Эторикоксиб-Тева



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Эторикоксиб

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Форма выпуска, описание и состав

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой светло-зеленого цвета, круглые, двояковыпуклые, с гравировкой "120" на одной стороне, другая сторона гладкая.

	1 таб.
эторикоксиб	120 мг

Вспомогательные вещества: кальция гидрофосфат безводный - 152.8 мг, целлюлоза микрокристаллическая PH101 - 43.6 мг, целлюлоза микрокристаллическая PH 102 - 43.6 мг, кросповидон типа A - 24 мг, повидон K25 - 12 мг, магния стеарат - 4 мг.

Состав пленочной оболочки: Aquapolish P зеленый 074.25 MS; (гипромеллоза- 6 мг; гидроксипропилцеллюлоза (гипролоза)- 0.6 мг; тальк- 1.818 мг; триглицериды среднецепочечные- 0.6 мг; титана диоксид (E171)- 2.76 мг; алюминиевый лак на основе красителя бриллиантовый голубой (E133)- 0.024 мг; алюминиевый лак на основе индигокармина (E132)- 0.048 мг; краситель оксид железа желтый (E172)- 0.102 мг; краситель оксид железа черный (E172)- 0.048 мг.)

2 шт. - блистеры из фольги (1) - пачки картонные.
7 шт. - блистеры из фольги (1) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры из фольги (1) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры из фольги (2) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры из фольги (4) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры из фольги (7) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

НПВС. Селективный ингибитор ЦОГ-2, в терапевтических концентрациях блокирует образование простагландинов и оказывает противовоспалительное, анальгезирующее и жаропонижающее действие. Селективное угнетение ЦОГ-2 сопровождается уменьшением выраженности клинических симптомов, связанных с воспалительным процессом, при этом отсутствует влияние на функцию тромбоцитов и слизистую оболочку ЖКТ.

Эторикоксиб обладает дозозависимым эффектом ингибирования ЦОГ-2, не оказывая влияние на ЦОГ-1 при применении в суточной дозе до 150 мг. Не оказывает влияния на выработку простагландинов в слизистой оболочке

желудка и на время кровотечения. В проведенных исследованиях не наблюдалось снижения уровня арахидоновой кислоты и агрегации тромбоцитов, вызываемой коллагеном.

Фармакокинетика

После приема внутрь быстро абсорбируется из ЖКТ. Биодоступность при приеме внутрь составляет около 100%. После приема взрослыми натощак в дозе 120 мг C_{max} составляет 3.6 мкг/мл, T_{max} - 1 ч после приема. Прием пищи не оказывает существенного влияния на выраженность и скорость абсорбции эторикоксиба при приеме в дозе 120 мг. Вместе с тем значения C_{max} снижаются на 36% и T_{max} увеличивается на 2 ч. Средняя геометрическая величина AUC_{0-24} составила 37.8 мкг × ч/мл. Фармакокинетика эторикоксиба в пределах терапевтических доз носит линейный характер.

Связывание с белками плазмы превышает 92%. V_d в равновесном состоянии составляет около 120 л. Эторикоксиб проникает через плацентарный и ГЭБ.

Интенсивно метаболизируется в печени, с участием изоферментов цитохрома P450 и образованием 6-гидроксиметил-эторикоксиба. Обнаружено 5 метаболитов эторикоксиба, основные - 6-гидроксиметил-эторикоксиб и его производное - 6-карбокси-ацетил-эторикоксиб. Основные метаболиты не влияют на ЦОГ-1 и совсем неактивны либо малоактивны в отношении ЦОГ-2.

Выводится почками в виде метаболитов. Менее 1% выводится с мочой в неизмененном виде.

При однократном в/в введении 70% выводится почками, 20% - через кишечник, преимущественно в виде метаболитов. Менее 2% обнаружено в неизмененном виде.

Равновесное состояние достигается через 7 сут при ежедневном приеме в дозе 120 мг, с коэффициентом кумуляции около 2, что соответствует $T_{1/2}$ - около 22 ч. Плазменный клиренс составляет приблизительно 50 мл/мин.

У пациентов с незначительными нарушениями функции печени (5-6 баллов по шкале Чайлд-Пью) однократный прием эторикоксиба в дозе 60 мг/сут сопровождался увеличением AUC на 16% по сравнению со здоровыми лицами.

У пациентов с умеренным нарушением функции печени (7-9 баллов по шкале Чайлд-Пью), принимавших препарат в дозе 60 мг через день, значение AUC было таким же, как у здоровых лиц, принимавших препарат ежедневно в той же дозе.

Гемодиализ незначительно влиял на выведение (клиренс диализа - около 50 мл/мин).

Показания к применению:

Симптоматическая терапия остеоартроза, ревматоидного артрита, анкилозирующего спондилита; боль и симптомы воспаления, связанные с острым подагрическим артритом; краткосрочное лечение боли, связанной с проведением стоматологической операции.

Относится к болезням:

- Артрит
- Артроз
- Воспаление
- Остеоартрит
- Остеоартроз
- Подагра
- Стоматит

Противопоказания:

Полное или неполное сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза носа или околоносовых пазух и непереносимости ацетилсалициловой кислоты и других НПВП (в т.ч. в анамнезе).

Эрозивно-язвенные изменения слизистой оболочки желудка или двенадцатиперстной кишки, активное желудочно-кишечное кровотечение, цереброваскулярное или иное кровотечение.

Воспалительные заболевания кишечника (болезнь Крона, неспецифический язвенный колит) в фазе обострения.

Гемофилия и другие нарушения свертываемости крови.

Выраженная сердечная недостаточность (II-IV функциональные классы по классификации NYHA).

Выраженная печеночная недостаточность (более 9 баллов по шкале Чайлд-Пью) или активное заболевание печени.

Почечная недостаточность тяжелой степени (КК менее 30 мл/мин), прогрессирующие заболевания почек, подтвержденная гиперкалиемия.

Период после проведения аортокоронарного шунтирования; заболевания периферических артерий, цереброваскулярные заболевания, клинически выраженная ИБС.

Устойчивая артериальная гипертензия при значениях АД более 140/90 мм рт. ст.

Беременность, период лактации (грудного вскармливания).

Детский и подростковый возраст до 16 лет.

Повышенная чувствительность к эторикоксибу.

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь в дозе 60-120 мг 1 раз/сут.

У пациентов с печеночной недостаточностью (5-9 баллов по шкале Чайлд-Пью) рекомендуется не превышать суточную дозу 60 мг.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: часто - эпигастральная боль, тошнота, диарея, диспепсия, метеоризм; иногда - вздутие живота, отрыжка, усиление перистальтики, запор, сухость слизистой оболочки полости рта, гастрит, язва слизистой оболочки желудка или двенадцатиперстной кишки, синдром раздраженного кишечника, эзофагит, язвы слизистой оболочки полости рта, рвота; очень редко - язвы ЖКТ (с кровотечением или перфорацией), гепатит.

Со стороны нервной системы: часто - головная боль, головокружение, слабость; иногда - нарушение вкуса, сонливость, нарушения сна, нарушения чувствительности, в т.ч. парестезии/гиперестезии, тревога, депрессия, нарушения концентрации; очень редко - галлюцинации, спутанность сознания.

Со стороны органов чувств: иногда - нечеткость зрения, конъюнктивит, шум в ушах, вертиго.

Со стороны мочевыделительной системы: иногда - протеинурия; очень редко - почечная недостаточность, обычно обратимая при отмене препарата.

Аллергические реакции: очень редко - анафилактические/анафилактоидные реакции, включая выраженное снижение АД и шок.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - сердцебиение, повышение АД; иногда - приливы, нарушение мозгового кровообращения, фибрилляция предсердий, застойная сердечная недостаточность, неспецифические изменения ЭКГ, инфаркт миокарда; очень редко - гипертонический криз.

Со стороны дыхательной системы: иногда - кашель, одышка, носовое кровотечение; очень редко - бронхоспазм.

Дерматологические реакции: часто - экхимозы; иногда - отечность лица, кожный зуд, сыпь; очень редко - крапивница, синдром Стивенса-Джонсона, синдром Лайелла.

Инфекционные осложнения: иногда - гастроэнтерит, инфекции верхних отделов дыхательных путей, мочевыводящего тракта.

Со стороны костно-мышечной системы: иногда - мышечные судороги, артралгия, миалгия.

Со стороны обмена веществ: часто - отеки, задержка жидкости; иногда - изменения аппетита, повышение массы тела.

Со стороны лабораторных исследований: часто - повышение активности печеночных трансаминаз; иногда - повышение азота в крови и моче, повышение активности КФК, снижение гематокрита, снижение гемоглобина, гиперкалиемия, лейкопения, тромбоцитопения, повышение креатинина сыворотки, повышение мочевой кислоты; редко - повышение натрия в сыворотке крови.

Прочие: часто - гриппоподобный синдром; иногда - боли в грудной клетке.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат противопоказан при беременности и в период лактации. Эторикоксиб может отрицательно влиять на

женскую фертильность и не рекомендуется женщинам, планирующим беременность.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

У больных, получающих варфарин, прием эторикоксиба в дозе 120 мг/сут сопровождался увеличением примерно на 13% МНО и протромбинового времени. У пациентов, получающих варфарин или аналогичные лекарственные средства, следует контролировать показатели МНО во время начала терапии или изменения режима дозирования эторикоксиба, особенно в первые несколько дней.

Имеются сообщения о том, что неселективные НПВС и селективные ингибиторы ЦОГ-2 способны ослаблять гипотензивный эффект ингибиторов АПФ. Это взаимодействие следует принимать во внимание при лечении больных, принимающих эторикоксиб одновременно с ингибиторами АПФ. У пациентов с нарушениями функции почек (например, при дегидратации или в пожилом возрасте) подобная комбинация может усугубить функциональную недостаточность почек.

Эторикоксиб можно применять одновременно с ацетилсалициловой кислотой в низких дозах, предназначенных для профилактики сердечно-сосудистых заболеваний. Однако одновременное назначение ацетилсалициловой кислоты в низких дозах и эторикоксиба может привести к увеличению частоты язвенного поражения ЖКТ и других осложнений по сравнению с приемом одного эторикоксиба. После достижения равновесного состояния прием эторикоксиба в дозе 120 мг 1 раз/сут не оказывает влияния на антитромбоцитарную активность ацетилсалициловой кислоты в низких дозах (81 мг/сут). Препарат не заменяет профилактического действия ацетилсалициловой кислоты при сердечно-сосудистых заболеваниях. Циклоспорин и такролимус повышают риск развития нефротоксичности на фоне приема эторикоксиба.

Имеются данные о том, что неселективные НПВС и селективные ингибиторы ЦОГ-2 могут повышать концентрацию лития в плазме. Это взаимодействие следует принимать во внимание при лечении больных, принимающих эторикоксиб одновременно с литием.

Имеются данные о повышении концентрации метотрексата в плазме на 28% (по AUC) и снижении его почечного клиренса на 13% под влиянием эторикоксиба.

Прием эторикоксиба в дозе 120 мг с пероральными контрацептивами, содержащими 35 мкг этинилэстрадиола и от 0.5 до 1 мг норэтиндрона в течение 21 дня, одновременно или с разницей в 12 ч увеличивает стационарную AUC_{0-24} этинилэстрадиола на 50-60%. Однако концентрация норэтистерона обычно не увеличивается до клинически значимой степени. Это увеличение концентрации этинилэстрадиола следует принимать во внимание при выборе соответствующего перорального контрацептива для одновременного применения с эторикоксибом. Подобный факт может приводить к увеличению частоты тромбоэмболии, за счет увеличения экспозиции этинилэстрадиола.

Эторикоксиб не влияет на AUC_{0-24} в равновесном состоянии или элиминацию дигоксина. Вместе с тем, эторикоксиб повышает C_{max} (в среднем на 33%), что может иметь значение при развитии передозировки дигоксина.

Одновременный прием эторикоксиба и рифампицина (мощного индуктора печеночного метаболизма) приводит к снижению на 65% AUC эторикоксиба в плазме. Это взаимодействие следует учитывать при одновременном назначении эторикоксиба с рифампицином.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применяют при указаниях в анамнезе на язвенные поражения ЖКТ, инфекции Helicobacter pylori, у лиц пожилого возраста, у пациентов, длительно получавших НПВС, при тяжелых соматических заболеваниях, дислипидемии/гиперлипидемии, при сахарном диабете, артериальной гипертензии, отеках и задержке жидкости, курении, у пациентов с КК менее 60 мл/мин, при сопутствующей терапии следующими лекарственными средствами: антикоагулянтами (например, варфарином), антиагрегантами (например, ацетилсалициловой кислотой, клопидогрелом), ГКС (например, преднизолоном), селективными ингибиторами обратного захвата серотонина (например, циталопрамом, флуоксетином, пароксетином, сертралином), при хроническом алкоголизме.

В период лечения требуется тщательный контроль АД в течение первых 2 недель и периодически в дальнейшем.

В период лечения следует регулярно контролировать показатели функции печени и почек. В случае повышения активности печеночных трансаминаз в 3 раза и более относительно ВГН, лечение следует прекратить.

Учитывая возрастание риска развития нежелательных эффектов с увеличением продолжительности приема необходимо периодически оценивать необходимость продолжения лечения и возможность снижения дозы.

Не следует применять одновременно с другими НПВС.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты

психомоторных реакций. Пациенты, у которых отмечались эпизоды головокружений, сонливости или слабости, должных воздержаться от занятий, требующих концентрации внимания.

Источник: http://drugs.thead.ru/Etorikoksib-Teva