Ксефокам (лиофилизат)



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Лорноксикам

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Лиофилизат для приготовления раствора для в/в и в/м введения в виде плотной массы желтого цвета; приложенный растворитель - прозрачная бесцветная жидкость.

	1 фл.
лорноксикам	8 мг

Вспомогательные вещества: маннитол (Е421) - 100 мг, трометамол - 12 мг, динатрия эдетат - 0.2 мг.

Растворитель: вода д/и - 2 мл.

Флаконы темного стекла (1) в комплекте с растворителем (амп. 1 шт.) - поддоны пластиковые (1) - пачки картонные.
Флаконы темного стекла (5) - пачки картонные.
Флаконы темного стекла (10) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

НПВС. Оказывает выраженное анальгезирующее и противовоспалительное действие.

Лорноксикам обладает сложным механизмом действия, в основе которого лежит подавление синтеза простагландинов, обусловленное угнетением активности изоферментов ЦОГ. Ингибирование ЦОГ приводит к десенсибилизации периферических болевых рецепторов и, соответственно, к ингибированию воспаления. Кроме того, лорноксикам угнетает высвобождение свободных радикалов кислорода из активированных лейкоцитов. Анальгезирующий эффект лорноксикама не связан с опиатоподобным влиянием на ЦНС и, в отличие от наркотических анальгетиков, лорноксикам не угнетает дыхания, не вызывает лекарственной зависимости.

Лорноксикам не влияет на жизненные показатели: температуру тела, частоту дыхания, ЧСС, АД, показатели ЭКГ, спирометрию.

Фармакокинетика

Всасывание

При в/м введении C_{max} лорноксикама в плазме достигается примерно через 0.4 ч. Абсолютная биодоступность (рассчитанная по величине AUC) после в/м введения составляет 97%.

Распределение

Связывание с белками плазмы составляет 99% и не зависит от концентрации.

Метаболизм и выведение

Лорноксикам присутствует в плазме в неизмененном виде, а также в форме гидроксилированного метаболита, который не обладает фармакологической активностью.

$T_{1/2}$ в среднем составляет 3-4 ч. Лорноксикам полностью метаболизируется, примерно 1/3 метаболитов выводится почками и 2/3 путем метаболизма в печени.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

У пациентов пожилого возраста и у пациентов с нарушениями функции печени и почек не обнаружено значимых изменений фармакокинетики лорноксикама.

Показания к применению:

— кратковременная терапия острых болей от легких до умеренно сильных.

Противопоказания:

— полное или неполное сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза носа или околоносовых пазух и непереносимости ацетилсалициловой кислоты и других НПВС (в т.ч. в анамнезе);

— тромбоцитопения;

— геморрагический диатез или нарушения свертываемости крови, а также после проведения операций, сопряженных с риском кровотечения или неполного гемостаза;

— период после проведения аортокоронарного шунтирования;

— эрозивно-язвенные изменения слизистой желудка или двенадцатиперстной кишки, активное желудочно-кишечное кровотечение; цереброваскулярное или иное кровотечение;

— рецидивирующая язва желудка или повторные кровотечения из ЖКТ;

— данные о предшествующих кровотечениях из ЖКТ, связанных с приемом НПВС;

— воспалительные заболевания кишечника (болезнь Крона, НЯК) в фазе обострения;

— сердечная недостаточность в стадии декомпенсации;

— печеночная недостаточность или активное заболевание печени;

— выраженная почечная недостаточность (содержание сывороточного креатинина более 300 мкмоль/л), прогрессирующие заболевания почек, подтвержденная гиперкалиемия, гиповолемия или обезвоживание;

— беременность;

— период грудного вскармливания;

— детский и подростковый возраст до 18 лет (из-за отсутствия клинических данных по применению препарата у этой возрастной группы);

— повышенная чувствительность/аллергия к компонентам препарата.

С *осторожностью*

Эрозивно-язвенные поражения и кровотечения из ЖКТ (в анамнезе), умеренно выраженная почечная недостаточность, состояния после хирургических вмешательств, возраст старше 65 лет, артериальная гипертензия, ИБС, хроническая сердечная недостаточность, цереброваскулярные заболевания, дислипидемия/гиперлипидемия, сахарный диабет, заболевания периферических артерий, курение, КК менее 60 мл/мин, язвенные поражения ЖКТ в анамнезе, наличие инфекции Helicobacter pylori, длительное применение НПВС, алкоголизм, тяжелые соматические заболевания; одновременный прием пероральных ГКС (в т.ч. преднизолона), антикоагулянтов (в т.ч. варфарина), антиагрегантов (в т.ч. клопидогрела), селективных ингибиторов обратного захвата серотонина (в т.ч. циталопрама, флуоксетина, пароксетина, сертралина), мочегонных средств, препаратов с известным или предположительным

нефротоксическим действием.

Одновременное лечение НПВС и такролимусом может увеличивать риск возникновения нефротоксичности.

Одновременное применение НПВС и гепарина в сочетании со спинальной или эпидуральной анестезией, увеличивают риск возникновения спинальных/эпидуральных гематом.

Способ применения и дозы:

Препарат применяют парентерально.

При *послеоперационных болях* препарат вводят в/м или в/в, при *остром приступе люмбаго/ишалгии* - в/м.

Начальная доза может составлять 8 мг или 16 мг. При недостаточном анальгезирующем эффекте препарата в дозе 8 мг можно дополнительно ввести такую же дозу.

Поддерживающая терапия: по 8 мг 2 раза/сут.

Максимальная суточная доза составляет 16 мг.

Препарат следует применять в минимальной эффективной дозе минимально возможным коротким курсом.

Раствор для инъекций готовят непосредственно перед использованием путем растворения содержимого одного флакона (8 мг порошка Ксефокам) водой для инъекций (2 мл). После приготовления раствора иглу заменяют.

В/м инъекции делают длинной иглой.

Приготовленный таким образом раствор вводят в/в или в/м. Длительность в/в введения раствора должна составлять не менее 15 сек, в/м - не менее 5 сек.

Побочное действие:

При лечении НПВС наиболее часто встречаются побочные реакции со стороны ЖКТ; возможно появление отеков, артериальной гипертензии и сердечной недостаточности. Применение таких препаратов, возможно, связано с небольшим повышением риска появления артериальных тромботических явлений.

При применении Ксефокама могут возникать следующие побочные эффекты.

Инфекции и паразитарные заболевания: редко - фарингит.

Со стороны системы кроветворения: редко - анемия, тромбоцитопения, лейкопения.

Со стороны свертывающей системы крови: редко - увеличение времени кровотечения; очень редко - геморрагическая сыпь.

Со стороны иммунной системы: редко - гиперчувствительность.

Со стороны обмена веществ: иногда - анорексия, изменение массы тела.

Со стороны психики: иногда - бессонница, депрессия; редко - спутанность сознания, нервозность, возбуждение.

Со стороны нервной системы: часто - легкие и преходящие головные боли, головокружение; редко - сонливость, парестезия, нарушение вкуса, искажение вкусовых восприятий, тремор, мигрень.

Со стороны органа зрения: иногда - конъюнктивит; редко - расстройство зрения.

Со стороны органа слуха и лабиринта: иногда - головокружение, шум в ушах.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: иногда - учащенное сердцебиение, тахикардия, отеки, сердечная недостаточность, приливы, отеки; редко - артериальная гипертензия, кровотечения, гематомы.

Со стороны дыхательных путей: иногда - ринит; редко - одышка, кашель, бронхоспазм.

Со стороны пищеварительной системы: часто (≥1% и <10%) - боль в животе, диарея, тошнота, рвота, диспепсия; иногда - запор, метеоризм, отрыжка, сухость во рту, гастрит, язва желудка, боли в эпигастральной области, язва двенадцатиперстной кишки, изъязвление полости рта; редко (<1%) - дисфагия, эзофагит, стоматит, дегтеобразный стул, кровавая рвота, рефлюкс, афтозный стоматит, глоссит, пептическая язва с прободением.

Со стороны печени и желчного пузыря: иногда - увеличение показателей функции печени; редко - нарушения

функции печени; очень редко - гепатоцеллюлярные нарушения.

Со стороны кожных покровов и подкожной клетчатки: иногда - кожная сыпь, кожный зуд, гипергидроз, эритематозная сыпь, крапивница, алопеция; редко - дерматит, геморрагическая сыпь; очень редко (<1/10 000) - отеки и буллезные реакции, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз.

Со стороны костно-мышечной системы: иногда - артралгия; редко - боли в костях, мышечные спазмы, миалгия.

Со стороны мочевыделительной системы: редко - никтурия, нарушение мочеиспускания, увеличение показателей в крови азота мочевины и креатинина.

Общие реакции: иногда - недомогание, отек лица; редко - астения.

Местные реакции: гиперемия, болезненность в месте введения.

Передозировка:

В настоящее время нет данных о передозировке Ксефокама, которые позволяли бы установить ее последствия или предположить специфические меры их устранения.

Симптомы: предполагаются более частые и тяжелые побочные эффекты со стороны ЖКТ, ЦНС и признаки почечной недостаточности. Серьезными симптомами являются атаксия, судороги, поражения функции печени и почек, возможно нарушение коагуляции.

Лечение: при подозрении на передозировку введение Ксефокама необходимо прекратить. Благодаря тому, что $T_{1/2}$ лорноксикама составляет около 4 ч, он быстро экскретируется из организма. Лорноксикам невозможно удалить из организма с помощью диализа. В настоящее время специфического антидота не существует. Следует применять обычные неотложные меры и проводить симптоматическое лечение.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Ксефокам противопоказан к применению при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

Применение препарата может отрицательно влиять на женскую фертильность и не рекомендуется женщинам, планирующим беременность.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении препарата Ксефокам с циметидином повышается концентрация лорноксикама в плазме. Взаимодействие с ранитидином и антацидными препаратами не выявлено.

При одновременном применении препарата Ксефокам с антикоагулянтами или ингибиторами агрегации тромбоцитов возможно увеличение времени кровотечения и повышение риска кровотечения (необходим контроль МНО).

Одновременное применение с фенпрокумоном уменьшает его эффективность.

При одновременном применении НПВС и гепарина в сочетании со спинальной/эпидуральной анестезией увеличивается риск возникновения спинальных или эпидуральных гематом.

При одновременном применении Ксефокама уменьшается гипотензивный эффект бета-адреноблокаторов и ингибиторов АПФ.

Ксефокам уменьшает мочегонный эффект и гипотензивное действие диуретиков.

Ксефокам снижает почечный клиренс дигоксина.

При одновременном применении с антибиотиками группы хинолонов повышается риск развития судорожного синдрома.

При одновременном применении с другими НПВС или ГКС повышается риск кровотечения из ЖКТ.

Ксефокам повышает концентрацию метотрексата в сыворотке.

При одновременном применении с селективными ингибиторами обратного захвата серотонина (например, циталопрам, флуоксетин, пароксетин, сертралин) повышается риск кровотечений из ЖКТ.

Ксефокам способен вызывать увеличение C_{max} лития в плазме и, тем самым, усиливать известные побочные эффекты

лития.

Ксефокам повышает нефротоксичность циклоспорина.

Ксефокам способен усиливать гипогликемический эффект производных сульфонилмочевины.

При одновременном применении Ксефокама с кортикотропином, препаратами калия, алкоголем повышается риск побочных эффектов со стороны ЖКТ.

При одновременном применении Ксефокама с цефамандолом, цефоперазоном, цефотетаном, вальпроевой кислотой увеличивается риск кровотечения.

При одновременном применении с такролимусом повышается риск нефротоксичности.

Особые указания и меры предосторожности:

Риск ульцерогенного действия препарата можно уменьшить путем одновременного назначения ингибиторов протонового насоса и синтетических аналогов простагландинов. В случае возникновения кровотечения из ЖКТ прием препарата необходимо сразу же прекратить и принять соответствующие неотложные меры. Особенно внимательно необходимо наблюдать за состоянием тех пациентов с желудочно-кишечной патологией, которые впервые получают курс лечения препаратом Ксефокам.

Как и другие оксикамы, препарат Ксефокам угнетает агрегацию тромбоцитов, поэтому возможно увеличение времени кровотечения. При применении препарата необходимо строго контролировать состояние пациентов, нуждающихся в абсолютно нормальном функционировании свертывающей системы крови (например, больных, которым предстоит хирургическое вмешательство), имеющих нарушения системы свертывания крови или же получающих лекарственные средства, угнетающие свертывание (включая гепарин в низких дозах), для того, чтобы своевременно обнаружить признаки кровотечения.

При появлении признаков поражения печени (кожный зуд, желтушность кожных покровов, тошнота, рвота, боли в животе, потемнение мочи, повышение уровня печеночных трансаминаз) следует прекратить прием препарата и обратиться к лечащему врачу.

Не следует применять препарат одновременно с другими НПВС.

Препарат способен изменять свойства тромбоцитов, однако не заменяет профилактического действия ацетилсалициловой кислоты при сердечно-сосудистых заболеваниях.

Пациентам с нарушениями функции почек, вызванными большой кровопотерей или тяжелым обезвоживанием, Ксефокам, как ингибитор синтеза простагландинов, можно назначать только после устранения гиповолемии и связанной с ней опасности уменьшения перфузии почек.

Ксефокам (как и другие НПВС) может вызывать повышение концентрации в крови мочевины и креатинина, а также задержку воды, натрия, периферические отеки, артериальную гипертензию и другие ранние признаки нефропатии. Длительное лечение таких больных препаратом Ксефокам может привести к следующим последствиям: гломерулонефрит, папиллярный некроз и нефротический синдром с переходом в острую почечную недостаточность.

У пациентов пожилого возраста, а также у пациентов, страдающих артериальной гипертензией и/или ожирением, необходимо контролировать уровень АД.

Особенно важно проводить мониторинг функции почек у пожилых больных, а также у пациентов, одновременно получающих диуретики; одновременно получающих лекарства, которые могут вызывать повреждения почек.

При длительном применении препарата Ксефокам необходимо периодически контролировать гематологические параметры, а также функцию почек и печени.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Пациентам, получающим препарат, необходимо воздерживаться от видов действия, требующих повышенного внимания, быстрых психических и двигательный реакций, употребления алкоголя.

При нарушениях функции почек

Противопоказания: выраженная почечная недостаточность (содержание сывороточного креатинина более 300 мкмоль/л), прогрессирующие заболевания почек, подтвержденная гиперкалиемия, гиповолиемия или обезвоживание.

При нарушениях функции печени

Противопоказания: печеночная недостаточность или активное заболевание печени.

Применение в пожилом возрасте

С *осторожностью:* возраст старше 65 лет.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей, защищенном от света месте при температуре не выше 25°С. Срок годности лиофилизата - 5 лет, растворителя (вода для инъекций) - 5 лет.

Приготовленный раствор необходимо использовать в течение 24 ч.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Ksefokam_liofilizat