МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ И СОЦИАЛЬНОГО РАЗВИТИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ
по применению лекарственного препарата для медицинского применения

Медсикам®

Регистрационный номер:

Торговое наименование

Медсикам®

Международное непатентованное наименование

Мелоксикам

Химическое название

4-гидрокси-2-метил-*N*-(5-метилтиазол-2-ил)-2H-1,2-бензотиазин-3-карбоксамид-1,1-диоксид

Лекарственная форма

Таблетки

Состав

1 таблетка содержит:

Активное вещество: мелоксикам 7,5 мг, 15 мг

Вспомогательные вещества: крахмал кукурузный 84,5 мг; лактозы моногидрат 60,0 мг; повидон-К30 5 мг; целлюлоза микрокристаллическая 30,0 мг; карбоксиметилкрахмал натрия тип А 4,0 мг; кроскармеллоза натрия 3,0 мг; магния стеарат 2,0 мг; тальк 4,0 мг.

Описание

Круглые плоские таблетки светло-желтоватого цвета, с риской на одной стороне

Фармакотерапевтическая группа

Нестероидный противовоспалительный препарат (НПВП)

Код АТХ: M01AC06

Фармакологическое действие

Фармакодинамика

Нестероидный противовоспалительный препарат, обладающий обезболивающим, противовоспалительным и жаропонижающим действием. Противовоспалительное действие связано с торможением ферментативной активности циклооксигеназы-2 (ЦОГ-2), участвующей в биосинтезе простагландинов в области воспаления. В меньшей степени препарат действует на циклооксигеназу-1 (ЦОГ-1), участвующую в синтезе простагландина, защищающего слизистую оболочку желудочно-кишечного тракта и принимающего участие в регуляции кровотока в почках.

Фармакокинетика

Хорошо всасывается из желудочно-кишечного тракта, биодоступность – 89 %. Одновременный приём пищи не изменяет всасывание. При использовании препарата внутрь в дозах 7,5 и 15 мг его концентрации пропорциональны дозам. Равновесные концентрации достигаются в течение 3 – 5 дней. При длительном применении препарата (более 1 года), концентрации сходны с таковыми, которые отмечаются после первого достижения равновесных концентраций. Связывание с белками плазмы составляет более 99 %. Диапазон различий между максимальными и базальными концентрациями препарата после его приема один раз в день относительно невелик и составляет при использовании дозы 7,5 мг 0,4-1,0 мкг/мл, а при использовании дозы 15 мг 0,8-2,0 мкг/мл (соответственно C_{min} и

C_{max}). Мелоксикам проникает через гистогематические барьеры, концентрация в синовиальной жидкости достигает 50 % максимальной концентрации препарата в плазме.

Почти полностью метаболизируется в печени с образованием четырех неактивных в фармакологическом отношении производных. Основной метаболит, 5'-карбоксимелоксикам (60 % от дозы), образуется путем окисления промежуточного метаболита 5'-гидроксиметилмелоксикама, который также экскретируется, но в меньшей степени (9 % от дозы). Исследования in vitro показали, что в данном метаболическом превращении важную роль играет изофермент CYP 2C9, дополнительное значение имеет изофермент CYP 3A4. В образовании двух других метаболитов (соответственно, 16 % и 4 % от дозы препарата) принимает участие пероксидаза, активность которой, вероятно, индивидуально варьирует:

Выводится в равной степени через кишечник и почки, преимущественно в виде метаболитов. Через кишечник в неизменном виде выводится менее 5 % от величины суточной дозы, в моче в неизменном виде препарат обнаруживается только в следовых количествах. Период полувыведения ($T_{1/2}$) мелоксикама составляет 15-20 часов. Плазменный клиренс составляет в среднем 8 мл/мин. У лиц пожилого возраста клиренс препарата снижается. Объём распределения низкий, и составляет в среднем 11 л.

Печеночная или почечная недостаточность средней степени тяжести не оказывает существенного влияния на фармакокинетику препарата.

Показания

- остеоартроз;
- ревматоидный артрит;
- анкилозирующий спондилоартрит (болезнь Бехтерева).

Предназначен для симптоматической терапии, уменьшения боли и воспаления на момент использования, на прогрессирование заболевания не влияет.

Противопоказания

- гиперчувствительность к активному веществу или вспомогательным компонентам;
- противопоказан в период после проведения аортокоронарного шунтирования;
- декомпенсированная сердечная недостаточность;
- полное или неполное сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза носа и околоносовых пазух и непереносимости ацетилсалициловой кислоты и других нестероидных противовоспалительных средств (в т.ч. в анамнезе);
- эрозивно-язвенные изменения слизистой оболочки желудка или 12-перстной кишки в стадии обострения, активное желудочно-кишечное кровотечение;
- воспалительные заболевания кишечника (неспецифический язвенный колит, болезнь Крона);
- цереброваскулярное кровотечение или иные кровотечения;
- выраженная печеночная недостаточность или активное заболевание печени;
- выраженная почечная недостаточность у больных, не подвергающихся диализу (клиренс креатинина менее 30 мл/мин), прогрессирующие заболевания почек в т.ч. подтвержденная гиперкалиемия;
- беременность, период грудного вскармливания;
- детский возраст до 15 лет.

В связи с наличием в составе препарата лактозы пациентам с редкими наследственными заболеваниями, такими как непереносимость лактозы, дефицит лактазы или глюкозо-галактозной мальабсорбцией принимать препарат не следует.

С осторожностью

Использовать с осторожностью при:

ишемической болезни сердца, цереброваскулярных заболеваниях, застойной сердечной недостаточности, дислипидемии/гиперлипидемии, сахарном диабете, заболеваниях периферических артерий, курении, клиренсе креатинина менее 60 мл/мин, анамнестических данных о развитии язвенного поражения желудочно-кишечного тракта, при наличии инфекции Helicobacter pylori, в пожилом возрасте, при длительном использовании нестероидных противовоспалительных средств, частом употреблении алкоголя, тяжелых соматических заболеваниях, сопутствующей терапии следующими препаратами: антикоагулянты (например, варфарин), антиагреганты (например, ацетилсалициловая кислота, клопидогрел), пероральные глюкокортикостероиды (например, преднизолон), селективные ингибиторы обратного захвата серотонина (например, циталопрам, флуоксетин, пароксетии, сертралин).

Способ применения и дозы

Препарат принимают внутрь во время еды один раз в день.

Рекомендуемый режим дозирования:

- Ревматоидный артрит: 15 мг в сутки. В зависимости от лечебного эффекта доза может быть снижена до 7,5 мг в сутки.
- Остеоартроз: 7,5 мг в сутки. При неэффективности доза может быть увеличена до 15 мг в сутки.

- Анкилозирующий спондилоартрит: 15 мг в сутки. Максимальная суточная доза не должна превышать 15 мг.

У пациентов с повышенным риском развития побочных эффектов, а также у пациентов с выраженной почечной недостаточностью, находящихся на гемодиализе, доза не должна превышать 7,5 мг в сутки.

Побочное действие

Со стороны желудочно-кишечного тракта: более 1 % - диспепсия, в т.ч. тошнота, рвота, абдоминальные боли, запор, метеоризм, диарея; 0,1-1 % - преходящее повышение активности "печеночных" трансаминаз, гипербилирубинемия, отрыжка, эзофагит, гастродуоденальная язва, кровотечение из желудочно-кишечного тракта, колит, гепатит, гастрит.

Со стороны органов кроветворения: более 1 % - анемия, 0,1 – 1 % изменение формулы крови, в т.ч. лейкопения, тромбоцитопения.

Со стороны кожных покровов: более 1 % - зуд, кожная сыпь; 0,1 – 1 % - крапивница; менее 0,1 % - фотосенсибилизация, буллезные высыпания, мультиформная эритема, в т.ч. синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз.

Со стороны дыхательной системы: менее 0,1 % - бронхоспазм.

Со стороны нервной системы: более 1 % - головокружение, головная боль; 0,1 – 1 % - вертиго, шум в ушах, сонливость; менее 0,1 % - спутанность сознания, дезориентация, эмоциональная лабильность.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: более 1 % - периферические отеки; 0,1 – 1 % - повышение артериального давления, сердцебиение, "приливы" крови к коже лица.

Со стороны мочевыделительной системы: 0,1 – 1 % - гиперкреатининемия и/или повышение мочевины в сыворотке крови; менее

0,1 % - острая почечная недостаточность; связь с приемом мелоксикама не установлена – интерстициальный нефрит, альбуминурия, гематурия.

Со стороны органов чувств: менее 0,1 % - конъюнктивит, нарушение зрения, в т.ч. нечеткость зрения.

Аллергические реакции: менее 0,1 % - ангионевротический отек, анафилактоидные/анафилактические реакции.

Передозировка

Симптомы: нарушение сознания, тошнота, рвота, боли в эпигастрии, желудочно-кишечное кровотечение, острая почечная недостаточность, печеночная недостаточность, остановка дыхания, асистолия.

Лечение: специфического антидота нет; при передозировке препарата следует провести промывание желудка, прием активированного угля (в течение ближайшего часа), симптоматическая терапия. Колестирамин ускоряет выведение препарата из организма. Форсированный диурез, гемодиализ – малоэффективны из-за высокой связи препарата с белками крови.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

При одновременном применении с другими нестероидными противовоспалительными препаратами (а также с ацетилсалициловой кислотой) увеличивается риск возникновения эрозивно-язвенных поражений и кровотечений из желудочно-кишечного тракта.

При одновременном применении с гипотензивными препаратами, возможно снижение эффективности действия последних.

При одновременном применении с препаратами лития возможно развитие кумуляции лития и увеличения его токсического действия (рекомендуется контроль концентрации лития в крови).

При одновременном применении с метотрексатом усиливается побочное действие последнего на кроветворную систему (опасность возникновения анемии и лейкопении, показан периодический контроль общего анализа крови).

При одновременном применении с диуретиками и циклоспорином возрастает риск развития почечной недостаточности.

При одновременном применении с антикоагулянтами (гепарин, тиклопидин, варфарин), а также с тромболитическими препаратами (стептокиназа, фибринолизин) увеличивается риск развития кровотечений (необходим периодический контроль показателей свёртываемости крови).

При одновременном применении с селективными ингибиторами обратного захвата серотонина возрастает риск развития желудочно-кишечных кровотечений.

Особые указания

Следует соблюдать осторожность при применении препарата у пациентов, в анамнезе у которых язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, а также у пациентов, находящихся на антикоагулянтной терапии. У таких пациентов повышен риск возникновения язвенно-эрозивных заболеваний желудочно-кишечного тракта.

Следует соблюдать осторожность и контролировать показатели функции почек при применении препарата у пациентов пожилого возраста, пациентов с хронической сердечной недостаточностью с явлениями недостаточности кровообращения, у пациентов с циррозом печени, а также у пациентов с гиповолемией в результате хирургических вмешательств.

У пациентов с почечной недостаточностью, если клиренс креатинина более 30 мл/мин, не требуется коррекция режима дозирования.

У пациентов, находящихся на гемодиализе, дозировка препарата не должна превышать 7,5 мг/сутки.

При стойком и существенном повышении трансаминаз и изменений других показателей функции печени препарат следует отменить и провести контрольные тесты.

Пациенты, принимающие одновременно мочегонные средства и мелоксикам, должны принимать достаточное количество жидкости.

Если в процессе лечения возникли аллергические реакции (зуд, кожная сыпь, крапивница, фотосенсибилизация), необходимо прекратить прием препарата.

Мелоксикам, также как и другие нестероидные противовоспалительные препараты, может маскировать симптомы инфекционных заболеваний.

Применение мелоксикама, как и других препаратов, блокирующих синтез простагландинов, может влиять на фертильность, поэтому он не рекомендуется женщинам планирующим беременность.

Влияние на способность к управлению автотранспортом и механизмами

Применение препарата может вызывать возникновение нежелательных эффектов в виде головной боли и головокружений, сонливости. Следует отказаться от управления транспортными средствами и обслуживания машин и механизмов, требующих концентрации внимания.

Форма выпуска

Таблетки 7,5 мг и 15 мг.

10 таблеток в блистер из ПВХ/алюминиевой фольги.

1, 2 или 3 блистера в картонную пачку вместе с инструкцией по применению.

Условия хранения

При температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года

Не использовать по истечении срока годности.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Производитель

Стандарт Медсинс Пвт. Лтд., Индия (Standard Medicines Pvt. Ltd., India)

A/108, 1й этаж, комплекс Шрейяс, Нр. Веджалпур Бас Стэнд, Ахмедабад-380051, Гуярат, Индия.

Владелец регистрационного удостоверения – организация, принимающая претензии от потребителей:

ООО "Фармактивы", 129301, г. Москва, ул. Ярославская, д. 6/4, стр. 1

Тел./факс: (495) 287-01-05.

Генеральный директор
ООО "Фармактивы" Петрухин М.А.