

І Н С Т Р У К Ц І Я
для медичного застосування препарату
КСЕФОКАМ РАПІД
(XEFOCAM RAPID®)

Загальна характеристика:

міжнародна та хімічна назви: лорноксикам;

6-Хлор-4-гідроксі-2-метил-N-(2-піридил)-2Н-тієно-[2,3-е]-1,2-тіазин-3-карбоксамід-1,1-діоксид.

основні фізико-хімічні властивості: білі до світло-жовтого кольору круглі двовипуклі таблетки, вкриті оболонкою;

склад: 1 таблетка містить 8 мг лорноксикаму;

допоміжні речовини: кальцію стеарат, гідроксипропілцелюлоза, гідрокарбонат; натрію, однозаміщена гідроксипропілцелюлоза, мікрокристалічна целюлоза, кальцію гідрофосфат;

оболонка: пропіленгліколь, тальк, титану діоксид, гіпромелоза.

Форма випуску. Таблетки, вкриті оболонкою.

Фармакотерапевтична група. Нестероїдні протизапальні та протиревматичні засоби.

Код АТС М01А С05.

Фармакологічні властивості. *Фармакодинаміка.* Лорноксикам є нестероїдним протизапальним засобом з анальгезуючими та протизапальними властивостями і належить до класу оксикамів. Механізм дії лорноксикаму частково заснований на інгібуванні синтезу простагландинів (інгібування ферменту циклооксигенази). Інгібування циклооксигенази не викликає збільшення утворення лейкотриєнів. Аналгетичний ефект лорноксикаму не пов'язаний з наркотичною дією. Препарат Ксефокам Рапід не спричиняє опіатоподібної дії на ЦНС і, на відміну від наркотичних аналгетиків, не пригнічує дихання, не призводить до лікарської залежності.

Фармакокінетика. Лорноксикам швидко і практично повністю всмоктується з ШКТ. Максимальна концентрація у плазмі (C_{max}) досягається через 30 хвилин після прийому препарату.

C_{max} препарату Ксефокам Рапід вище, ніж C_{max} препарату Ксефокам таблетки і еквівалентна C_{max} для лікарських форм лорноксикаму, призначених для парентерального введення.

Абсолютна біодоступність (розрахована по площі під фармакокінетичною кривою „концентрація-час” (AUC)) Ксефокам Рапід таблеток становить 90 – 100% і еквівалентна біодоступності препарату Ксефокам таблетки.

Ефекту першого проходження не спостерігалось. Середній період напіввиведення становить 3 - 4 години.

У плазмі лорноксикам присутній в незміненому вигляді і у формі свого гідроксильованого метаболіту. Гідроксильований метаболіт не має фармакологічної активності. Зв'язування лорноксикаму з білками плазми становить 99% і не залежить від його концентрації. Лорноксикам повністю метаболізується. Близько 2/3 лорноксикаму виводиться через печінку і 1/3 через нирки у вигляді неактивного з'єднання. Лорноксикам (подібно до диклофенаку та інших оксикамів) піддається метаболізму з участю цитохрому P450 2C9. В результаті генетичного поліморфізму існують особи з сповільненим і з інтенсивним метаболізмом, що може виражатися в помітному збільшенні рівнів лорноксикаму в плазмі у осіб з уповільненим метаболізмом.

При дослідженнях на моделях тварин лорноксикам не викликав індукції печінкових ферментів. На підставі результатів клінічних випробувань не отримано даних про акумуляцію лорноксикаму після багаторазового прийому рекомендованих доз.

На підставі даних, отриманих під час застосування препарату Ксефокам Рапід таблеток, виходить наступне: одночасний прийом лорноксикаму з їжею знижує C_{max} близько 30%. T_{max} збільшувалося з 1,5 до 2,3 години. Всмоктуваність лорноксикаму (розрахована по площі під фармакокінетичною кривою „концентрація-час” (AUC)) може знижуватися до 20%. Одночасний прийом з антацидами

не впливає на фармакокінетику лорноксикаму.

У пацієнтів з порушеннями функції печінки або нирок також не виявлено значних змін фармакокінетики лорноксикаму.

Показання для застосування. Нетривале лікування гострого болю.

- Помірно або значно виражений больовий синдром (наприклад біль у хребті, біль, пов'язаний з гострим нападом люмбаго/ішалгії, післяопераційний біль, міалгії);
- симптоматичне лікування болю і запалення при запальних і дегенеративних ревматичних захворюваннях.

Спосіб застосування та дози. Ксефокам Рапід таблетки, вкриті оболонкою, призначені для прийому внутрішньо і їх слід приймати, запиваючи достатньою кількістю води.

Для всіх пацієнтів відповідний режим дозування повинен ґрунтуватися на індивідуальному сприйнятті лікування.

Призначають в дозі 8 мг, добова доза не повинна перевищувати 16 мг.

Тривалість курсу лікування залежить від характеру захворювання та ефективності терапії, що проводиться.

Побічна дія. Вважається, що близько 16 % пацієнтів (у випадку довготривалого лікування 20-25% пацієнтів) можуть мати небажані реакції, пов'язані з ШКТ, у 5% пацієнтів можуть спостерігатися реакції, пов'язані з загальними розладами і/або з порушеннями центральної нервової системи і у 2 % кожні реакції.

Можуть виникати наступні небажані ефекти, які є загальними для усіх інших нестероїдних протизапальних та протиревматичних засобів, а саме:

- шлунково-кишкові виразки з перфорацією кишечника, котрі можуть бути тяжкими,
- виразки дванадцятипалої кишки, блювання з кров'ю, мелена,
- розвиток тяжких шкірних реакцій та тяжких реакцій підвищеної чутливості, що можуть загрожувати життю,
- зрідка: інтерстиціальний нефрит, гломерулонефрит, тубулярний некроз нирок або нефротичний синдром,
- порушення формули крові, патологічні зміни крові, лейкоцитопенія.

При прийомі Ксефокам Рапід можуть виникати такі небажані ефекти:

З боку ШКТ:

Часто ($\geq 1\%$ і $<10\%$): біль у животі, діарея, диспепсія, нудота, блювання.

Рідко ($<1\%$): запори, дисфагія, метеоризм, сухість у роті, гастрит, гастроєзофагіальний рефлюкс, пептичні виразки і/або кровотечі у ШКТ, стоматит, гемороїдальна кровотеча.

Загальні розлади:

Часто: запаморочення, головний біль.

Рідко: порушення сну, сонливість, нездужання, слабкість, приливи.

Порушення шкірних і підшкірних тканин:

Рідко: алопеція, дерматити, пруритус, посилення потовиділення, сип, уртикарія, пурпура, екхімоз.

Порушення з боку системи кровотворення:

Порушення формули крові, патологічні зміни крові, лейкоцитопенія.

Рідко: тромбоцитопенія, збільшення часу кровотечі, анемія, зниження кількості еритроцитів, гемоглобіну і лейкоцитів.

З боку серцево-судинної системи:

Рідко: набряк легенів, гіпертензія, серцебиття, тахікардія, гіпотензія.

Неврологічні розлади:

Рідко: сонливість, запаморочення, вертиго, парестезія, тремор, порушення смаку.

Респіраторні порушення:

Рідко: задишка, бронхоспазм, кашель, риніти.

З боку нирок і сечовидільної системи:

Рідко: збільшення рівню азоту сечовини і креатину в крові, порушення сечовиділення.

З боку нервової системи:

Рідко: збудження, депресія.

З боку гепатобіліарної системи.

Збільшення рівню трансаміназ, рівня лужної фосфатази.

Рідко: порушення функції печінки.

Порушення скелетно-м'язової, сполучної тканини і кісток:

Рідко: міалгія, судоми ніг.

Порушення з боку зорової системи:

Рідко: кон'юнктивіт, порушення зору.

Порушення органів слуху:

Рідко: дзвін у вухах.

З боку імунної системи:

Рідко: алергічні реакції.

Порушення метаболізму і харчування:

Рідко: погіршення апетиту, зміна маси тіла.

Протипоказання.

- Гіперчутливість до лорноксикаму або до одного з компонентів препарату;
- підвищена чутливість (симптоми подібні астмі, риніту, ангіоневротичному набряку або уртикарії) до інших нестероїдних протизапальних лікарських засобів, включаючи ацетилсаліцилову кислоту;
- шлунково-кишкові кровотечі, церебрально-судинні кровотечі або інші гематологічні порушення.
- активна пептична виразка або рецидиви пептичної виразки а анамнезі;
- тяжка ниркова недостатність(рівень сироваткового креатиніну > 700 мкмоль/літр);
- виражена тромбоцитопенія;
- тяжка серцева недостатність;
- період вагітності і годування груддю;
- вік до 18 років.

Передозування. У випадку передозування препаратом Ксефокам Рапід можуть спостерігатися такі симптоми: нудота, блювання, церебральні симптоми (запаморочення, атаксія, перехідна до коми і судоми). Можливі зміни функції печінки і нирок і порушення згортання крові.

При реальному або передбачувальному передозуванні слід припинити прийом ліків. Завдяки короткому періоду напіввиведення, лорноксикам швидко виводиться з організму. Лорноксикам діалізу не піддається. До нинішнього часу специфічний антидот не відомий. Необхідно передбачити проведення звичайних невідкладних закладів, включаючи промивання шлунка. Виходячи з загальних принципів, застосування активованого вугілля тільки за умови його прийому одразу після прийому препарату Ксефокам Рапід можуть призвести до зменшення всмоктування препарату. Симптоматичне лікування.

Особливості застосування.

Пацієнтам, які застосовують препарат, необхідно утриматися від дій, які вимагають підвищеної уваги, швидких психічних і рухових реакцій, вживання алкоголю.

Препарат Ксефокам Рапід не слід призначати дітям (до 18 років). Спеціального підбору дози для людей похилого віку не потребує, за недостатності функції нирок або печінки добову дозу слід обмежити.

Застосування під час вагітності та в період годування груддю.

Безпека препарату Ксефокам Рапід в період вагітності і годування груддю не встановлена і цей лікарський засіб не слід призначати при цих станах.

На час лікування припиняють годування груддю.

При таких порушеннях препарат Ксефокам Рапід слід призначати тільки після ретельної оцінки очікуваної користі терапії і можливого ризику.

- Шлунково-кишкові виразки і кровотечі в анамнезі:

Рекомендується проведення клінічного спостереження через регулярні періоди часу. Якщо у пацієнта в період прийому препарату Ксефокам Рапід розвинулася пептична виразка і/або шлунково-кишкова кровотеча, то необхідно відмінити прийом препарату і провести відповідні терапевтичні заходи.

- Ниркова недостатність.

Пацієнти з неявно вираженою нирковою недостатністю (креатин сироватки 150-300 мкмоль/літр) повинні проходити обстеження щокварталу, пацієнти з помірною нирковою недостатністю (креатин сироватки 300-700 мкмоль/літр) повинні обстежуватися з інтервалом 1-2 місяці. У випадку погіршення функції нирок лікування препаратом Ксефокам Рапід слід припинити.

- Пацієнти з порушенням згортання крові.

Рекомендується проведення ретельного клінічного дослідження і оцінки лабораторних показників (наприклад, часткового протромбінового часу).

- Довготривале лікування (більше 3 місяців).

Рекомендується регулярно проводити оцінку стану крові (гемоглобін), функції нирок (креатин) і печінкового ферменту.

- Пацієнти похилого віку (65 років і старше), пацієнти з масою тіла менше 50 кг а також хворим під час хірургічного втручання.

Рекомендується спостереження за функціями нирок і печінки.

Важливо контролювати функцію нирок у таких пацієнтів:

- які перенесли обширне хірургічне втручання;
- з порушеннями ниркової функції, наприклад, в результаті значної втрати крові або сильно вираженого зневоднення організму;
- з серцевою недостатністю;
- які отримують одночасне лікування діуретиками, а також лікарськими засобами, які викликають пошкодження нирок.

Не рекомендується призначати пацієнтам, які працюють на транспортних засобах і з механізмами, які потребують уваги.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами.

Одночасний прийом препарату Ксефокам Рапід та наступних лікарських засобів:

- антикоагулянти або інгібітори агрегації тромбоцитів:

– можливе збільшення часу кровотечі (підвищений ризик кровотечі).

Збільшується ризик спинномозкової/епідуральної гематоми при спинномозковій або епідуральній анестезії.

- похідні сульфанілсечовини:

може підсилюватись гіпоглікемічний ефект останніх;

- інші НПЗЗ:

збільшується ризик розвитку небажаних ефектів;

- діуретини:

знижує ефективність петльових діуретиків;

- інгібітори АПФ:

може зменшувати дію інгібітору АПФ;

- препарати літію:

може викликати збільшення пікових концентрацій літію, а отже можливе збільшення відомих небажаних ефектів, викликаних літієм;

- метотрексат і циклоспорин:

підвищує концентрацію метотрексату і циклоспорину у сироватці;

- циметидин:

підвищення лорноксикаму в плазмі. (Взаємодія між препаратом Ксефокам Рапід і ранітидином або

препаратом Ксефокам Рапід і антацидами не виявлено.)

- дигоксин:

знижує нирковий кліренс дигоксину.

Лорноксикам взаємодіє з відомими індукторами і інгібіторами СYP2C9 ізоферментів (наприклад, з транілципроміном і римфаміцином).

-

Умови та термін зберігання.

Зберігати при температурі 18⁰С- 30⁰С.

Зберігати в недоступному для дітей місці.

Термін придатності – 2 роки.

Не використовувати після закінчення терміну дії.

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка.

По 6 таблеток у блістері.

1 блістер у картонній коробці.

Виробник. „Нікомед Данія АпС”, Данія.

Адреса. Langebjerg 1, DK – 4000 Roskilde, Denmark.