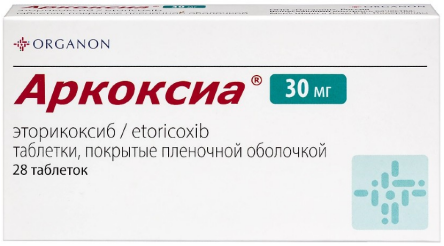
Инструкция по применению
Аркоксиа Таблетки покрытые пленочной оболочкой 30 мг 28 шт

Характеристики

Форма выпуска: Таблетки
Страна: Нидерланды
Производитель: Органон
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Эторикоксиб
Количество в упаковке: 28
Дозировка действующего вещества: 30 мг



Действующее вещество

Эторикоксиб

Состав

Эторикоксиб 30 мг Вспомогательные вещества: кальция гидрофосфат 30 мг, целлюлоза микрокристаллическая 37 мг, кроскармеллоза натрия 2 мг, магния стеарат 1 мг. Состав оболочки: Опадрай II Сине-Зеленый 39K11526, воск карнаубский. Состав пленочной оболочки: лактозы моногидрат, гипромеллоза, титана диоксид, триацетин, алюминиевый лак на основе красителя индигокармина (E132), краситель железа оксид желтый (E172).

Форма выпуска

Таблетки

Фармакокинетика

После приема внутрь быстро абсорбируется из ЖКТ. Биодоступность при приеме внутрь составляет около 100%. После приема взрослыми натощак в дозе 120 мг Cmax составляет 3.6 мкг/мл, Tmax -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 Cmax снижаются на 36% и Tmax увеличивается на 2 ч. Средняя геометрическая величина AUC0-24 составила 37.8 мкг х ч/мл. Фармакокинетика эторикоксиба в пределах терапевтических доз носит линейный характер. Связывание с белками плазмы превышает 92%. Vd в равновесном состоянии составляет около 120 л. Эторикоксиб проникает через плацентарный и ГЭБ. Интенсивно метаболизируется в печени, с участием изоферментов цитохрома Р450 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 T1/2 - 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

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

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.

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.

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.

Побочные действия

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.

Взаимодействие с другими препаратами

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 AUC0-24 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 AUC0-24 в равновесном состоянии или элиминацию дигоксина. Вместе с тем, эторикоксиб повышает Cmax (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

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.