 1/1000 до 1/100)	Рідко (від 1/10000 до 1/1000)	Дуже рідко (менше 1/10000)
З боку крові/лімфатичної системи	—	Анемія	—	Нейтропенія, тромбоз
З боку імунної системи	—	—	Набряк гортані	Анафілактична реакція, числі анафілактичний шок
Порушення харчування та обміну речовин	—	—	Гіперглікемія, гіпоглікемія, гіпертригліцеридемія, анорексія, відсутність апетиту	
Психічні порушення	—	Безсоння, занепокоєність	—	
З боку нервової системи	—	Головний біль, запаморочення, сонливість	Парестезії, непритомність	
З боку органів зору	—	Нечіткість зору	—	
З боку органів слуху	—	Вертиго	Дзвін у вухах	
З боку серця	—	Пальпітація	Екстрасистолія, тахікардія	
З боку судинної системи	—	Артеріальна гіпотензія, припливи	Артеріальна гіпертензія, тромбофлебіт поверхневих вен	
З боку дихальних шляхів, органів грудної клітки та середостіння	—	—	Брадипное	Бронхоспазм, задишка
З боку травного тракту	Нудота, блювання	Біль у животі, диспепсія, діарея, запор, блювання з домішками крові, сухість у роті	Виразкова хвороба, кровотеча або перфорація	Панкреатит
З боку гепатобіліарної системи	—	—	Гепатит, жовтяниця	Гепатомегалія, патологічні зміни в печінці

З боку шкіри та підшкірної клітковини	—	Дерматити, свербіж, висипання, підвищене потовиділення	Кропив'янка, вугри	Синдром Джонсона-Токсічний епідермальний некроліз Лайєла, ангіоневроз, набряк обличчя, фотосенсибілізація
З боку опорно-рухового апарату та сполучної тканини	—	—	Ригідність м'язів, скутість у суглобах, м'язові судоми, біль у спині	
З боку нирок та сечовивідних шляхів	—	—	Гостра ниркова недостатність, поліурія, кетонурія, протеїнурія	Нефрогенний нефроз, синдром
З боку репродуктивної системи	—	—	Менструальні порушення, порушення функції передміхурової залози	
Загальні та місцеві порушення	Біль у місці ін'єкції, реакції у місці ін'єкції, у тому числі запалення, гематома, кровотеча	Пропасниця, підвищена втомлюваність, болі, озноб, астения, нездужання	Тремтіння, периферичні набряки	
Дослідження	—	—	Відхилення у печінкових пробах	

Порушення з боку травного тракту спостерігалися найчастіше.

Можливий розвиток виразкової хвороби, перфорації або шлунково-кишкової кровотечі, іноді з летальним наслідком, особливо у пацієнтів літнього віку. За наявними даними, на тлі застосування препарату може виникати нудота, блювання, діарея, метеоризм, запор, диспептичні явища, біль у животі, мелена, блювання з домішками крові, виразковий

стоматит, загострення коліту та хвороба Крона. Рідше спостерігається гастрит. Також відзначалися набряки, артеріальна гіпертензія та серцева недостатність, що можуть бути спричинені застосуванням НПЗЗ. Як і у випадку застосування інших НПЗЗ, можливі такі побічні реакції: асептичний менінгіт, що загалом виникає у пацієнтів, хворих на системний червоний вовчак або на змішані захворювання сполучної тканини, та реакції з боку крові (пурпура, апластична та гемолітична анемія, рідко – агранулоцитоз та гіпоплазія кісткового мозку). Можливі бульозні реакції, у тому числі синдром Стівенса-Джонсона та токсичний епідермальний некроліз (дуже рідко).

Відповідно до результатів клінічних досліджень та епідеміологічних даних, застосування деяких НПЗЗ, особливо у високих дозах та протягом тривалого часу, може супроводжуватися деяким збільшенням ризику розвитку патології, спричиненої тромбозом артерій, наприклад, інфаркту міокарда та інсульту.

Термін придатності. 2 роки.

Умови зберігання. Для захисту від світла, зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С. Після розведення розчин зберігають протягом 24 годин при температурі від 2 до 8 °С. Зберігати у недоступному для дітей місці.

Несумісність.

Дескет, розчин для ін'єкцій 25 мг/мл не можна змішувати у малих об'ємах (наприклад, у шприці) з розчинами допаміну, прометазину, пентазоцину, петидину та гідрокортизону, тому що утворюється білий осад.

Розведені розчини для інфузій, отримані, як зазначено в розділі «Внутрішньовенні інфузії», не можна змішувати з прометазином або пентазоцином.

Упаковка.

По 2 мл в ампулі, по 5 ампул у блістері, по 1 або 2 блістери у пачці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. Приватне акціонерне товариство «Лекхім-Харків».

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

Україна, 61115, Харківська обл., місто Харків, вулиця Северина Потоцького, будинок 36.

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению лекарственного средства

ДЕСКЕТ (DESKET)

Состав:

действующее вещество: декскетопрофена трометамол;

1 мл раствора для инъекций содержит декскетопрофена трометамола 36,9 мг, что эквивалентно декскетопрофену 25 мг (1 ампула по 2 мл содержит декскетопрофена трометамола 73,8 мг, что эквивалентно декскетопрофену 50 мг);

вспомогательные вещества: этанол 96%, натрия хлорид, натрия гидроксид, вода для инъекций.

Лекарственная форма. Раствор для инъекций.

Основные физико-химические свойства: прозрачный, бесцветный раствор.

Фармакотерапевтическая группа. Нестероидные противовоспалительные и противоревматические средства. Производные пропионовой кислоты. Декскетопрофен.
Код АТХ M01A E17.

Фармакологические свойства.

Фармакодинамика.

Декскетопрофена трометамол – это соль пропионовой кислоты, которая оказывает анальгезирующее, противовоспалительное и жаропонижающее действие и относится к классу нестероидных противовоспалительных средств (НПВС). Механизм ее действия основан на уменьшении синтеза простагландинов за счет угнетения циклооксигеназы. В частности тормозится превращение арахидоновой кислоты в циклические эндопероксиды PGG₂ и PGH₂, из которых образуются простагландины PGE₁, PGE₂, PGF_{2α}, PGD₂, а также простаглицин PGI₂ и тромбоксаны TxA₂ и TxB₂. Кроме этого, угнетение синтеза простагландинов может влиять на другие медиаторы воспаления, такие как кинины, что может также косвенно влиять на основное действие препарата. Было обнаружено угнетающее действие декскетопрофена трометамола на активность циклооксигеназы-1 и циклооксигеназы-2. Клинические исследования при различных видах боли продемонстрировали, что декскетопрофена трометамол оказывает выраженное анальгезирующее действие. Обезболивающее действие декскетопрофена трометамола при внутримышечном и внутривенном введении пациентам с болью средней и сильной интенсивности была изучена при различных видах боли при хирургических вмешательствах (ортопедические и гинекологические операции, операции на брюшной полости), а также при боли в опорно-двигательном аппарате (острая боль в пояснице) и почечных коликах. Продолжительность обезболивающего действия после применения 50 мг декскетопрофена трометамола, как правило, составляет 8 часов. Если пациентам, которым назначали с целью купирования послеоперационной боли морфий с помощью прибора для обезболивания, который контролируется пациентом, назначали и декскетопрофена трометамол, им требовалось гораздо меньше морфия (на 30-45 %), чем пациентам, получавшим плацебо.

Фармакокинетика.

После внутримышечного введения декскетопрофена трометамола максимальная концентрация достигается приблизительно через 20 минут (10-45 минут). Доказано, что при однократном внутримышечном или внутривенном введении 25-50 мг препарата площадь под кривой AUC («концентрация – время») пропорциональна дозе. Фармакокинетические исследования многократного применения препарата доказали, что AUC и C_{max} (среднее максимальное значение) после последнего внутримышечного и внутривенного введения не отличаются от показателей после однократного применения, что свидетельствует об отсутствии кумуляции лекарственного средства. Аналогично другим лекарственным средствам с высокой степенью связывания с белками плазмы крови (99 %), объем распределения декскетопрофена составляет в среднем 0,25 л/кг. Период полураспределения составляет примерно 0,35 часа, а период полувыведения – 1-2,7 часа. Метаболизм декскетопрофена в основном происходит путем конъюгации с глюкуроновой кислотой и последующим выведением почками. После введения декскетопрофена трометамола в моче обнаруживается только оптический изомер S-(+), что свидетельствует об отсутствии трансформации препарата в оптический изомер R-(-). После введения однократных и многократных доз степень влияния препарата на здоровых добровольцах пожилого возраста (от 65 лет), принимавших участие в исследовании, была значительно выше (до 55 %), чем на молодых добровольцах, однако статистически значимой разницы в максимальной концентрации и времени ее достижения не наблюдалось. Средний период полувыведения увеличивался (до 48 %), а определенный суммарный клиренс сокращался.

Клинические характеристики.

Показания.

Симптоматическое лечение острой боли средней и высокой интенсивности в случаях, когда пероральное применение препарата нецелесообразно, например, при послеоперационных болях, почечных коликах и боли в пояснице (боли в спине).

Противопоказания.

– Повышенная чувствительность к декскетопрофену, к любому другому нестероидному противовоспалительному средству (НПВС) или к вспомогательным веществам препарата;

- если вещества аналогичного действия, например, ацетилсалициловая кислота или другие НПВП провоцируют развитие приступов бронхиальной астмы, бронхоспазма, острого ринита или вызывают развитие носовых полипов, появление крапивницы или ангионевротического отека;
- в активной фазе язвенной болезни или при кровотечении, подозрении на них или при рецидивирующей язвенной болезни или кровотечении в анамнезе (не менее двух подтвержденных фактов язвы или кровотечения) или хроническая диспепсия;
- при желудочно-кишечном кровотечении, другом кровотечении в активной фазе или при повышенной кровоточивости;
- при желудочно-кишечном кровотечении или перфорации в анамнезе, связанных с предшествующей терапией НПВП;
- при болезни Крона или при неспецифическом язвенном колите;
- при бронхиальной астме в анамнезе;
- при тяжелой сердечной недостаточности;
- при нарушении функции почек средней или тяжелой степени (клиренс креатинина < 50 мл/мин);
- при тяжелом нарушении функции печени (10-15 баллов по шкале Чайлда-Пью);
- при геморрагическом диатезе и при других нарушениях свертываемости крови;
- в III триместре беременности и в период кормления грудью;
- применение с целью нейроаксиального (интратекального или эпидурального введения (из-за содержания этанола).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий.

Одновременное применение таких средств с НПВП не рекомендуется:

- другие НПВП, в том числе салицилаты в высоких дозах (≥ 3 г/сут). При одновременном применении нескольких НПВП повышается риск возникновения язвы в пищеварительном тракте и желудочно-кишечного кровотечения вследствие их взаимно усиливающего действия;

– антикоагулянты: НПВС усиливают действие антикоагулянтов, например, варфарина, вследствие высокой степени связывания декскетопрофена с белками плазмы крови, а также угнетение функции тромбоцитов и повреждения слизистой оболочки желудка и двенадцатиперстной кишки. Если одновременное применение необходимо, его следует проводить под пристальным наблюдением врача и соответствующих лабораторных показателей;

– гепарин: повышается риск развития кровотечений (из-за угнетения функции тромбоцитов и повреждения слизистой оболочки желудка и двенадцатиперстной кишки). Если одновременное применение необходимо, его следует проводить под пристальным наблюдением врача и соответствующих лабораторных показателей;

– кортикостероидные средства: повышается риск развития язвы в пищеварительном тракте и желудочно-кишечного кровотечения;

– литий (были сообщения для нескольких НПВП): НПВП повышают уровень лития в крови, что может привести к интоксикации (снижается выведение лития почками). Поэтому в начале применения декскетопрофена, при коррекции дозы или отмене препарата необходимо проконтролировать уровень лития в крови;

– метотрексат в высоких дозах (не менее 15 мг в неделю). За счет уменьшения почечного клиренса метотрексата на фоне применения НПВП в целом усиливается его негативное влияние на систему крови;

– производные гидантоина и сульфаниламиды: возможно усиление токсичности этих веществ.

Одновременное применение таких средств с НПВП требует осторожности:

– диуретические средства, ингибиторы ангиотензинпревращающего фермента (АПФ), антибактериальные аминогликозиды и антагонисты рецепторов ангиотензина II. Декскетопрофен снижает эффективность диуретических средств и других антигипертензивных средств. У некоторых пациентов с нарушением функции почек (например, при обезвоживании или у лиц пожилого возраста) применение средств, угнетающих циклооксигеназу, одновременно с ингибиторами АПФ, антагонистами рецепторов ангиотензина II или антибактериальными аминогликозидами может ухудшить функцию почек, что, как правило, является обратимым процессом. При применении декскетопрофена вместе с любым диуретическим средством следует убедиться в отсутствии обезвоживания у пациента, а в начале лечения необходимо контролировать функцию почек;

– метотрексат в низких дозах (менее 15 мг в неделю): за счет уменьшения почечного клиренса метотрексата на фоне применения НПВП усиливается

его негативное влияние на систему крови в целом. В первые недели одновременного применения необходимо еженедельно проводить анализ крови. Даже при незначительном нарушении функции почек, а также у пациентов пожилого возраста лечение следует проводить под строгим наблюдением врача;

– пентоксифиллин: существует риск кровотечения. Необходимо усилить контроль и чаще проверять показатель времени кровотечения;

– зидовудин: существует риск увеличения токсического воздействия на эритроциты за счет влияния на ретикулоциты, что после первой недели применения НПВП приводит к тяжелой анемии. В течение 1-2 недель после начала применения НПВП следует сделать анализ крови и проверить содержание ретикулоцитов;

– препараты сульфонилмочевины: НПВП способны усилить гипогликемическое действие этих средств за счет замещения препаратов сульфонилмочевины в соединениях с белками плазмы крови.

Следует учесть возможные взаимодействия при применении таких средств:

– бета-блокаторы: НПВП способны ослабить их гипотензивное действие за счет подавления синтеза простагландинов;

– циклоспорин и такролимус: возможно усиление нефротоксичности за счет влияния НПВП на почечные простагландины. При комбинированной терапии следует контролировать функцию почек;

– тромболитические средства: повышается риск кровотечения;

– антиагрегантные средства и селективные ингибиторы обратного захвата серотонина: повышается риск желудочно-кишечного кровотечения;

– пробенецид: возможно увеличение концентрации декскетопрофена в плазме крови, что, вероятно, обусловлено угнетением почечной канальцевой секреции и конъюгации препарата с глюкокуроновой кислотой и требует коррекции дозы декскетопрофена;

– сердечные гликозиды: НПВП способны увеличить концентрацию гликозидов в плазме крови;

– мифепристон: из-за теоретической вероятности снижения эффективности мифепристона под влиянием ингибиторов простагландинсинтетазы. НПВС следует назначать только через 8-12 суток после терапии мифепристоном;

– хинолон: результаты исследований на животных показали, что при применении производных хинолона в высоких дозах в сочетании с НПВС повышается риск развития судорог.

Особенности применения.

С осторожностью применять пациентам с аллергическими состояниями в анамнезе. Избегать применения препарата Дескет, раствор для инъекций 25 мг/мл в комбинации с другими НПВП, в том числе с селективными ингибиторами циклооксигеназы-2. Побочные реакции можно сократить за счет применения наименьшей эффективной дозы в течение как можно более короткого периода времени, необходимого для улучшения состояния.

Желудочно-кишечные кровотечения, образование язвы или ее перфорация, в некоторых случаях с летальным исходом, наблюдалось для всех НПВП на разных этапах лечения независимо от наличия симптомов-предвестников или наличия в анамнезе серьезной патологии со стороны пищеварительного тракта. При развитии желудочно-кишечного кровотечения препарат следует отменить. Риск возникновения желудочно-кишечного кровотечения, образование язвы или ее перфорация повышается с увеличением дозы НПВС у пациентов с язвой в анамнезе, особенно осложненной кровотечением или перфорацией, а также у пациентов пожилого возраста. У пациентов пожилого возраста повышенная частота побочных реакций НПВП, особенно возникновение желудочно-кишечного кровотечения и перфорации, иногда с летальным исходом. Лечение таких пациентов следует начинать с наименьшей возможной дозы. НПВС следует с осторожностью назначать пациентам с заболеваниями пищеварительного тракта в анамнезе, поскольку существует риск их обострения. Применение НПВП может приводить к рецидивам неспецифического язвенного колита, а также болезни Крона у пациентов, находящихся в фазе ремиссии. Перед началом применения декскетопрофена трометамола пациентам, которые имеют в анамнезе эзофагит, гастрит и/или язвенную болезнь, следует быть уверенным, что эти заболевания находятся в фазе ремиссии. У пациентов с имеющимися симптомами патологии пищеварительного тракта и с заболеваниями пищеварительного тракта в анамнезе в течение применения препарата необходимо контролировать состояние пищеварительного тракта на предмет возникновения возможных нарушений, особенно это касается желудочно-кишечного кровотечения.

Для таких пациентов и пациентов, принимающих ацетилсалициловую кислоту в малых дозах или другие средства, которые увеличивают риск возникновения побочных реакций со стороны пищеварительного тракта, следует рассмотреть возможность комбинированной терапии с

препаратами-протекторами, например, мизопростолом или ингибиторами протонной помпы.

Пациентам, особенно пожилого возраста, у которых в анамнезе побочные реакции со стороны пищеварительного тракта, необходимо известить врача про все необычные симптомы, связанные с пищеварительной системой, в том числе о желудочно-кишечных кровотечениях, особенно на начальных этапах лечения.

Следует с осторожностью назначать препарат пациентам, которые одновременно применяют средства, которые могут увеличить риск возникновения язвы или кровотечения, а именно – пероральные кортикостероидные средства, антикоагулянтные средства (например, варфарин), селективные ингибиторы обратного захвата серотонина или антиагрегантные средства, такие как аспирин.

Неселективные НПВП способны уменьшать агрегацию тромбоцитов и увеличивать время кровотечения за счет подавления синтеза простагландинов. Одновременное применение декскетопрофена трометамола и низкомолекулярного гепарина в профилактических дозах в послеоперационный период изучали в клинических исследованиях и влияния на показатели коагуляции не было обнаружено. Однако пациентам, которые применяют декскетопрофена трометамол одновременно с препаратами, влияющими на гемостаз, например, варфарин, другие кумариновые препараты или гепарин, необходимо находиться под тщательным наблюдением врача.

Пациентам с артериальной гипертензией и/или застойной сердечной недостаточностью легкой или средней тяжести следует находиться под наблюдением врача из-за возможной задержки жидкости в организме и появлений периферических отеков.

Согласно имеющимся клиническим и эпидемиологическим данным применение некоторых НПВП, особенно в высоких дозах и в течение длительного времени, может сопровождаться некоторым увеличением риска возникновения состояний, вызванных тромбозом артерий, например, инфарктом миокарда или инсультом. Данных для исключения декскетопрофена трометамола недостаточно.

При неконтролируемой артериальной гипертензии, застойной сердечной недостаточности, подтвержденной ишемической болезни сердца, заболевании периферических артерий и/или сосудов головного мозга декскетопрофена трометамол следует применять только после тщательной оценки состояния пациента. То же следует делать перед началом длительного лечения пациентам с факторами риска сердечно-сосудистых заболеваний, например, артериальная гипертензия, гиперлипидемия, сахарный диабет, курение.

Были сообщения об очень редких случаях развития серьезных кожных реакций (некоторые – с летальным исходом) на фоне применения НПВП, в том числе эксфолиативный дерматит, синдром Стивенса-Джонсона и токсический эпидермальный некролиз. Вероятно, наибольший риск их возникновения наблюдается у пациентов в начале лечения, у большинства пациентов они возникали в течение первого месяца терапии. При появлении кожных высыпаний, признаков поражения слизистых оболочек или других симптомов гиперчувствительности препарат Дескет, раствор для инъекций 25 мг/мл следует отменить. Как и все НПВП, препарат способен повышать уровень азота мочевины и креатинина в плазме крови. Подобно другим ингибиторам синтеза простагландинов его применение может сопровождаться побочными реакциями со стороны почек, что может привести к гломерулонефриту, интерстициальному нефриту, папиллярному некрозу, нефротическому синдрому и острой почечной недостаточности.

Как и другие НПВС, препарат может вызвать временное и незначительное повышение показателей некоторых печеночных проб, а также значительное повышение уровня АСТ и АЛТ. При соответствующем увеличении этих показателей лечение следует прекратить.

Следует с осторожностью назначать препарат пациентам с нарушением функции печени и/или почек, а также пациентам с артериальной гипертензией и/или застойной сердечной недостаточностью, поскольку у них на фоне применения НПВП возможно ухудшение функции почек, задержка жидкости в организме и появление периферических отеков. Из-за повышенного риска нефротоксичности препарат следует с осторожностью применять при лечении диуретическими средствами, а также пациентам, у которых возможно развитие гиповолемии.

Особую осторожность следует соблюдать при лечении пациентов с заболеваниями сердца в анамнезе, в частности с предыдущими эпизодами сердечной недостаточности, поскольку на фоне применения препарата повышается риск возникновения сердечной недостаточности.

Больше всего нарушений функции почек, сердечно-сосудистой системы и печени возникает у пациентов пожилого возраста.

Дескет, раствор для инъекций 25 мг/мл следует с осторожностью вводить пациентам с нарушением кроветворения, системной красной волчанкой и смешанными заболеваниями соединительной ткани.

Как и другие НПВС, декскетопрофена трометамол способен маскировать симптомы инфекционных заболеваний во время его применения. В изолированных случаях во время применения НПВС были сообщения об активизации инфекционных процессов, которые локализуются в мягких тканях. Таким образом, если во время применения появляются или

усиливаются симптомы бактериальной инфекции, пациентам рекомендуется немедленно обратиться к врачу.

Как и все другие НПВС, декскетопрофена трометамол может снижать женскую фертильность, поэтому не рекомендуется применять женщинам, планирующим беременность. Женщинам, которые имеют проблемы с зачатием или проходят обследование на предмет бесплодия, следует рассмотреть возможность отмены препарата. Назначение Дескета, раствора для инъекций 25 мг/мл в I и II триместрах беременности возможно в случаях крайней необходимости.

Каждая ампула препарата Дескет, раствор для инъекций 25 мг/мл содержит 200 мг этанола, что равно 5 мл пива или 2,08 вина на дозу. Препарат может негативно влиять на лиц, страдающих алкоголизмом. Содержание этанола следует учитывать при применении препарата в I и II триместрах беременности, детям и пациентам из группы риска, например, при заболеваниях печени, а также пациентам, больным эпилепсией. Лекарственное средство содержит менее 1 ммоль натрия (23 мг) на дозу, поэтому практически не содержит свободного натрия.

Применение в период беременности или кормления грудью.

Применение препарата Дескет, раствор для инъекций 25 мг/мл противопоказано в III триместре беременности и в период кормления грудью.

Угнетение синтеза простагландинов может негативно повлиять на беременность и/или развитие плода. Согласно результатам эпидемиологических исследований применение препаратов, подавляющих синтез простагландинов, на ранних сроках беременности увеличивает риск выкидыша, возникновения у плода порока сердца и несращения передней брюшной стенки. Так абсолютный риск развития аномалий сердечно-сосудистой системы увеличивался с < 1 % до около 1,5 %. Считается, что опасность возникновения таких явлений повышается с увеличением дозы препарата и продолжительности терапии. Применение ингибиторов синтеза простагландинов у животных вызывало увеличение пре- и постимплантационных потерь и повышение эмбриофетальной летальности. Кроме того, у животных, которым применяли ингибиторы синтеза простагландинов в период органогенеза, повышалась частота возникновения пороков развития плода, в том числе аномалий сердечно-сосудистой системы. Тем не менее, исследования декскетопрофена трометамола на животных не выявили токсичности по отношению к репродуктивным органам. Назначение декскетопрофена трометамола в I и II триместрах беременности возможно только при крайней необходимости. При назначении декскетопрофена трометамола женщинам, которые планируют беременность, или в I и II триместрах

беременности следует применять наименьшую возможную эффективную дозу в течение как можно более короткого срока лечения.

Во время III триместра все ингибиторы синтеза простагландинов вызывают следующее:

Риски для плода:

- кардиопульмональный токсический синдром (с закупоркой артериального протока и легочной гипертензией);
- нарушение функции почек, которое может прогрессировать до почечной недостаточности с развитием маловодия;

Риски для матери и ребенка в конце беременности:

- удлинение времени кровотечения (эффект подавления агрегации тромбоцитов), что возможно даже при условии применения низких доз;
- задержка сокращения матки с соответствующей задержкой родов и затяжными родами.

Данных о проникновении декскетопрофена в грудное молоко нет.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или другими механизмами.

На фоне применения препарата Дексет, раствор для инъекций 25 мг/мл возможно возникновение головокружения, сонливости и повышенной утомляемости, поэтому не исключается слабое или умеренное влияние на способность управлять автотранспортом или обслуживать другие механизмы. Пациенты должны это учитывать и объективно оценивать свою способность к выполнению таких работ.

Способ применения и дозы.

Взрослые. Рекомендуемая доза составляет 50 мг с интервалом 8-12 часов. При необходимости повторную дозу вводить через 6 часов. Максимальная суточная доза не должна превышать 150 мг. Препарат предназначен для кратковременного применения, поэтому его следует применять только в период острой боли (не более 2-х суток). Пациентов следует переводить на пероральное применение анальгетиков, если это возможно. Побочные реакции можно сократить за счет применения наименьшей эффективной дозы в течение как можно более короткого времени, необходимого для улучшения состояния. При послеоперационных болях средней или

сильной степени тяжести препарат можно применять по показаниям в тех же самых рекомендуемых дозах в сочетании с опиоидными анальгетиками.

Пациенты пожилого возраста. Корректировка дозы обычно не требуется. Однако из-за физиологического снижения функции почек рекомендуется низшая доза препарата, а именно – максимальная суточная доза составляет 50 мг при легком нарушении функции почек.

Нарушения со стороны печени. Для пациентов с патологией печени легкой и средней степенью тяжести (5-9 баллов по шкале Чайлда-Пью) следует уменьшить максимальную суточную дозу до 50 мг и тщательно контролировать функцию печени. При тяжелых заболеваниях печени препарат противопоказан (10-15 баллов по шкале Чайлда-Пью).

Нарушения со стороны почек. Для пациентов с нарушением функции почек легкой степени (клиренс креатинина 50-80 мл/мин) максимальную суточную дозу следует уменьшить до 50 мг. При нарушении функции почек средней или тяжелой степени (клиренс креатинина < 50 мл/мин) препарат противопоказан.

Дети и подростки. Препарат не следует применять детям и подросткам из-за отсутствия данных о его эффективности и безопасности.

Внутримышечное введение. Раствор для инъекций следует медленно вводить глубоко в мышцы.

Внутривенная инфузия.

Для проведения внутривенной инфузии содержимое ампулы 2 мл развести в 30-100 мл 0,9 % раствора натрия хлорида, растворе глюкозы или растворе Рингера-лактата. Раствор для инфузий следует готовить в асептических условиях, не допуская влияния естественного дневного света. Приготовленный раствор должен быть прозрачным. Инфузию необходимо проводить в течение 10-30 минут. Не допускать влияния естественного дневного света на приготовленный раствор.

Дескет, раствор для инъекций 25 мг/мл, разведенный в 100 мл 0,9 % раствора натрия хлорида или в растворе глюкозы можно смешивать с допамином, гепарином, гидроксизиним, лидокаином, морфином, петицином и теофиллином.

Дескет, раствор для инъекций 25 мг/мл нельзя смешивать в растворе для инфузий с прометазиним и пентазоцином.

Внутривенная инъекция (болусное введение).

При необходимости содержимое 1 ампулы (2 мл раствора для инъекций) вводить внутривенно в течение не менее 15 секунд.

Препарат можно смешивать в малых объемах (например, в шприце) с растворами для инъекций гепарина, лидокаина, морфина и теофиллина.

Дескет, раствор для инъекций 25 мг/мл нельзя смешивать в малых объемах (например, в шприце) с растворами допамина, прометазина, пентазоцина, петидина и гидрокортизона, потому что образуется белый осадок.

Препарат можно смешивать только с лекарственными средствами, которые указаны выше.

При внутримышечном или внутривенном инъекционном применении препарат следует немедленно ввести после того, как он был набран из ампулы. Раствор для внутривенной инфузии следует применять сразу после его приготовления.

При хранении разбавленных растворов препарата в полиэтиленовых пакетах или в приспособленных для введения изделиях из этилвинилацетата, пропионата целлюлозы, полиэтилена низкой плотности и поливинилхлорида изменений содержания действующего вещества вследствие сорбции не наблюдалось.

Препарат Дескет, раствор для инъекций 25 мг/мл предназначен для однократного применения, поэтому остатки готового раствора следует утилизировать. Перед введением препарата необходимо убедиться, что раствор прозрачный и бесцветный. Раствор, содержащий твердые частицы, применять нельзя.

Дети. Препарат не следует применять детям из-за отсутствия данных о его эффективности и безопасности.

Передозировка.

Симптоматика передозировки неизвестна. Аналогичные лекарственные средства вызывают нарушения со стороны пищеварительного тракта (рвота, анорексия, боль в животе) и нервной системы (сонливость, головокружение, дезориентация, головная боль). При случайной передозировке следует немедленно начать симптоматическое лечение в соответствии с состоянием пациента. Декскетопрофена трометамол выводится из организма с помощью диализа.

Побочные реакции.

В нижеприведенной таблице 1 указаны распределенные по органам, системам органов и частоте возникновения побочные действия, связь которых с декскетопрофена трометамолом признана как минимум возможной.

Таблица 1

Органы и системы органов	Часто (от 1/100 до 1/10)	Иногда (от 1/1000 до 1/100)	Редко (от 1/10000 до 1/1000)	Очень редко (менее 1/10000)
Со стороны крови/лимфатической системы	–	Анемия	–	Нейтропения, тромбоцитопения
Со стороны иммунной системы	–	–	Отек гортани	Анафилактические реакции, анафилактический шок
Нарушение питания и обмена веществ	–	–	Гипергликемия, гипогликемия, гипертриглицеридемия, анорексия, отсутствие аппетита	
Психические нарушения	–	Бессонница, беспокойство	–	
Со стороны нервной системы	–	Головная боль, головокружение, сонливость	Парестезии, обморок	

Со стороны органов зрения	–	Нечеткость зрения	–	
Со стороны органов слуха	–	Вертиго	Звон в ушах	
Со стороны сердца	–	Пальпитация	Экстрасистолия, тахикардия	
Со стороны сосудистой системы	–	Артериальная гипотензия, приливы	Артериальная гипертензия, тромбофлебит поверхностных вен	

Со стороны дыхательных путей, органов грудной клетки и средостения	—	—	Брадипное
Со стороны пищеварительного тракта	Тошнота, рвота	Боль в животе, диспепсия, диарея, запор, рвота с примесью крови, сухость во рту	Язвенная болезнь, кровотечение или перфорация
Со стороны гепатобилиарной системы	—	—	Гепатит, желтуха
Со стороны кожи и подкожной клетчатки	—	Дерматиты, зуд, сыпь, повышенное потоотделение	Крапивница, угри
Со стороны опорно-двигательного аппарата и соединительной ткани	—	—	Ригидность мышц, скованность в суставах, мышечные судороги, боль в спине
Со стороны почек и мочевыводящих путей	—	—	Острая почечная недостаточность, полиурия, кетонурия, протеинурия
Со стороны репродуктивной системы	—	—	Менструальные нарушения, нарушения функции предстательной железы
Общие и местные нарушения	Боль в месте инъекции, реакции в месте инъекции, в том числе воспаление,	Лихорадка, повышенная утомляемость, боли, озноб,	Дрожь, периферические отеки

	гематома, кровотечение	астения, недомогание	
Исследования	—	—	Отклонение в печеночных пробах

Нарушения со стороны пищеварительного тракта наблюдались чаще всего.

Возможно развитие язвенной болезни, перфорации или желудочно-кишечного кровотечения, иногда с летальным исходом, особенно у пациентов пожилого возраста. По имеющимся данным, на фоне применения препарата может возникать тошнота, рвота, диарея, метеоризм, запор, диспептические явления, боль в животе, мелена, рвота с примесью крови, язвенный стоматит, обострение колита и болезни Крона. Реже наблюдается гастрит. Также отмечались отеки, артериальная гипертензия и сердечная недостаточность, которые могут быть вызваны приемом НПВС. Как и в случае применения других НПВП, возможны такие побочные реакции: асептический менингит, который в целом возникает у пациентов, больных системной красной волчанкой или смешанными заболеваниями соединительной ткани, и реакции со стороны крови (пурпура, апластическая и гемолитическая анемия, редко – агранулоцитоз и гипоплазия костного мозга). Возможны буллезные реакции, в том числе синдром Стивенса-Джонсона и токсический эпидермальный некролиз (очень редко).

Согласно результатам клинических исследований и эпидемиологических данных, применение некоторых НПВП, особенно в высоких дозах и в течение длительного времени, может сопровождаться некоторым увеличением риска развития патологии, вызванным тромбозом артерий, например, инфаркта миокарда и инсульта.

Срок годности. 2 года.

Условия хранения. Для защиты от света, хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С. После разведения раствор хранят на протяжении 24 часов при температуре от 2 до 8 °С. Хранить в недоступном для детей месте.

Несовместимость.

Дескет, раствор для инъекций 25 мг/мл нельзя смешивать в малых объемах (например, в шприце) с растворами допамина, прометазина, пентазоцина, петидина и гидрокортизона, так как образуется белый осадок.

Разбавленные растворы для инфузий, полученные, как указано в разделе «Внутривенные инфузии», нельзя смешивать с прометазинном или пентазоцином.

Упаковка.

По 2 мл в ампуле, по 5 ампул в блистере, по 1 или 2 блистера в пачке.

Категория отпуска. По рецепту.

Производитель. Частное акционерное общество «Лекхим-Харьков».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности.

Украина, 61115, Харьковская обл., город Харьков, улица Северина Потоцкого, дом 36.