Инструкция
по применению лекарственного препарата
МЕЛОКСИКАМ

Регистрационный номер:

Торговое название препарата: МЕЛОКСИКАМ

Международное непатентованное название (МНН): мелоксикам

Лекарственна форма: таблетки

Состав: активное вещество: мелоксикам –7,5 мг и 15 мг.
Вспомогательные вещества: лактоза (сахар молочный); целлюлоза микрокристаллическая; натрия цитрат (натрий лимоннокислый 5,5-водного); поливинилпирролидон низкомолекулярный (повидон); кремния диоксид коллоидный (аэросил); кросповидон (коллидон ЦЛ); магния стеарат.
Описание: таблетки от светло-желтого до светло-желтого с зеленоватым оттенком цвета, плоскоцилиндрической формы. Таблетки с дозировкой 7,5 мг - без риски, с дозировкой 15 мг - с риской. Допускается легкая «мраморность».

Фармакотерапевтическая группа: нестероидный противовоспалительный препарат (НПВП)
КОД АТХ: M01AC06

Фармакологические свойства
Фармакодинамика
Мелоксикам - нестероидный противовоспалительный препарат (НПВП), 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 мелоксикам 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, абсолютная биодоступность мелоксикама – 89%. Одновременный прием пищи не изменяет всасывание. При использовании препарата внутрь в дозах 7,5 и 15 мг его концентрации пропорциональны дозам. Равновесные концентрации достигается в течение 3 - 5 дней. При длительном применении 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, (приведены, соответственно, значения 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 величины дозы), образуется путем окисления промежуточного метаболита, 5'-гидроксиметилмелоксикама, который также экскретируется, но в меньшей степени (9% от величины дозы). Исследования in vitro показали, что в данном метаболическом превращении важную роль играет CYP 2C9, дополнительное значение имеет изофермент CYP 3A4. В образовании двух других метаболитов (составляющих, соответственно, 16% и 4% от величины дозы препарата) принимает участие пероксидаза, активность которой, вероятно, индивидуально варьирует.

Выводится в равной степени с через кишечник и почки, преимущественно в виде метаболитов. Через кишечник в неизмененном виде выводится менее 5% от величины суточной дозы, в моче в неизмененном виде препарат обнаруживается только в следовых количествах. Период полувыведения (T1/2) мелоксикама составляет 15-20 часов. Плазменный клиренс составляет в среднем 8 мл/мин. У лиц пожилого возраста клиренс препарата снижается. Объем распределения низкий, и составляет в среднем 11 л.

Печеночная или почечная недостаточность средней степени тяжести существенным образом существенного влияния на фармакокинетику мелоксикама не оказывает.

Показания к применению

- Симптоматическое лечение остеоартроза;
- Симптоматическое лечение ревматоидного артрита;
- Симптоматическое лечение анкилозирующего спондилоартрита (болезнь Бехтерева).

Противопоказания

- гиперчувствительность к активному веществу или вспомогательным компонентам;
- противопоказан в период после проведения аортокоронарного шунтирования;
- некомпенсированная сердечная недостаточность;
- полное или неполное сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза носа и околоносовых пазух и непереносимости ацетилсалициловой кислоты и др. НПВП (в т.ч. в анамнезе);
- эрозивно-язвенные изменения слизистой желудка или 12-перстной кишки, 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;

С осторожностью

Ишемическая болезнь сердца, цереброваскулярные заболевания, застойная сердечная недостаточность, дислипидемия/гиперлипидемия, сахарный диабет, заболевания периферических артерий, курение, клиренс креатинина менее 60 мл/мин.

Анамнестические данные о развитии язвенного поражения ЖКТ, наличие инфекции Helicobacter pylori, пожилой возраст, длительное использование НПВП, частое употребление алкоголя, тяжелые соматические заболевания, сопутствующая терапия следующими препаратами:

- Антикоагулянты (например, варфарин)
- антиагреганты (например, ацетилсалициловая кислота, клопидогрел)
- пероральные глюкокортикостероиды (например, преднизолон)
- селективные ингибиторы обратного захвата серотонина (например, циталопрам, флуоксетин, пароксетин, сертралин)

Для снижения риска развития нежелательных явлений со стороны ЖКТ следует использовать минимальную эффективную дозу минимально возможным коротким курсом.

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 пищеварительной системы: 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 ЖКТ (в т.ч. скрытое), стоматит; менее 0,1% - перфорация ЖКТ, колит, гепатит, гастрит.

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

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, дизориентация, эмоциональная лабильность.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: более 1% - периферические отеки; 0,1-1% - повышение АД, 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, ЖКТ-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 с организма. Форсированный диурез, защелачивание мочи, гемодиализ – малоэффективны из-за высокой связи препарата с белками крови.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами
- При одновременном применении с другими НПВП (а также с ацетилсалициловой кислотой) увеличивается риск возникновения эрозивно-язвенных поражений и кровотечений ЖКТ;
- 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 с циклоспорином возрастает риск развития почечной недостаточности;
- При одновременном применении с внутриматочными контрацептивными средствами возможно снижение эффективности действия последних;
- При одновременном применении с антикоагулянтами (гепарин, тиклопидин, варфарин), а также с тромболитическими препаратами (стрептокиназа, фибринолизин) увеличивается риск развития кровотечений (необходим периодический контроль показателей свёртываемости крови).
- При одновременном применении с колестирамином, в результате связывания мелоксикама, усиливается его выведение через ЖКТ.
- 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 антикоагуляционной 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 недостаточность, если клиренс креатинина более 25 мл/мин не требуется коррекции режима дозирования.
- У пациентов, находящихся на диализе, дозировка препарат не должна превышать 7.5 мг/сутки.
- Пациенты, принимающие одновременно мочегонные средства и мелоксикам, должны принимать достаточное количество жидкости.
- Если в процессе лечения возникли аллергические реакции (зуд, кожная сыпь, крапивница, фотосесибилизация) необходимо обратиться к врачу с целью решения вопроса о прекращении приема препарата.
- Мелоксикам, также как и другие НПВП, может маскировать симптомы инфекционных заболеваний.
- Применение мелоксикама, как и других препаратов, блокирующих синтез простагландинов может влиять на фертильность, поэтому не рекомендуется женщинам, желающим забеременеть.

Управления транспортными средствами, обслуживание машин и механизмов

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 по 7,5 мг и 15 мг.

По 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 20 или 30 таблеток в банку светозащитного стекла или в банку полимерную или во флакон полимерный.

Каждую банку или флакон или 1, 2 или 3 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения

Список Б. В сухом, защищенном от света месте, недоступном детям, 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: ЗАО «Северная звезда», Россия

Претензии потребителей направлять по адресу:

188663, Ленинградская обл., Всеволожский р-н, п. Кузьмоловский, Опытный завод РНЦ, тел/факс: (812) 320-79-88

И.о. директора ИДКЭЛС А.Н. Васильев

Генеральный директор

ЗАО «Северная звезда» Э.Н. Савин