МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ И СОЦИАЛЬНОГО РАЗВИТИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

МЕЛОКС®

Регистрационный номер:

Торговое название препарата: Мелокс®

Международное непатентованное название (МНН): Мелоксикам

Лекарственная форма: таблетки.

Состав:

Каждая таблетка содержит:

Активное вещество:		
Мелоксикам	7,5 мг	15 мг
Вспомогательные вещества:		
Натрия цитрата дигидрат	13,50 мг	27,00 мг
Лактозы моногидрат	18,75 мг	37,50 мг
Целлюлоза микрокристаллическая	85,00 мг	170,00 мг
Повидон	8,25 мг	16,50 мг
Кросповидон	12,50 мг	25,00 мг
Кремния диоксид коллоидный	3,00 мг	6,00 мг
Магния стеарат	1,50 мг	3,00 мг

Описание: светло-желтые круглые, плоские таблетки с разделительной риской на одной стороне. Допустимы незначительная мраморность, вкрапления и шероховатость поверхности.

Фармакотерапевтическая группа: нестероидный противовоспалительный препарат.

Код АТХ: [M01AC06]

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Мелоксикам – нестероидный противовоспалительный препарат (НПВП), оказывающий противовоспалительное, обезболивающее и жаропонижающее действие.

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

Фармакокинетика

После перорального приема мелоксикам хорошо абсорбируется из ЖКТ. Биодоступность около 90 %. Одновременный прием пищи не изменяет всасывание. При использовании препарата внутрь в дозах 7,5 и 15 мг его концентрации пропорциональны дозам. Максимальная концентрация в плазме крови (около 1000 мкг/л для дозы 7,5 мг) после однократного приема достигается приблизительно через 4–6 часов. Равновесные концентрации достигаются в течение 3–5 дней. При длительном приеме препарата (более 1 года), концентрации сходны с таковыми, которые отмечаются после первого достижения устойчивого состояния фармакокинетики. 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 значения Cmin и Cmax). Мелоксикам проникает через гистогематические барьеры. Концентрация препарата в синовиальной жидкости достигает 40–50 % от максимальной концентрации препарата в плазме крови.

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

Выводится препарат в равной степени с калом и мочой, преимущественно в виде метаболитов. В неизменном виде выводится менее 5 % от величины суточной дозы, а в моче в неизменном виде мелоксикам обнаруживается лишь в следовых количествах. Период полувыведения мелоксикама составляет 15–20 ч. Плазменный клиренс в среднем 8 мл/мин. У лиц пожилого возраста клиренс препарата снижается.

Объем распределения низкий и составляет в среднем 11 л.

Препарат не выводится с помощью диализа.

Умеренные нарушения функции печени и/или почек не оказывают существенного влияния на фармакокинетику мелоксикама.

Показания к применению

- Симптоматическое лечение ревматоидного артрита;
- Симптоматическое лечение остеоартроза;
- Симптоматическое лечение анкилозирующего спондилита (Болезнь Бехтерева).

Противопоказания

- гиперчувствительности к мелоксикаму или другому компоненту препарата, включая анамнестические сведения;
- сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза носа и околоносовых пазух и непереносимости ацетилсалициловой кислоты и лекарственных средств пиразолонового ряда;
- язвенная болезнь желудка и 12-перстной кишки (в фазе обострения);
- воспалительные заболевания кишечника (в фазе обострения);
- цереброваскулярные или иные кровотечения;
- тяжелая печеночная недостаточность или активное заболевание печени;
- хроническая почечная недостаточность у больных, не подвергающихся диализу (клиренс креатинина менее 30 мл/мин), прогрессирующие заболевания почек, подтвержденная гиперкалиемия;
- активное желудочно-кишечное кровотечение;
- тяжелая неконтролируемая сердечная недостаточность;
- состояния после проведения аортокоронарного шунтирования;
- врожденный дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция;
- дети в возрасте до 15 лет;
- беременность;
- период грудного вскармливания.

С осторожностью:

Пожилой возраст, ишемическая болезнь сердца, хроническая сердечная недостаточность, цереброваскулярные заболевания, дислипидемия/гиперлипидемия, сахарный диабет, заболевания периферических артерий, хроническая почечная недостаточность (клиренс креатинина 30-60 мл/мин), язвенные поражения ЖКТ в анамнезе, наличие инфекции

Helicobacter pylori, длительное использование НПВП, алкоголизм, курение, тяжёлые соматические заболевания, одновременный приём пероральных глюкокортикостероидов (в т.ч. преднизолона), антикоагулянтов (в т.ч. варфарина), антиагрегантов (в т.ч. клопидогрела), селективных ингибиторов обратного захвата серотонина (в т.ч. циталопрама, флуоксетина, пароксетина, сертралина).

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Мелокс® противопоказан к применению во время беременности. На время лечения следует прекратить грудное вскармливание.

Способ применения и дозы

Препарат принимают 1 раз в сутки, во время еды.

Ревматоидный артрит: 15 мг/сутки. При достаточной выраженности терапевтического эффекта доза может быть снижена до 7,5 мг/сутки.

Остеоартроз: 7,5 мг/сутки. При необходимости возможно увеличение дозы до 15 мг/сутки.

Анкилозирующий спондилит: 15 мг/сутки.

Максимальная суточная доза – 15 мг. У пациентов с повышенным риском развития нежелательных эффектов, а также у пациентов с выраженной почечной недостаточностью, находящихся на гемодиализе, суточная доза не должна превышать 7,5 мг.

Побочные эффекты

Нежелательные реакции перечислены в соответствии со следующей градацией: часто (≥1 %, <10 %); нечасто (>0,1 %, <1 %); редко (>0,01 %, <0,1 %); очень редко (<0,01 %), включая отдельные сообщения.

Мелокс® обычно хорошо переносится. Однако, возможно возникновение следующих побочных эффектов:

Со стороны пищеварительной системы: часто - диспепсия, тошнота, рвота, абдоминальные боли, запор, метеоризм, диарея; нечасто - стоматит, транзиторные изменения показателей функции печени (например, повышение уровня трансаминаз или билирубина), отрыжка, эзофагит, гастродуоденальная язва, кровотечение из ЖКТ (в.т.ч. скрытое); редко - перфорация ЖКТ, колит, гепатит, гастрит.

Со стороны дыхательной системы: редко - приступ бронхиальной астмы.

Со стороны центральной нервной системы: часто - головная боль; нечасто - головокружение, вертиго, шум в ушах, сонливость; редко - спутанность сознания, дезориентация, эмоциональная лабильность.

Со стороны органов чувств: редко - конъюнктивит, нарушение зрения.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто – периферические отеки; нечасто - повышение артериального давления, сердцебиение, "приливы" крови к лицу.

Со стороны органов кроветворения: часто – анемия; нечасто - изменение формулы крови, в т.ч. лейкопения, тромбоцитопения.

Со стороны мочеполовой системы: нечасто - изменение показателей функции почек (повышение уровня креатинина и/или мочевины крови); редко - острая почечная недостаточность;

связь с приемом мелоксикама не установлена - интерстициальный нефрит, альбуминурия, гематурия.

Со стороны кожи и слизистых оболочек: часто - зуд, кожная сыпь; нечасто – крапивница; редко - фотосенсибилизация, буллезные высыпания, мультиформная эритема, в т.ч. синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз.

Аллергические реакции: редко - ангионевротический отек, реакции гиперчувствительности немедленного типа, включая анафилактоидные/ анафилактические.

Другие: лихорадка.

Передозировка

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

Лечение: специфического антидота нет. При передозировке следует провести промывание желудка, назначить прием активированного угля (в течение ближайшего часа) и симптоматическую терапию.

Для ускорения выведения мелоксикама может быть применен колестирамин.

Гемодиализ, форсированный диурез и защелачивание мочи не эффективны из-за высокой связи препарата с белками крови.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Совместное применение Мелокса с:

- *другими НПВП*, включая салицилаты в высоких дозах: одновременное назначение более одного препарата из группы НПВП может увеличить риск развития эрозивно-язвенных поражений и кровотечений ЖКТ;

- *антикоагулянтами (тиклопидином, гепарином, варфарином, а также с тромболитическими препаратами (стрептокиназой, фибринолизином)*: увеличивается риск развития кровотечений. Необходимо периодически контролировать показатели свертываемости крови;

- *селективными ингибиторами обратного захвата серотонина* возрастает риск развития желудочно-кишечных кровотечений.

- *препаратами лития*: возможно развитие кумуляции лития и увеличение его токсического действия (рекомендуется проводить контроль за концентрацией лития в плазме крови);

- *метотрексатом*: может усиливать побочное действие метотрексата на кроветворную систему (опасность возникновения анемии и лейкопении). В таких случаях необходим периодический мониторинг общего анализа крови;

- *контрацептивными средствами*: возможно снижение эффективности внутриматочных контрацептивных средств;

- *диуретиками и циклоспорином:* имеется потенциальная возможность развития почечной недостаточности.

- *антигипертензивными средствами* (например, бета-адреноблокаторы, ингибиторы АПФ, вазодилататоры, диуретики): возможное снижение эффективности антигипертензивных препаратов;

- *колестирамином:* в результате связывания мелоксикама, усиливается выведение препарата через ЖКТ.

Особые указания

Как и другие НПВП, Мелокс® следует применять с осторожностью у пациентов, в анамнезе которых отмечается язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, а также у пациентов, находящихся на антикоагуляционной терапии. У таких пациентов повышен риск возникновения язвенно-эрозивных заболеваний ЖКТ.

Соблюдать осторожность и контролировать показатели функции почек у пациентов пожилого возраста, у пациентов с хронической сердечной недостаточностью с явлениями недостаточности кровообращения, с циррозом печени, гиповолемией в результате хирургических вмешательств.

У пациентов с почечной недостаточностью, если клиренс креатинина более 25 мл/мин не требуется коррекции режима дозирования.

У пациентов, находящихся на диализе, дозировка препарата не должна превышать 7,5 мг в сутки.

При одновременном приеме мелоксикама и мочегонных средств следует принимать достаточное количество жидкости.

Применение мелоксикама, как и других НПВП, может маскировать симптомы инфекционных заболеваний.

Применение мелоксикама, как и других препаратов, блокирующих синтез простагландинов, может влиять на фертильность, о чем следует предупреждать женщин, планирующих беременность (снижается вероятность наступления беременности).

Влияние на способность к управлению транспортными средствами и обслуживанию движущихся механизмов

Прием препарата может вызывать возникновение нежелательных побочных эффектов, таких как головная боль, головокружение и сонливость. Поэтому при приеме мелоксикама желательно отказаться от управления транспортными средствами и работе с движущимися механизмами.

Форма выпуска

Таблетки по 7,5 мг и 15 мг.

По 10 таблеток в блистер из ПВХ/ПВДХ/алюминиевой фольги.

По 2 блистера вместе с инструкцией по применению в картонную пачку.

Условия хранения

Хранить в сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года. Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Производитель

«Медокеми Лтд»

Кипр, 3505, Лимассол, ул. Константинополеос, 1-10

Телефон: 8-10-357-25-867-600, Факс: 8-10-357-25-560-863

Организация, принимающая претензии:

Представительство «Медокеми Лтд»

105120, г. Москва, Андроньевская площадь, дом 6, стр.2

Телефон: (495) 678-81-25, 647-25-32. Факс: (495) 647-25-35

E-mail: info@md-srv.com

Глава Представительства
«Медокеми Лтд» в России



Я. Музурис