

ЗАТВЕРДЖЕНО
Наказ Міністерства охорони
здоров'я України
№ 50 від 15.01.2026
Реєстраційне посвідчення
№ UA/21120/01/01
№ UA/21120/01/02
№ UA/21120/01/03

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування лікарського засобу

Айкідол 60 мг
Айкідол 90 мг
Айкідол 120 мг

Склад:

діюча речовина: еторикоксиб;

1 таблетка, вкрита плівковою оболонкою, містить 60 мг або 90 мг, або 120 мг еторикоксибу;

допоміжні речовини: кальцію гідрофосфат (безводний), натрію кроскармелоза, магнію стеарат, целюлоза мікрокристалічна;

плівкова оболонка Opadry II green 39K11529: лактози моногідрат, гіпромелоза (2910/15 мПа·с), титану діоксид (E 171), триацетин, індигокармін (E 132), оксид заліза жовтий (E 172) (для 60 мг);

плівкова оболонка Opadry II white 39K18305: лактози моногідрат, гіпромелоза (2910/15 мПа·с), гіпромелоза (2910/50 мПа·с); титану діоксид (E 171), триацетин (для 90 мг);

плівкова оболонка Opadry II green 39K11529: лактози моногідрат, гіпромелоза (2910/15 мПа·с), титану діоксид (E 171), триацетин, індигокармін (E 132), оксид заліза жовтий (E 172) (для 120 мг).

Лікарська форма. Таблетки, вкриті плівковою оболонкою.

Основні фізико-хімічні властивості:

Айкідол 60 мг, таблетки, вкриті плівковою оболонкою, по 60 мг: довгасті таблетки, вкриті плівковою оболонкою, зеленого кольору;

Айкідол 90 мг, таблетки, вкриті плівковою оболонкою, по 90 мг: круглі таблетки, вкриті плівковою оболонкою, білого кольору;

Айкідол 120 мг, таблетки, вкриті плівковою оболонкою, по 120 мг: круглі таблетки, вкриті плівковою оболонкою, зеленого кольору.

Фармакотерапевтична група. Нестероїдні протизапальні та протиревматичні засоби. Коксиби.
Код АТХ M01A H05.

Фармакологічні властивості

Фармакодинаміка

Механізм дії

Еторикоксиб є пероральним селективним інгібітором циклооксигенази-2 (ЦОГ-2) у межах діапазону доз для клінічного застосування.

У ході клінічних фармакологічних досліджень еторикоксиб дозозалежно інгібував ЦОГ-2 без інгібування ЦОГ-1 при застосуванні у дозах до 150 мг на добу. Еторикоксиб не інгібує синтез простагландинів шлунка та не впливає на функцію тромбоцитів.

Циклооксигеназа відповідає за утворення простагландинів. Ідентифіковано дві ізоформи — ЦОГ-1 та ЦОГ-2. ЦОГ-2 є ізоформою ферменту, що індукується імпульсом прозапалення та розглядається як основний фактор, що відповідає за синтез простаноїдних медіаторів болю, запалення та гарячки. ЦОГ-2 також задіяна у процесах овуляції, імплантації та закриття артеріальної протоки, регуляції функції нирок та центральної нервової системи (індукція гарячки, відчуття болю, когнітивна функція). Також може відігравати певну роль у загоєнні виразки. ЦОГ-2 було ідентифіковано у тканині навколо виразки шлунка у людини, але її значення для загоєння виразки не встановлено.

Клінічна ефективність та безпека

Ефективність

У пацієнтів з остеоартритом (ОА) еторикоксид у дозі 60 мг 1 раз на добу значно покращує стан при болях та оцінку пацієнта щодо стану захворювання. Ці позитивні ефекти спостерігалися вже на другу добу лікування і зберігалися протягом періоду до 52 тижнів. У ході досліджень із застосуванням еторикоксибу в дозі 30 мг 1 раз на добу ефективність цього препарату перевищувала плацебо протягом 12 тижнів лікування (використовували оцінки, що застосовувалися в зазначених вище дослідженнях). Під час дослідження підбору дози еторикоксибу у дозі 60 мг демонстрував значно більш виражене покращення, ніж у дозі 30 мг, відносно усіх трьох основних кінцевих точок протягом 6 тижнів лікування. Застосування дози 30 мг при остеоартриті кисті руки не вивчали.

У пацієнтів із ревматоїдним артритом (РА) еторикоксид у дозі 60 мг та 90 мг 1 раз на добу значно покращував стан стосовно вираженості болю, запалення, а також рухливості. У ході досліджень з оцінки доз 60 мг та 90 мг позитивні ефекти зберігалися протягом 12-тижневого періоду лікування. У ході дослідження з оцінки дози 60 мг порівняно з дозою 90 мг обидва дозування еторикоксибу — 60 мг 1 раз на добу та 90 мг 1 раз на добу — були більш ефективні, ніж плацебо. Доза 90 мг була ефективніша, ніж доза 60 мг відповідно до глобальної оцінки болю пацієнтом (візуальна аналогова шкала від 0 до 100 мм), з середнім покращенням -2,71 мм (95 % ДІ): -4,98 мм, -0,45 мм).

У пацієнтів з нападами гострого подагричного артриту еторикоксид у дозі 120 мг 1 раз на добу протягом 8 днів лікування полегшував біль у суглобах середнього та важкого ступеня та запалення порівняно з індометацином у дозі 50 мг 3 рази на добу. Зменшення вираженості болю спостерігається вже через 4 години після початку лікування.

У пацієнтів з анкілозуючим спондилітом еторикоксид у дозі 90 мг 1 раз на добу забезпечує значне покращення при болю у хребті, запаленні, скутості рухів, а також покращує функціональну здатність. Клінічні переваги еторикоксибу спостерігалися на другу добу після початку терапії і зберігалися упродовж 52-тижневого періоду лікування. У ході другого дослідження з оцінки дози 60 мг порівняно з дозою 90 мг, еторикоксид у дозі 60 мг 1 раз на добу та 90 мг 1 раз на добу продемонстрував схожу ефективність порівняно з напроксеном 1000 мг 1 раз на добу. У пацієнтів, які не демонстрували адекватної відповіді під час застосування дози 60 мг на добу протягом 6 тижнів, підвищення дози до 90 мг на добу покращувало оцінку інтенсивності болю у спині (візуальна аналогова шкала від 0 до 100 мм) порівняно з продовженням застосування 60 мг на добу, з середнім покращенням -2,70 мм (95 % ДІ: -4,88 мм, -0,52 мм).

Під час клінічного дослідження післяопераційного зубного болю еторикоксид у дозі 90 мг застосовували 1 раз на добу до трьох днів. У підгрупі пацієнтів з помірним болем до початку терапії еторикоксид у дозі 90 мг демонстрував знеболювальний ефект, подібний до ефекту ібупрофену 600 мг (16,11 проти 16,39; $P=0,722$), і перевищував ефект парацетамолу / кодеїну

600 мг/60 мг (11,00; $P < 0,001$) і плацебо (6,84; $P < 0,001$), що визначалося за показником повного полегшення болю через 6 годин (TOPAR6). Кількість пацієнтів, які повідомляли про застосування лікарських засобів екстреного знеболення протягом 24 годин, становила 40,8 % у групі застосування еторикоксибу 90 мг, 25,5 % у групі застосування ібупрофену 600 мг кожні 6 годин і 46,7 % у групі застосування парацетамолу / кодеїну 600 мг/60 мг кожні 6 годин порівняно з 76,2 % у групі плацебо. У цьому дослідженні початок анальгезивної дії (відчутне полегшення болю) 90 мг еторикоксибу спостерігалось вже через 28 хвилин після застосування лікарського засобу.

Безпека

Міжнародна дослідницька програма тривалого застосування еторикоксибу і диклофенаку при артриті (MEDAL)

Програма MEDAL була проспективно розробленою програмою вивчення безпеки для серцево-судинної системи за об'єднаними даними трьох рандомізованих, подвійних сліпих, контрольованих активним препаратом порівняння випробувань (дослідження MEDAL, EDGE II і EDGE).

У дослідженні MEDAL, що було спрямоване на визначення впливу на серцево-судинну систему, брали участь 17 804 пацієнти з остеоартритом (ОА) і 5 700 — з ревматоїдним артритом (РА), які застосовували еторикоксиб у дозі 60 мг (ОА) або 90 мг (ОА і РА) або диклофенак у дозі 150 мг на добу протягом середнього періоду 20,3 місяця (максимально — 42,3 місяця, медіана — 21,3 місяця). У цьому дослідженні були зафіксовані тільки серйозні побічні реакції і припинення застосування препарату внаслідок виникнення будь-яких побічних реакцій.

У ході досліджень EDGE і EDGE II порівнювали шлунково-кишкову переносимість еторикоксибу і диклофенаку. У дослідженні EDGE брали участь 7 111 пацієнтів з ОА, які отримували еторикоксиб у дозі 90 мг на добу (у 1,5 раза вище рекомендованої дози для лікування ОА), або диклофенак у дозі 150 мг на добу протягом у середньому 9,1 місяця (максимум — 16,6 місяця, медіана — 11,4 місяця). У дослідженні EDGE II брали участь 4 086 пацієнтів з РА, які отримували лікування еторикоксибом у дозі 90 мг на добу або диклофенаком у дозі 150 мг на добу протягом у середньому 19,2 місяця (максимум — 33,1 місяця, медіана — 24 місяці).

В об'єднаній програмі MEDAL брали участь 34 701 пацієнт з ОА і РА, які отримували лікування упродовж періоду в середньому 17,9 місяця (максимум — 42,3 місяця, медіана — 16,3 місяця); приблизно 12 800 пацієнтів отримували лікування понад 24 місяці. У пацієнтів, зареєстрованих у цій програмі, були різні початкові чинники ризику стосовно серцево-судинної системи і шлунково-кишкового тракту. Пацієнти з нещодавно перенесеним інфарктом міокарда, аортокоронарним шунтуванням або черезшкірною коронарною ангіопластиком упродовж 6 місяців до реєстрації в дослідженні були виключені з дослідження. У дослідженнях було дозволено застосування гастропротекторних препаратів і ацетилсаліцилової кислоти у низьких дозах.

Загальний профіль безпеки

Не було суттєвих відмінностей у частоті тромботичних серцево-судинних ускладнень при застосуванні еторикоксибу і диклофенаку. Кардіоренальні побічні реакції частіше спостерігалися при застосуванні еторикоксибу, ніж диклофенаку; цей ефект був дозозалежним (детально про результати див. нижче). Побічні реакції з боку шлунково-кишкового тракту і печінки виникали значно частіше при застосуванні диклофенаку, ніж еторикоксибу. Частота виникнення побічних реакцій у дослідженнях EDGE і EDGE II, а також побічних реакцій, що розглядалися як серйозні

або такі, що призводять до відміни препарату в дослідженні MEDAL, була вищою при застосуванні еторикоксибу, ніж диклофенаку.

Показники безпеки для серцево-судинної системи

Частота підтверджених тромботичних серцево-судинних серйозних побічних реакцій (включаючи реакції з боку серця, цереброваскулярні реакції і реакції з боку периферичних судин) була порівнянною у еторикоксибу і диклофенаку; ці дані підсумовано в таблиці 1 нижче. Не було суттєвих відмінностей у показниках частоти тромботичних ускладнень при застосуванні еторикоксибу і диклофенаку в усіх проаналізованих підгрупах, включаючи пацієнтів із кардіоваскулярним ризиком. При окремому розгляді відносний ризик виникнення підтверджених серйозних тромботичних побічних реакцій з боку серцево-судинної системи при застосуванні еторикоксибу в дозі 60 мг або 90 мг і диклофенаку в дозі 150 мг був однаковим.

Таблиця 1			
Показники підтверджених тромботичних ускладнень з боку серцево-судинної системи (об'єднана програма MEDAL)			
	Еторикоксиб (N=16 819) 25836 пацієнто-років	Диклофенак (N=16483) 24766 пацієнто-років	Порівняння між групами лікування
	Показник † (95 % ДІ)	Показник † (95 % ДІ)	Відносний ризик (95 % ДІ)
Підтверджені серйозні тромботичні побічні реакції з боку серцево-судинної системи			
За протоколом	1,24 (1,11, 1,38)	1,30 (1,17, 1,45)	0,95 (0,81, 1,11)
За призначеним лікуванням	1,25 (1,14, 1,36)	1,19 (1,08, 1,30)	1,05 (0,93, 1,19)
Підтверджені ускладнення з боку серця			
За протоколом	0,71 (0,61, 0,82)	0,78 (0,68, 0,90)	0,90 (0,74, 1,10)
За призначеним лікуванням	0,69 (0,61, 0,78)	0,70 (0,62, 0,79)	0,99 (0,84, 1,17)
Підтверджені цереброваскулярні ускладнення			
За протоколом	0,34 (0,28, 0,42)	0,32 (0,25, 0,40)	1,08 (0,80, 1,46)
За призначеним лікуванням	0,33 (0,28, 0,39)	0,29 (0,24, 0,35)	1,12 (0,87, 1,44)
Підтверджені ускладнення з боку периферичних судин			
За протоколом	0,20 (0,15, 0,27)	0,22 (0,17, 0,29)	0,92 (0,63, 1,35)
За призначеним лікуванням	0,24 (0,20, 0,30)	0,23 (0,18, 0,28)	1,08 (0,81, 1,44)
† Ускладнень на 100 пацієнто-років; ДІ = довірчий інтервал. N = загальна кількість пацієнтів у популяції за протоколом.			
За протоколом: усі ускладнення під час досліджуваної терапії або протягом 14 діб після її припинення (за винятком пацієнтів, які отримали <75 % досліджуваного препарату або отримували не досліджувані НПЗП >10 % часу).			
За призначеним лікуванням: всі підтверджені ускладнення до закінчення дослідження (включно з пацієнтами, які могли зазнати втручання, не пов'язаного з дослідженням, з подальшим припиненням застосування досліджуваного препарату). Загальна кількість рандомізованих пацієнтів: n=17 412 у групі еторикоксибу і 17 289 у групі диклофенаку.			

Показник серцево-судинної летальності, як і загальної летальності, був подібним у групах лікування еторикоксибом і диклофенаком.

Кардіоренальні ускладнення

Приблизно 50 % пацієнтів, прийнятих у дослідження MEDAL, мали артеріальну гіпертензію в анамнезі на початковому етапі. У цьому дослідженні частота припинення лікування унаслідок виникнення побічних реакцій, пов'язаних з артеріальною гіпертензією, була статистично значно вищою у групі застосування еторикоксибу, ніж у групі диклофенаку. Частота такої побічної реакції як застійна серцева недостатність (припинення застосування препарату і серйозні реакції) була аналогічною як при прийомі еторикоксибу 60 мг, так і при прийомі диклофенаку 150 мг, проте частота виникнення цих реакцій була вищою при прийомі еторикоксибу 90 мг порівняно з диклофенаком 150 мг (статистично значуща різниця при прийомі еторикоксибу 90 мг порівняно з 150 мг диклофенаку в когорті ОА MEDAL). Частота підтверджених побічних реакцій, пов'язаних із застійною серцевою недостатністю (явища, що були серйозними і вимагали госпіталізації або невідкладної допомоги), була незначно вищою при прийомі еторикоксибу порівняно з прийомом диклофенаку 150 мг, і цей ефект залежав від дози. Частота припинення лікування унаслідок виникнення побічних реакцій, пов'язаних з набряками, була значно вищою при прийомі еторикоксибу порівняно з прийомом диклофенаку 150 мг, і цей ефект залежав від дози (статистично значуща різниця при прийомі еторикоксибу 90 мг, але не еторикоксибу 60 мг).

Кардіоренальні результати, отримані в дослідженнях EDGE і EDGE II, відповідали даним, про які повідомляли в дослідженні MEDAL.

В окремих дослідженнях програми MEDAL абсолютна частота припинення лікування у будь-якій групі лікування еторикоксибом (60 мг або 90 мг) становила до 2,6 % при артеріальній гіпертензії, до 1,9 % при набряках і до 1,1 % при застійній серцевій недостатності, при цьому вища частота відміни препарату спостерігалася у разі прийому еторикоксибу в дозі 90 мг, ніж у дозі 60 мг.

Показники шлунково-кишкової переносимості у програмі MEDAL

Значно менший показник відміни препарату внаслідок виникнення будь-якого клінічного ускладнення з боку ШКТ (наприклад диспепсії, абдомінального болю, виразки) спостерігався при застосуванні еторикоксибу, ніж диклофенаку, в кожному з трьох досліджень програми MEDAL. Показники відміни препарату внаслідок клінічних реакцій з боку ШКТ на 100 пацієнто-років за весь період дослідження були такими: 3,23 для еторикоксибу і 4,96 для диклофенаку в дослідженні MEDAL; 9,12 для еторикоксибу і 12,28 для диклофенаку в дослідженні EDGE; 3,71 для еторикоксибу і 4,81 для диклофенаку в дослідженні EDGE II.

Показники безпеки для шлунково-кишкового тракту у програмі MEDAL

Загальні реакції з боку верхнього відділу ШКТ були визначені як перфорації, виразки і кровотечі. Підгрупа загальних реакцій з боку верхнього відділу ШКТ, які вважалися ускладненими, включала перфорації, обструкції і ускладнені кровотечі; підгрупа загальних реакцій з боку верхнього відділу ШКТ, які вважалися неускладненими, включала неускладнені кровотечі і неускладнені виразки. Значно менший показник частоти загальних реакцій з боку верхніх відділів ШКТ спостерігався при застосуванні еторикоксибу, ніж диклофенаку. Не було суттєвої різниці між еторикоксибом і диклофенаком щодо показника частоти ускладнених реакцій. Для підгрупи таких реакцій як кровотеча у верхньому відділі ШКТ (об'єднані ускладнені і неускладнені) не було суттєвої відмінності між еторикоксибом і диклофенаком. Перевага еторикоксибу щодо впливу на верхній відділ ШКТ порівняно з диклофенаком не була статистично значущою у пацієнтів, які одночасно застосовують аспірин у низьких дозах (приблизно 33 % пацієнтів).

Показник частоти на 100 пацієнто-років підтверджених ускладнених і неускладнених клінічних реакцій з боку верхнього відділу ШКТ (перфорації, виразки і кровотечі) становив 0,67 (95 % ДІ 0,57, 0,77) при прийомі еторикоксибу і 0,97 (95 % ДІ 0,85, 1,10) при прийомі диклофенаку, при цьому відносний ризик становив 0,69 (95 % ДІ 0,57, 0,83).

Визначався показник частоти підтверджених реакцій з боку верхнього відділу ШКТ у пацієнтів літнього віку; найбільше зниження спостерігалось у пацієнтів віком ≥ 75 років (1,35 [95 % ДІ 0,94, 1,87] реакцій на 100 пацієнтів-років при прийомі еторикоксибу порівняно з 2,78 [95 % ДІ 2,14, 3,56] при прийомі диклофенаку).

Показники частоти підтверджених клінічних реакцій з боку нижнього відділу ШКТ (перфорація тонкого або товстого кишечника, обструкція або кровотеча) статистично не відрізнялися при застосуванні еторикоксибу і диклофенаку.

Показники безпеки з боку печінки у програмі MEDAL

Еторикоксиб був асоційований зі статистично значно меншою частотою відміни препарату унаслідок виникнення побічних реакцій з боку печінки, ніж диклофенак. В об'єднаній програмі MEDAL 0,3 % пацієнтів, які застосовували еторикоксиб, і 2,7 % пацієнтів, які застосовували диклофенак, припинили застосування препарату внаслідок виникнення побічних реакцій з боку печінки. Показник на 100 пацієнто-років становив 0,22 при застосуванні еторикоксибу і 1,84 при застосуванні диклофенаку (р-значення було $< 0,001$ для еторикоксибу порівняно з диклофенаком). Однак більшість побічних ефектів з боку печінки в програмі MEDAL були несерйозними.

Додаткові дані з безпеки для серцево-судинної системи щодо тромботичних ускладнень

У ході клінічних досліджень, за винятком досліджень програми MEDAL, приблизно 3100 пацієнтів отримували еторикоксиб у дозах ≥ 60 мг на добу упродовж 12 тижнів і довше. Не було значущої відмінності показників підтверджених серйозних тромботичних серцево-судинних ускладнень у пацієнтів, які приймали еторикоксиб у дозі ≥ 60 мг, плацебо або інші НПЗП (за винятком тих, що містять напроксен). Проте частота таких реакцій була вищою у пацієнтів, які отримували еторикоксиб, порівняно з тими, хто отримував напроксен у дозі 500 мг 2 рази на добу. Відмінність антитромботичної активності між деякими НПЗП, що інгібують ЦОГ-1, і селективними інгібіторами ЦОГ-2 може бути клінічно значущою у пацієнтів групи ризику виникнення тромбоемболічних ускладнень. Селективні інгібітори ЦОГ-2 знижують утворення системного (і тому, можливо, ендотеліального) простагліну без впливу на тромбоцитарний тромбоксан. Клінічне значення цих даних невідоме.

Додаткові дані щодо безпеки з боку ШКТ

Під час двох 12-тижневих подвійно сліпих ендоскопічних досліджень кумулятивна частота виникнення гастродуоденальних виразок була значно нижчою у пацієнтів, які отримували лікування еторикоксибом у дозі 120 мг 1 раз на добу, ніж у пацієнтів, які отримували лікування напроксеном у дозі 500 мг 2 рази на добу або ібупрофеном у дозі 800 мг 3 рази на добу. Частота виникнення виразок була вищою при застосуванні еторикоксибу, ніж плацебо.

Дослідження функції нирок у пацієнтів літнього віку

У ході рандомізованого подвійно сліпого плацебо-контрольованого дослідження з паралельними групами оцінювали вплив 15-денного лікування еторикоксибом (90 мг), цефекоксибом (200 мг 2 рази на добу), напроксеном (500 мг 2 рази на добу) і плацебо на виведення натрію із сечею, артеріальний тиск та інші показники функції нирок у пацієнтів віком від 60 до 85 років, які дотримуються дієти із вмістом солі 200 мЕкв/добу. Еторикоксиб, цефекоксиб і напроксен мали подібний вплив на виведення натрію з сечею при двотижневому лікуванні. Усі активні препарати

порівняння показали підвищення відносно плацебо щодо систолічного артеріального тиску; проте еторикоксиб асоціювався зі статистично значущим підвищенням на 14-ту добу порівняно з целекоксибом і напроксеном (середня зміна систолічного тиску порівняно з початковим рівнем: еторикоксиб 7,7 мм рт. ст., целекоксиб 2,4 мм рт. ст., напроксен 3,6 мм рт. ст.)

Фармакокінетика

Абсорбція

Еторикоксиб добре всмоктується при пероральному прийомі. Абсолютна біодоступність становить близько 100 %. Після прийому 120 мг 1 раз на добу до досягнення рівноважного стану максимальна концентрація у плазмі крові (середнє геометричне значення $C_{max}=3,6$ мкг/мл) спостерігається приблизно через 1 годину (T_{max}) після прийому дорослими натще. Середнє геометричне значення AUC_{0-24} становить 37,8 мкг•год/мл. У межах клінічного дозування фармакокінетика еторикоксибу є лінійною.

При прийомі препарату у дозі 120 мг під час їди (їжа з високим вмістом жирів) не спостерігалось впливу на ступінь абсорбції еторикоксибу. Швидкість абсорбції змінювалася, що характеризувалося зниженням C_{max} на 36 % та збільшенням T_{max} на 2 години. Такі дані не розглядаються як клінічно значущі. Під час клінічних досліджень еторикоксиб застосовували незалежно від прийому їжі.

Розподіл

Еторикоксиб приблизно на 92 % зв'язується з білками плазми крові людини з концентраціями від 0,05 до 5 мкг/мл. Об'єм розподілу при рівноважному стані (V_{dss}) становить приблизно 120 л у людини.

Еторикоксиб проникає через плацентарний бар'єр у щурів та кролів, а також через гематоенцефалічний бар'єр у щурів.

Біотрансформація

Еторикоксиб активно метаболізується, менше 1 % дози виділяється із сечею у вигляді початкової активної речовини. Основний шлях метаболізму — це формування похідної 6'-гідроксиметилу шляхом каталізації ферментами CYP. CYP3A4 сприяє метаболізму еторикоксибу *in vivo*. Дослідження *in vitro* вказують на те, що CYP2D6, CYP2C9, CYP1A2 та CYP2C19 також можуть каталізувати основний шлях метаболізму, але їх кількісні характеристики не вивчали *in vivo*.

У людини ідентифіковано 5 метаболітів. Основним метаболітом є 6'-карбоксілової кислоти дериват еторикоксибу, що утворюється при подальшій оксидації похідної 6'-гідроксиметилу. Ці основні метаболіти або не проявляють вимірюваної активності, або є слабоактивними інгібіторами ЦОГ-2. Жоден із цих метаболітів не інгібує ЦОГ-1.

Виведення

Після разового внутрішньовенного введення здоровим добровольцям 25 мг еторикоксибу, міченого радіоізотопом, 70 % радіоактивного препарату виводиться із сечею і 20 % — з калом, головним чином у вигляді метаболітів. Менше 2 % виводиться у вигляді незміненої активної речовини.

Виведення еторикоксибу відбувається майже повністю шляхом метаболізму з подальшим виведенням нирками. Рівноважні концентрації еторикоксибу досягаються через 7 діб при застосуванні у дозі 120 мг 1 раз на добу з показником кумуляції приблизно 2, що відповідає періоду напіввиведення приблизно 22 години. Кліренс плазми крові після внутрішньовенного введення 25 мг препарату становить приблизно 50 мл/хв.

Окремі групи пацієнтів

Пацієнти літнього віку. Фармакокінетика у пацієнтів літнього віку (віком від 65 років) є подібною до фармакокінетики у молодших пацієнтів.

Стать. Фармакокінетика еторикоксибу є подібною у чоловіків і жінок.

Порушення функції печінки. У пацієнтів з порушенням функції печінки легкої тяжкості (5–6 балів за шкалою Чайлда–П'ю) при застосуванні еторикоксибу в дозі 60 мг 1 раз на добу середній показник AUC приблизно на 16 % більший, ніж у здорових добровольців при такому ж дозуванні препарату. У пацієнтів з порушенням функції печінки середньої тяжкості (7–9 балів за шкалою Чайлда–П'ю) при застосуванні еторикоксибу у дозі 60 мг **через добу** середній показник AUC був подібний до показника у здорових добровольців, які приймали препарат у дозі 60 мг 1 раз на добу щоденно; застосування еторикоксибу в дозі 30 мг 1 раз на добу не вивчали у цій групі пацієнтів. Немає клінічних або фармакокінетичних даних стосовно пацієнтів з порушенням функції печінки тяжкого ступеня (≥ 10 балів за шкалою Чайлда–П'ю) (див. розділи «Спосіб застосування та дози», «Протипоказання»).

Порушення функції нирок. Фармакокінетика разової дози еторикоксибу 120 мг у пацієнтів із порушенням функції нирок середнього та тяжкого ступеня, а також у пацієнтів із захворюванням нирок термінальної стадії, яким проводять гемодіаліз, не відрізняється значним чином від фармакокінетики у здорових добровольців. При гемодіалізі препарат майже не виводиться (кліренс діалізу становить приблизно 50 мл/хв) (див. розділи «Протипоказання», «Особливості застосування»).

Діти. Фармакокінетику еторикоксибу у дітей (віком до 12 років) не вивчали.

У ході досліджень фармакокінетики (n=16), що проводили з участю підлітків (віком від 12 до 17 років), фармакокінетика у пацієнтів з масою тіла 40–60 кг, яким призначали еторикоксиб у дозі 60 мг 1 раз на добу, та у пацієнтів з масою тіла більше 60 кг, яким призначали еторикоксиб у дозі 90 мг 1 раз на добу, була подібною до фармакокінетики у дорослих, які отримували еторикоксиб у дозі 90 мг 1 раз на добу. Безпека та ефективність застосування еторикоксибу у дітей не встановлені (див. розділ «Спосіб застосування та дози»).

Клінічні характеристики

Показання

Лікарський засіб показаний дорослим та дітям віком від 16 років для симптоматичної терапії остеоартриту (ОА), ревматоїдного артриту (РА), анкілозуючого спондиліту, а також болю і ознак запалення, пов'язаних із гострим подагричним артритом.

Айкідол показаний дорослим та дітям віком від 16 років для нетривалого лікування післяопераційного болю помірної інтенсивності, пов'язаного зі стоматологічними хірургічними втручаннями.

Рішення про призначення селективного інгібітору ЦОГ-2 повинно ґрунтуватися на оцінці всіх індивідуальних ризиків у пацієнта (див. розділи «Протипоказання» та «Особливості застосування»).

Протипоказання

- Реакції підвищеної чутливості до діючої речовини або до будь-якої з допоміжних речовин.
- Активна пептична виразка або активна шлунково-кишкова кровотеча.

- Пацієнтам, у яких виникав бронхоспазм, гострий риніт, назальні поліпи, ангіоневротичний набряк, кропив'янка або інші алергічні реакції після застосування ацетилсаліцилової кислоти або НПЗП, включаючи інгібітори ЦОГ-2 (циклооксигенази-2).
- Період вагітності або годування груддю (див. розділ «Застосування у період вагітності або годування груддю»).
- Тяжкі порушення функції печінки (альбумін сироватки крові <25 г/л або ≥ 10 балів за шкалою Чайлда–П'ю).
- Розрахований нирковий кліренс креатиніну <30 мл/хв.
- Діти та підлітки віком до 16 років.
- Запальні захворювання кишечника.
- Застійна серцева недостатність (NYHA II–IV).
- Пацієнтам з артеріальною гіпертензією, у яких показники артеріального тиску постійно вищі за 140/90 мм рт. ст. та недостатньо контролюються.
- Діагностована ішемічна хвороба серця, захворювання периферичних артерій та/або цереброваскулярні захворювання.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій

Фармакодинамічні взаємодії

Пероральні антикоагулянти. У пацієнтів, стан яких стабілізований постійним застосуванням варфарину, прийом еторикоксибу в дозі 120 мг на добу супроводжується збільшенням приблизно на 13 % протромбінового часу (міжнародне нормалізоване відношення, МНВ). Тому у пацієнтів, які застосовують пероральні антикоагулянти, слід часто перевіряти показники протромбінового часу МНВ, особливо у перші дні застосування еторикоксибу або при зміні його дозування (див. розділ «Особливості застосування»).

Діуретики, інгібітори ангіотензинперетворювального ферменту (АПФ) і антагоністи рецепторів ангіотензину II. НПЗП можуть послаблювати ефект діуретиків та інших антигіпертензивних препаратів. У деяких пацієнтів з порушеннями функції нирок (наприклад у пацієнтів з дегідратацією або у пацієнтів літнього віку з ослабленою функцією нирок) одночасне застосування інгібітору АПФ або антагоністів рецепторів ангіотензину II і препаратів, що інгібують циклооксигеназу, може призводити до подальшого погіршення функції нирок, включаючи гостру ниркову недостатність, що зазвичай має оборотний характер. Слід пам'ятати про можливість таких взаємодій у пацієнтів, які застосовують еторикоксиб одночасно з інгібіторами АПФ або з антагоністами рецепторів ангіотензину II. Тому такі комбінації слід призначати з обережністю, особливо пацієнтам літнього віку. Пацієнти повинні споживати достатню кількість рідини та знаходитись під ретельним контролем функції нирок на початку супутньої терапії та періодично протягом такого лікування.

Ацетилсаліцилова кислота. У ході дослідження з участю здорових добровольців в умовах рівноважного стану застосування еторикоксибу в дозі 120 мг 1 раз на добу не впливало на антиагрегантну активність ацетилсаліцилової кислоти (81 мг 1 раз на добу). Еторикоксиб можна призначати одночасно з ацетилсаліциловою кислотою в дозах, які застосовують для профілактики серцево-судинних захворювань (низькі дози ацетилсаліцилової кислоти). Однак одночасне застосування низьких доз ацетилсаліцилової кислоти та еторикоксибу може збільшувати частоту виникнення виразки ШКТ та інших ускладнень порівняно з монотерапією еторикоксибом. Не рекомендовано одночасне застосування еторикоксибу з ацетилсаліциловою кислотою, дози якої вищі за профілактичні, а також з іншими НПЗП (див. розділи «Фармакодинаміка» та «Особливості застосування»).

Циклоспорин та такролімус. Хоча взаємодію еторикоксибу з цими препаратами не вивчали, одночасне застосування будь-якого НПЗП із циклоспорином або такролімусом може посилювати нефротоксичний вплив останніх. Слід контролювати функцію нирок при одночасному застосуванні еторикоксибу з будь-яким із цих препаратів.

Фармакокінетичні взаємодії

Вплив еторикоксибу на фармакокінетику інших препаратів.

Літій. НПЗП послаблюють виведення літію нирками, тим самим підвищуючи рівень літію у плазмі крові. Якщо необхідно, слід проводити ретельний контроль рівня літію у крові та коригувати дозу літію протягом одночасного застосування цих препаратів, а також при припиненні застосування НПЗП.

Метотрексат. У ході двох досліджень вивчали ефекти еторикоксибу при застосуванні у дозах 60, 90 або 120 мг 1 раз на добу протягом 7 днів пацієнтами, які застосовували 1 раз на тиждень метотрексат у дозі від 7,5 до 20 мг при ревматоїдному артриті. Еторикоксиб у дозі 60 і 90 мг не впливав на концентрацію у плазмі крові або нирковий кліренс метотрексату. В одному дослідженні при застосуванні еторикоксибу в дозі 120 мг не спостерігалось впливу на концентрацію у плазмі крові та нирковий кліренс метотрексату, тоді як в іншому дослідженні при застосуванні еторикоксибу в дозі 120 мг концентрація метотрексату у плазмі крові підвищувалася на 28 %, а нирковий кліренс метотрексату знижувався на 13 %. При одночасному призначенні еторикоксибу та метотрексату слід проводити відповідний моніторинг стосовно появи токсичного впливу метотрексату.

Пероральні контрацептиви. Еторикоксиб у дозі 60 мг при одночасному застосуванні з пероральними контрацептивами, що містять 35 мкг етинілестрадіолу та 0,5–1 мг норетиндрону, протягом 21 дня призводив до підвищення показника AUC₀₋₂₄ у рівноважному стані для етинілестрадіолу на 37 %. Еторикоксиб у дозі 120 мг при застосуванні з вищевказаними пероральними контрацептивами одночасно або через 12 годин підвищував у рівноважному стані значення AUC₀₋₂₄ етинілестрадіолу на 50–60 %. Про таке підвищення концентрації етинілестрадіолу слід пам'ятати при виборі перорального контрацептива з різним вмістом етинілестрадіолу, який застосовуватиметься одночасно з еторикоксибом. Підвищення експозиції етинілестрадіолу може збільшувати частоту виникнення побічних реакцій, пов'язаних із застосуванням пероральних контрацептивів (наприклад тромбоемболії вен у жінок групи ризику).

Гормонозамісна терапія (ГЗТ). Прийом 120 мг еторикоксибу з гормонозамісними препаратами, що включають кон'югований естроген (0,625 мг кон'югованого естрогену), протягом 28 днів збільшує середній показник AUC₀₋₂₄ у рівноважному стані некон'югованого естрогену (на 41 %), еквіліну (на 76 %) і 17-β-естрадіолу (на 22 %). Вплив доз еторикоксибу, рекомендованих для тривалого застосування (30, 60 і 90 мг), не вивчали. Порівняно зі збільшенням дозування з 0,625 до 1,25 мг при монотерапії із застосуванням кон'югованого естрогену, вплив еторикоксибу в дозах 120 мг на експозицію (AUC₀₋₂₄) естрогенних компонентів кон'югованого естрогену був меншим, ніж на половину. Клінічне значення такого підвищення невідоме, а застосування високих доз кон'югованого естрогену одночасно з еторикоксибом не вивчали. Слід брати до уваги таке збільшення концентрації естрогену при виборі гормонального препарату для застосування у період постменопаузи при одночасному застосуванні з еторикоксибом, оскільки зростання експозиції естрогену підвищує ризик виникнення побічних реакцій при ГЗТ.

Преднізон / преднізолон. У дослідженнях взаємодії еторикоксиб не виявляв клінічно значущого впливу на фармакокінетику преднізону / преднізолону.

Дигоксин. При застосуванні еторикоксибу в дозі 120 мг 1 раз на добу протягом 10 днів здоровим добровольцям не спостерігався вплив на показник AUC₀₋₂₄ у рівноважному стані та на виведення дигоксину нирками. Спостерігалось збільшення показника C_{max} дигоксину (приблизно на 33 %). Таке підвищення, як правило, не суттєве у більшості пацієнтів. Однак слід спостерігати за станом пацієнтів з високим ризиком токсичної дії дигоксину при одночасному призначенні еторикоксибу та дигоксину.

Вплив еторикоксибу на препарати, що метаболізуються сульфотрансферазами

Еторикоксиб є інгібітором активності сульфотрансферази людини, зокрема SULT1E1, а також може підвищувати концентрацію етинілестрадіолу в сироватці крові. Оскільки на даний час даних про вплив чисельних сульфотрансфераз недостатньо, а клінічні ефекти багатьох препаратів досі вивчають, доцільно з обережністю призначати еторикоксиб одночасно з іншими препаратами, що метаболізуються головним чином сульфотрансферазами людини (наприклад пероральний сальбутамол та міноксидил).

Вплив еторикоксибу на препарати, що метаболізуються ізоферментами CYP

За даними досліджень *in vitro*, не очікується пригнічення цитохромів P450 (CYP) 1A2, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1 або 3A4. У ході досліджень з участю здорових добровольців щоденне застосування еторикоксибу в дозі 120 мг не впливало на активність печінкового CYP3A4, що встановлено за еритроміциновим дихальним тестом.

Вплив інших препаратів на фармакокінетику еторикоксибу

Основний шлях обміну еторикоксибу залежить від ферментів CYP. CYP3A4 сприяє метаболізму еторикоксибу *in vivo*. Дослідження *in vitro* вказують на те, що CYP2D6, CYP2C9, CYP1A2 та CYP2C19 також можуть каталізувати основний шлях обміну еторикоксибу, але їх кількісні характеристики не вивчались *in vivo*.

Кетоконазол. Кетоконазол є потужним інгібітором CYP3A4. При застосуванні здоровим добровольцям у дозі 400 мг 1 раз на добу протягом 11 діб кетоконазол не чинив клінічно значущого впливу на фармакокінетику еторикоксибу в разовій дозі 60 мг (збільшення AUC на 43 %).

Вориконазол і міконазол. Одночасне застосування перорального вориконазолу або міконазолу у вигляді орального гелю для місцевого застосування (потужні інгібітори CYP3A4) з еторикоксибом спричиняло незначне підвищення експозиції еторикоксибу, що, однак, не вважалося клінічно значущим згідно з опублікованими даними.

Рифампіцин. Одночасне призначення еторикоксибу та рифампіцину (потужного індуктора ферментів CYP) призводило до зниження концентрації еторикоксибу у плазмі крові на 65 %. Це може супроводжуватися повторним проявом симптомів при одночасному застосуванні з еторикоксибом. Тоді як такі дані можуть вказувати на необхідність збільшення дози, не рекомендовано застосовувати еторикоксиб у дозах, що перевищують вказані для кожного показання, оскільки не вивчали комбіноване застосування рифампіцину та еторикоксибу в таких дозах (див. розділ «Спосіб застосування та дози»).

Антациди. Антацидні препарати не чинять клінічно значущого впливу на фармакокінетику еторикоксибу.

Особливості застосування

Вплив на шлунково-кишковий тракт (ШКТ)

Повідомляли про ускладнення з боку верхніх відділів ШКТ (перфорації, виразки або кровотечі), іноді з летальним наслідком, у пацієнтів, які застосовували еторикоксиб.

З обережністю слід призначати НПЗП пацієнтам з підвищеним ризиком ускладнень з боку ШКТ; пацієнтам літнього віку, пацієнтам, які застосовують будь-який інший НПЗП або ацетилсаліцилову кислоту одночасно, або пацієнтам зі шлунково-кишковими захворюваннями в анамнезі, такими як виразки та шлунково-кишкові кровотечі.

Існує додатковий ризик розвитку побічних ефектів з боку ШКТ (шлунково-кишкова виразка або інші ускладнення з боку шлунково-кишкового тракту) при одночасному застосуванні еторикоксибу та ацетилсаліцилової кислоти (навіть у низьких дозах). У ході тривалих клінічних досліджень не спостерігалось вираженої відмінності у безпеці щодо ШКТ при застосуванні селективного інгібітору ЦОГ-2 + ацетилсаліцилова кислота та НПЗП + ацетилсаліцилова кислота (див. розділ «Фармакодинаміка»).

Вплив на серцево-судинну систему

Клінічні дослідження вказують на те, що застосування лікарських засобів класу селективних інгібіторів ЦОГ-2 може бути пов'язано з ризиком виникнення тромботичних ускладнень (особливо інфаркту міокарда та інсульту) порівняно з плацебо та деякими НПЗП. Оскільки ризик серцево-судинних ускладнень зростає при збільшенні дози та тривалості застосування еторикоксибу, препарат слід призначати на якомога коротший період часу та в найнижчих ефективних добових дозах. Слід періодично переглядати потребу пацієнтів у симптоматичному полегшенні болю та реакцію на лікування, особливо у пацієнтів з остеоартритом (див. розділи «Спосіб застосування та дози», «Протипоказання», «Побічні реакції» і «Фармакодинаміка»).

Пацієнтам з вираженими факторами ризику розвитку серцево-судинних ускладнень (наприклад артеріальна гіпертензія, гіперліпідемія, цукровий діабет, куріння) призначати еторикоксиб слід лише після ретельної оцінки ризику (див. розділ «Фармакодинаміка»).

Селективні інгібітори ЦОГ-2 не замінюють застосування ацетилсаліцилової кислоти для профілактики тромбоемболічних серцево-судинних захворювань, оскільки не чинять антиагрегантної дії. Тому не слід відмінити антиагрегантні препарати (див. розділи «Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій» і «Фармакодинаміка»).

Вплив на нирки

Ниркові простагландини можуть відігравати компенсаторну роль у підтримці перфузії нирок. Тому при станах, що супроводжуються погіршенням перфузії нирок, застосування еторикоксибу може призводити до послаблення утворення простагландинів і, як наслідок, до ниркового кровотоку, тим самим погіршуючи функцію нирок. Високий ризик розвитку такої реакції існує у пацієнтів з уже наявним вираженим порушенням функції нирок, некомпенсованою серцевою недостатністю або цирозом. У таких пацієнтів слід контролювати функцію нирок.

Затримка рідини, набряки та артеріальна гіпертензія

Затримка рідини, набряки та артеріальна гіпертензія спостерігалися у пацієнтів, які отримували еторикоксиб. Усі НПЗП, включаючи еторикоксиб, можуть призводити до розвитку або рецидиву застійної серцевої недостатності. Інформацію про реакцію залежно від дози еторикоксибу див. у розділі «Фармакодинаміка». З обережністю препарат слід призначати пацієнтам із серцевою недостатністю, порушенням функції лівого шлуночка або артеріальною гіпертензією в анамнезі, а також пацієнтам з набряками, що виникли з будь-яких інших причин. При клінічних ознаках погіршення стану таких пацієнтів слід вжити відповідних заходів, включаючи відміну еторикоксибу.

Еторикоксиб може призводити до частішої та тяжчої артеріальної гіпертензії порівняно з деякими іншими НПЗП та селективними інгібіторами ЦОГ-2, особливо у високих дозах. Тому артеріальну гіпертензію слід контролювати до початку лікування еторикоксибом (див. розділ «Протипоказання») та особливу увагу слід приділити контролю за артеріальним тиском під час лікування еторикоксибом. Артеріальний тиск слід контролювати протягом двох тижнів після початку лікування, а потім — періодично. Якщо артеріальний тиск суттєво підвищується, слід розглянути можливість альтернативного лікування.

Вплив на печінку

Підвищення рівня аланінамінотрансферази (АЛТ) та/або аспаратамінотрансферази (АСТ) (приблизно в 3 або більше разів порівняно з верхньою межею норми) спостерігалось приблизно в 1 % пацієнтів, які брали участь у клінічних дослідженнях та застосовували еторикоксиб у дозах 30 мг, 60 мг та 90 мг на добу протягом періоду до 1 року.

Слід спостерігати за станом усіх пацієнтів із симптомами та/або ознаками порушення функції печінки, а також пацієнтів з патологічними показниками функції печінки. При ознаках порушення функції печінки та при стійких патологічних змінах показників функції печінки (в 3 рази вище за верхню межу норми) еторикоксиб слід відмінити.

Загальні положення

Якщо протягом лікування у пацієнта спостерігається погіршення функції будь-якої із систем органів, зазначених вище, слід вжити відповідних заходів та розглянути питання про відміну еторикоксибу. Слід забезпечити відповідний медичний нагляд при застосуванні еторикоксибу пацієнтам літнього віку та пацієнтам з порушенням функції нирок, печінки або серця.

З обережністю слід розпочинати лікування еторикоксибом пацієнтів з дегідратацією. Рекомендовано провести регідратацію до початку застосування еторикоксибу.

Під час післяреєстраційного спостереження дуже рідко повідомляли про розвиток серйозних шкірних реакцій, у деяких випадках з летальним наслідком, у тому числі ексфоліативного дерматиту, синдрому Стівенса–Джонсона і токсичного епідермального некролізу при застосуванні НПЗП і деяких селективних інгібіторів ЦОГ-2 (див. розділ «Побічні реакції»). Найвищий ризик розвитку таких реакцій у пацієнтів — на початку терапії, а початок їх проявів у більшості випадків — протягом першого місяця лікування. Серйозні реакції підвищеної чутливості (такі як анафілаксія і ангіоневротичний набряк) спостерігалися у пацієнтів, які отримують еторикоксиб (див. розділ «Побічні реакції»). Деякі селективні інгібітори ЦОГ-2 підвищують ризик виникнення шкірних реакцій у пацієнтів з алергічною реакцією до будь-якого препарату в анамнезі. Еторикоксиб слід відмінити при перших проявах висипу на шкірі, ушкоджень слизової оболонки або інших ознаках реакції підвищеної чутливості.

При застосуванні еторикоксибу можуть маскуватися прояви гарячки та інші ознаки запального процесу.

З обережністю призначати одночасно еторикоксиб та варфарин або інші пероральні антикоагулянти (див. розділ «Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій»).

Застосування еторикоксибу не рекомендовано жінкам, які планують вагітність (див. розділи «Застосування у період вагітності або годування груддю» та «Фармакодинаміка»).

Лактоза

Пацієнтам із рідкісними спадковими порушеннями, такими як непереносимість галактози, дефіцит лактази Лаппа або порушення всмоктування глюкози-галактози, не слід приймати цей лікарський засіб.

Натрій

Цей лікарський засіб містить менше ніж 1 ммоль натрію (23 мг) в 1 таблетці, вкритій плівковою оболонкою, тобто практично не містить натрію.

Застосування у період вагітності або годування груддю

Вагітність

Немає клінічних даних про застосування еторикоксибу у період вагітності. Дослідження на тваринах показали репродуктивну токсичність препарату. Потенційний ризик для вагітних жінок невідомий. Як і інші препарати, що інгібують синтез простагландинів, еторикоксиб може призвести до відсутності скорочень матки та передчасного закриття боталової протоки в останньому триместрі вагітності. Застосування еторикоксибу протипоказано у період вагітності (див. розділ «Протипоказання»). Якщо жінка завагітніла під час лікування, еторикоксиб необхідно відмінити.

Грудне годування

Невідомо, чи проникає еторикоксиб у грудне молоко людини. У щурів еторикоксиб проникає у грудне молоко. Жінки, які застосовують еторикоксиб, не повинні годувати груддю (див. розділ «Протипоказання»).

Фертильність

Застосування еторикоксибу, як і інших препаратів, що інгібують ЦОГ-2, не рекомендовано жінкам, які планують вагітність.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами

Пацієнти, у яких під час застосування еторикоксибу виникає запаморочення, вертиго або сонливість, не повинні керувати автотранспортом та працювати з іншими механізмами.

Спосіб застосування та дози

Дозування

Оскільки ризик серцево-судинних ускладнень зростає при збільшенні дози та тривалості застосування еторикоксибу, препарат слід призначати на якомога коротший період часу та в найнижчих ефективних добових дозах. Слід періодично переглядати потребу пацієнтів у симптоматичному полегшенні болю та реакцію на лікування, особливо у пацієнтів з остеоартритом (див. розділи «Протипоказання», «Особливості застосування», «Побічні реакції» та «Фармакодинаміка»).

Остеоартрит

Рекомендована доза становить 30 мг 1 раз на добу. Оскільки така доза неможлива при застосуванні цих лікарських засобів, слід використовувати інші препарати з такою силою дії. У деяких пацієнтів при недостатньому послабленні симптомів збільшення дози до 60 мг 1 раз на добу може підвищити ефективність. У разі відсутності збільшення терапевтичного ефекту слід розглянути інші варіанти лікування.

Ревматоїдний артрит

Рекомендована доза становить 60 мг 1 раз на добу. У деяких пацієнтів при недостатньому послабленні симптомів збільшення дози до 90 мг 1 раз на добу може підвищити ефективність. При досягненні клінічної стабілізації пацієнта доцільно зменшити дозу до 60 мг 1 раз на добу. У разі відсутності збільшення терапевтичного ефекту слід розглянути інші варіанти лікування.

Анкілозуючий спондиліт

Рекомендована доза становить 60 мг 1 раз на добу. У деяких пацієнтів при недостатньому послабленні симптомів збільшення дози до 90 мг 1 раз на добу може підвищити ефективність. При досягненні клінічної стабілізації пацієнта доцільно зменшити дозу до 60 мг 1 раз на добу. У разі відсутності збільшення терапевтичного ефекту слід розглянути інші варіанти лікування.

Стани, що супроводжуються гострим болем

У разі появи гострого болю еторикоксиб можна застосовувати лише у гострий симптоматичний період.

- *Гострий подагричний артрит*

Рекомендована доза становить 120 мг 1 раз на добу. Під час клінічних досліджень гострого подагричного артриту еторикоксиб застосовували впродовж 8 днів.

- *Післяопераційний біль, пов'язаний зі стоматологічним оперативним втручанням*

Рекомендована доза становить 90 мг на 1 раз на добу протягом максимум 3 днів. Для деяких пацієнтів протягом триденного періоду лікування може бути необхідним додаткове післяопераційне знеболювання у доповненні до лікарського засобу Айкідол.

Дози, що перевищують рекомендовані для кожного показання, не мають додаткової ефективності або їх не вивчали.

Таким чином

Доза при остеоартриті не повинна перевищувати 60 мг на добу.

Доза при ревматоїдному артриті та анкілозуючому спондиліті не повинна перевищувати 90 мг на добу.

Доза при гострій подагрі не повинна перевищувати 120 мг на добу впродовж максимального періоду лікування 8 днів.

Доза при гострому болю після стоматологічного оперативного втручання не повинна перевищувати 90 мг на добу впродовж максимального періоду лікування 3 днів.

Окремі групи пацієнтів

Пацієнти літнього віку

Немає необхідності в корекції дозування для пацієнтів літнього віку. Препарат слід призначати з обережністю пацієнтам літнього віку (див. розділ «Особливості застосування»).

Пацієнти з порушенням функції печінки

Незалежно від показання пацієнтам з порушенням функції печінки легкого ступеня (5–6 балів за шкалою Чайлда–П'ю) не слід перевищувати дозу 60 мг 1 раз на добу. Пацієнтам з порушеннями функції печінки середнього ступеня тяжкості (7–9 балів за шкалою Чайлда–П'ю) незалежно від показання не слід перевищувати дозу 30 мг 1 раз на добу.

Клінічний досвід застосування обмежений, особливо щодо пацієнтів з порушеннями функції печінки середнього ступеня тяжкості, тому препарат слід призначати з обережністю. Відсутній клінічний досвід застосування препарату пацієнтам з порушенням функції печінки тяжкого ступеня (≥ 10 балів за шкалою Чайлда–П'ю); тому препарат протипоказаний таким пацієнтам (див. розділи «Протипоказання», «Особливості застосування» та «Фармакокінетика»).

Пацієнти з порушенням функції нирок

Коригування дози не потрібне пацієнтам із кліренсом креатиніну ≥ 30 мл/хв (див. розділ «Фармакокінетика»). Застосування еторикоксибу пацієнтам із кліренсом креатиніну < 30 мл/хв протипоказано (див. розділи «Протипоказання» та «Особливості застосування»).

Спосіб застосування

Еторикоксиб призначений для перорального застосування та його можна застосовувати незалежно від прийому їжі. Початок дії лікарського засобу може бути швидшим, якщо Аїкідол приймати без їжі. Це слід враховувати, коли потрібне швидке полегшення симптомів.

Діти

Еторикоксиб протипоказаний дітям і підліткам віком до 16 років (див. розділ «Протипоказання»).

Передозування

У ході клінічних досліджень застосування разової дози еторикоксибу до 500 мг або багаторазовий прийом до 150 мг на добу протягом 21 дня не спричиняли істотних токсичних ефектів. Повідомляли про гостре передозування еторикоксибом, хоча у більшості випадків про побічні реакції не повідомляли. Побічні реакції, що спостерігалися найчастіше, відповідали профілю безпеки еторикоксибу (такі як реакції з боку ШКТ і кардіоренальні ускладнення).

У разі передозування доцільно вжити звичайних підтримувальних заходів, наприклад видалення неабсорбованого препарату із ШКТ, ведення клінічного спостереження, у разі необхідності — проведення підтримувального лікування.

Еторикоксиб не виводиться при гемодіалізі; невідомо, чи виводиться препарат при проведенні перитонеального діалізу.

Побічні реакції

Короткий огляд профілю безпеки

Безпеку застосування еторикоксибу оцінювали в ході клінічних досліджень з участю 9295 пацієнтів, включаючи 6757 пацієнтів з остеоартритом, ревматоїдним артритом, хронічним болем у нижній частині спини або анкілозуючим спондилітом (приблизно 600 пацієнтів з остеоартритом або ревматоїдним артритом одержували лікування протягом 1 року або довше).

Під час клінічних досліджень профіль небажаних явищ був однаковим у пацієнтів з остеоартритом або ревматоїдним артритом, які отримували еторикоксиб протягом 1 року або довше.

У ході клінічного дослідження з участю пацієнтів із гострим подагричним артритом еторикоксиб призначали в дозі 120 мг 1 раз на добу протягом 8 діб. Профіль небажаних явищ у цьому дослідженні був у цілому таким самим, як у дослідженнях з участю пацієнтів з остеоартритом, ревматоїдним артритом та хронічним болем у нижній частині спини.

У програмі оцінки безпеки для серцево-судинної системи за даними трьох контрольованих досліджень з активним препаратом порівняння 17 412 пацієнтів з остеоартритом або ревматоїдним артритом отримували еторикоксиб (у дозах 60 мг або 90 мг) у середньому впродовж приблизно 18 місяців. Дані про безпеку та більш детальна інформація про цю програму представлені в розділі «Фармакодинаміка».

У ході клінічних досліджень з участю пацієнтів із гострим післяопераційним болем після стоматологічних втручань, включаючи 614 пацієнтів, які застосовували еторикоксиб (у дозах 90 мг або 120 мг), профіль небажаних явищ був у цілому подібним профілю у дослідженнях з участю пацієнтів з остеоартритом, ревматоїдним артритом та хронічним болем у нижній частині спини.

Перелік побічних реакцій у вигляді таблиці

Про нижчезазначені побічні реакції повідомляли з більшою частотою при застосуванні препарату, ніж плацебо, у ході клінічних досліджень з участю пацієнтів з остеоартритом, ревматоїдним артритом, хронічним болям у нижній частині спини або анкілозуючим спондилітом, які отримували еторикоксиб у дозі 30 мг, 60 мг або 90 мг протягом періоду до 12 тижнів; під час дослідження за програмою MEDAL — протягом періоду до 3,5 року; в короткострокових дослідженнях гострого болю — протягом періоду до 7 діб; або з даних післяреєстраційного досвіду (див. таблицю 2).

Категорія частоти визначається для кожного терміну побічного явища за частотою в базі даних клінічних досліджень: дуже часто ($\geq 1/10$); часто ($\geq 1/100$, $< 1/10$); нечасто ($\geq 1/1000$, $< 1/100$); рідко ($\geq 1/10000$, $< 1/1000$); дуже рідко ($< 1/10000$).

Таблиця 2

Клас системи органів	Побічні реакції	Категорія частоти
<i>Інфекції та інвазії</i>	альвеолярний остит	Часто
	гастроентерит, інфекції верхніх дихальних шляхів, інфекції сечовивідного тракту	Нечасто
<i>З боку крові та лімфатичної системи</i>	анемія (переважно в результаті шлунково-кишкової кровотечі), лейкопенія, тромбоцитопенія	Нечасто
<i>Порушення з боку імунної системи</i>	реакції підвищеної чутливості ‡ ^B	Нечасто
	ангіоневротичний набряк / анафілактичні / анафілактоїдні реакції, у тому числі шок ‡	Рідко
<i>Порушення з боку обміну речовин та харчування</i>	Набряки / затримка рідини	Часто
	зниження або посилення апетиту, збільшення маси тіла	Нечасто
<i>Порушення з боку психіки</i>	тривожність, депресія, погіршення розумової діяльності, галюцинації ‡	Нечасто
	сплутаність свідомості ‡, неспокійний стан ‡	Рідко
<i>Порушення з боку нервової системи</i>	запаморочення, головний біль	Часто
	дисгевзія, безсоння, парестезія / гіпестезія, сонливість	Нечасто
<i>Порушення з боку органів зору</i>	нечіткість зору, кон'юнктивіт	Нечасто
<i>Порушення з боку органів слуху та рівноваги</i>	шум у вухах, запаморочення	Нечасто
<i>Розлади з боку серцевої системи</i>	пальпітація, аритмія ‡	Часто
	фібриляція передсердь, тахікардія ‡, застійна серцева недостатність, неспецифічні зміни на ЕКГ, стенокардія ‡, інфаркт міокарда §	Нечасто
<i>Розлади з боку судинної системи</i>	артеріальна гіпертензія	Часто
	припливи, порушення мозкового кровообігу §, транзиторна ішемічна атака, гіпертонічний криз ‡, васкуліт ‡	Нечасто
<i>Порушення з боку респіраторної системи, органів</i>	bronхоспазм ‡	Часто
	кашель, диспное, носова кровотеча	Нечасто

<i>грудної клітини та середостіння</i>		
<i>Порушення з боку шлунково-кишкового тракту</i>	біль у животі	Дуже часто
	запор, метеоризм, гастрит, печія / кислотний рефлюкс, діарея, диспепсія / дискомфорт у ділянці епігастрія, нудота, блювання, езофагіт, виразки в ротовій порожнині	Часто
	здуття живота, зміна характеру перистальтики кишечника, сухість у роті, гастродуоденальні виразки, пептичні виразки, у тому числі перфорація і кровотеча ШКТ, синдром подразненого кишечника, панкреатит ‡	Нечасто
<i>Порушення з боку печінки і жовчовивідних шляхів</i>	підвищення АЛТ, підвищення АСТ	Часто
	гепатит ‡	Рідко
	печінкова недостатність ‡, жовтяниця ‡	Рідко †
<i>Порушення з боку шкіри і підшкірної клітковини</i>	екхімоз	Часто
	набряк обличчя, свербіж, висип, еритема ‡, кропив'янка ‡	Нечасто
	синдром Стівенса–Джонсона ‡, токсичний епідермальний некроліз ‡, стійкий медикаментозний висип ‡	Рідко †
<i>Порушення з боку кістково-м'язової системи та сполучної тканини</i>	Спазми / судоми м'язів, скелетно-м'язовий біль / скутість	Нечасто
<i>Порушення з боку нирок і сечовивідних шляхів</i>	протеїнурія, підвищення рівня креатиніну в сироватці крові, ниркова недостатність / дисфункція ‡ (див. розділ «Особливості застосування»)	Нечасто
<i>Загальні порушення та реакції у місці застосування</i>	Астенія / втома, грипоподібні симптоми	Часто
	біль у грудях	Нечасто
<i>Лабораторні дослідження</i>	підвищення рівня азоту сечовини крові, підвищення рівня креатинфосфокінази, гіперкаліємія, підвищення рівня сечової кислоти	Нечасто
	зниження рівня натрію в крові	Рідко
<p>‡ Побічна реакція ідентифікована у ході післяреєстраційного спостереження. Частота визначалася за максимальною частотою у клінічних дослідженнях (дані зібрані за затвердженими показаннями та дозами).</p> <p>† Категорія частоти «рідко» визначалася відповідно до короткої характеристики лікарського засобу (КХЛЗ) (ред. 2, вересень 2009 р.) на підставі розрахованої верхньої межі 95 % довірчого інтервалу для 0 явищ з урахуванням кількості учасників, які приймали лікарський засіб еторикоксид, в аналізі даних III фази, об'єднаних за дозою і показанням (n=15 470).</p> <p>‡ Реакції підвищеної чутливості включають такі терміни, як алергія, медикаментозна алергія, медикаментозна гіперчутливість, гіперчутливість, гіперчутливість неуточнена, реакція гіперчутливості і неуточнена алергія.</p>		

§ За результатами аналізу тривалих, контрольованих за допомогою плацебо і активного препарату порівняння клінічних досліджень, селективні інгібітори ЦОГ-2 були пов'язані зі збільшенням ризику виникнення серйозних артеріальних тромботичних подій, включаючи інфаркт міокарда та інсульт. Базуючись на наявних даних, малоймовірно, що збільшення абсолютного ризику виникнення таких явищ перевищить 1 % на рік (нечасто).

При застосуванні НПЗП повідомляли про такі серйозні побічні реакції: нефротоксичність, включаючи інтерстиціальний нефрит і нефротичний синдром, тому не можна виключати їх виникнення при застосуванні еторикоксибу.

Важливо повідомляти про підозрювані небажані реакції після реєстрації лікарського засобу. Це забезпечує можливість постійного моніторингу співвідношення користі / ризику застосування лікарського засобу. Фахівців галузі охорони здоров'я просять повідомляти про будь-які підозрювані небажані реакції.

Повідомлення про побічні реакції після реєстрації лікарського засобу має важливе значення. Це дає змогу проводити моніторинг співвідношення користі / ризик при застосуванні цього лікарського засобу. Медичним та фармацевтичним працівникам, а також пацієнтам або їх законним представникам слід повідомляти про усі випадки підозрюваних побічних реакцій та відсутності ефективності лікарського засобу через Автоматизовану інформаційну систему з фармаконагляду за посиланням: <https://aisf.dec.gov.ua/>.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання. Лікарський засіб не потребує особливих умов зберігання. Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка. По 7 таблеток у блістері; по 1 або 4 блістери в картонній пацці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. Атлантік Фарма Продусоеш Фармачеутікаш, С.А. (Atlantic Pharma Producoes Farmaceuticas, S.A.).

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності

Руа Де Тапада Гранде 2, 2710-228 Абрунхейра, Сінтра, Португалія (Rua De Tapada Grande 2, 2710-228 Abrunheira, Sintra, Portugal).

Заявник

Асіно АГ (Acino AG).

Місцезнаходження заявника

Леопольдштрассе 115, 80804 Мюнхен, Німеччина (Leopoldstrasse 115, 80804 Munchen, Germany).

У разі виникнення побічних ефектів та запитань щодо безпеки застосування лікарського засобу просимо звертатися до відділу фармаконагляду ТОВ «АСІНО УКРАЇНА» за адресою: бульвар Вацлава Гавела, 8, м. Київ, 03124, тел/факс: +38 044 281 2333.

Дата останнього перегляду 15.01.2026