

## Костарокс



### **Код АТХ:**

- [M01AH05](#)

### **Международное непатентованное название (Действующее вещество):**

- [Эторикоксиб](#)

### **Полезные ссылки:**

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#)  
[Госреестр<sup>МНН</sup>](#) [Википедия<sup>МНН</sup>](#)  
[РЛС](#) [VIDAL](#) [Mail.Ru](#)

### **Форма выпуска:**

#### **Форма выпуска, описание и состав**

**Таблетки, покрытые пленочной оболочкой** светло-зеленого цвета, круглые, двояковыпуклые.

	<b>1 таб.</b>
эторикоксиб	120 мг

Вспомогательные вещества: кальция гидрофосфат безводный - 52 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 51 мг, повидон К30 - 12 мг, магния стеарат - 2 мг, кроскармеллоза натрия - 3 мг.

*Состав оболочки таблетки:* Опадрай II зеленый 32K510003 - 3 мг: гипромеллоза 15 cPs 3.2 мг, лактозы моногидрат 2.24 мг, титана диоксид 1.776 мг, триацетин 0.64 мг, индигокармин алюминиевый лак (3-5 %) 0.04 мг, железа оксид желтый 0.104 мг.

- 7 шт. - блистеры Ал/Ал (1) - пачки картонные.
- 10 шт. - блистеры Ал/Ал (1) - пачки картонные.
- 10 шт. - блистеры Ал/Ал (2) - пачки картонные.
- 10 шт. - блистеры Ал/Ал (3) - пачки картонные.
- 10 шт. - блистеры Ал/Ал (5) - пачки картонные.
- 10 шт. - блистеры Ал/Ал (6) - пачки картонные.
- 10 шт. - блистеры Ал/Ал (9) - пачки картонные.
- 10 шт. - блистеры Ал/Ал (10) - пачки картонные.
- 14 шт. - блистеры Ал/Ал (1) - пачки картонные.
- 14 шт. - блистеры Ал/Ал (2) - пачки картонные.
- 14 шт. - блистеры Ал/Ал (4) - пачки картонные.
- 14 шт. - блистеры Ал/Ал (6) - пачки картонные.
- 14 шт. - блистеры Ал/Ал (7) - пачки картонные.

### **Фармакотерапевтическая группа:**

- [Ненаркотические анальгетики, включая нестероидные и другие противовоспалительные средства](#)

## 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 влияния 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 неизменном виде.

При однократном в/в введении 70% выводится почками, 20% - через кишечник, преимущественно в виде метаболитов. Менее 2% обнаружено в неизменном 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/анафлактоидные 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, планиующим 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<sub>0-24</sub> 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 тромбозов, за счет увеличения экспозиции этинилэстрадиола.

Эторикоксиб не влияет на AUC<sub>0-24</sub> в равновесном состоянии или элиминацию дигоксина. Вместе с тем, эторикоксиб повышает C<sub>max</sub> (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.

## **Костарокс**

Фармакологическая база данных (<http://drugs.thead.ru>)

---

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, должны воздержаться от занятий, требующих концентрации внимания.

**Источник:** <http://drugs.thead.ru/Kostaroks>