

Внимательно прочитайте эту инструкцию перед тем, как начать приём/использование этого лекарства

- *Сохраняйте инструкцию, она может потребоваться вновь.*
- *Если у Вас возникли вопросы, обратитесь к врачу*
- *Это лекарство назначено лично Вам, и его не следует передавать другим лицам, поскольку оно может причинить им вред даже при наличии тех же симптомов, что и у Вас.*

Инструкция по медицинскому применению препарата

Мовалис® (Movalis®)

Регистрационный номер:

Торговое патентованное название: Мовалис®

Международное непатентованное название: Мелоксикам

Химическое название: 4-гидрокси-2-метил-N-(5-метил-2-тиазолил)-2Н-1,2-бензотиазин-3-карбоксиамид-1,1-диоксид

Лекарственная форма: раствор для внутримышечного введения

Состав:

1 ампула (1,5 мл) содержит: *активное вещество:* мелоксикам – 15,0 мг;

вспомогательные вещества: меглумин, гликофурол, полоксамер 188 (Плуроник Ф68), натрия хлорид, глицин, натрия гидроксид, вода для инъекций.

Описание:

Прозрачный желтого с зеленым оттенком цвета раствор, практически свободный от частиц, в прозрачных ампулах объемом 2 мл.

Фармакотерапевтическая группа:

Нестероидный противовоспалительный препарат - НПВП.

Код АТХ: M01AC06.

Фармакодинамика

Мовалис является нестероидным противовоспалительным препаратом, относится к производным эноловой кислоты и оказывает противовоспалительное, анальгетическое и антипиретическое действие. Выраженное противовоспалительное действие мелоксикама установлено на всех стандартных моделях воспаления. Механизм действия мелоксикама состоит в его способности ингибировать синтез простагландинов – известных медиаторов воспаления.

Мелоксикам *in vivo* ингибирует синтез простагландинов в месте воспаления в большей степени, чем в слизистой оболочке желудка или почках.

Эти различия связаны с более селективным ингибированием циклооксигеназы-2 (ЦОГ-2) по сравнению с циклооксигеназой-1 (ЦОГ-1). Считается, что ингибирование ЦОГ-2 обеспечивает терапевтические действия НПВП, тогда как ингибирование постоянно присутствующего изофермента ЦОГ-1 может быть ответственно за побочные действия со стороны желудка и почек. Селективность мелоксикама в отношении ЦОГ-2 подтверждена в различных тест-системах, как *in vitro*, так и *in vivo*. Селективная способность мелоксикама ингибировать ЦОГ-2 показана при использовании в качестве тест-системы цельной крови человека *in vitro*. Установлено, что мелоксикам (в дозах 7,5 и 15 мг) активнее ингибировал ЦОГ-2, оказывая большее ингибирующее влияние на продукцию простагландина E₂, стимулируемую липополисахаридом (реакция, контролируемая ЦОГ-2), чем на продукцию тромбоксана, участвующего в процессе свертывания крови (реакция, контролируемая ЦОГ-1). Эти эффекты зависели от величины дозы.

Фармакокинетика

Мелоксикам полностью абсорбируется после внутримышечного введения. Относительная биодоступность по сравнению с биодоступностью при приеме внутрь составляет почти 100%. Поэтому при переходе с инъекционной на пероральные формы подбора дозы не требуется. После введения 15 мг препарата внутримышечно пиковая концентрация в плазме, составляющая около 1,62 мкг/мл, достигается в течение приблизительно 60 мин.

Мелоксикам очень хорошо связывается с белками плазмы, в основном с альбумином (99%). Проникает в синовиальную жидкость, концентрация в синовиальной жидкости составляет примерно 50% концентрации в плазме. Объем распределения низкий, в среднем 11 л. Межиндивидуальные различия составляют 30 -40%.

Мелоксикам почти полностью метаболизируется в печени с образованием 4-х фармакологически неактивных 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 CYP2C9, дополнительное значение имеет изофермент CYP3A4. В образовании двух других метаболитов (составляющих, соответственно, 16% и 4% от величины дозы препарата) принимает участие пероксидаза, активность которой, вероятно, индивидуально варьирует.

Выведение

Выводится в равной степени с калом и мочой, преимущественно в виде метаболитов. В неизмененном виде с калом выводится менее 5% от величины суточной дозы, в моче в неизмененном виде препарат обнаруживается только в следовых количествах. Средний период полувыведения мелоксикама составляет 20 часов.

Плазменный клиренс составляет в среднем 8 мл/мин.

Мелоксикам демонстрирует линейную фармакокинетику в дозах 7,5 – 15 мг при приеме внутрь или внутримышечном введении.

Недостаточность функции печени и/или почек

Недостаточность функции печени, а также слабо или умеренно выраженная почечная недостаточность существенного влияния на фармакокинетику мелоксикама не оказывает. При терминальной почечной недостаточности увеличение объема распределения может привести к более высоким концентрациям свободного мелоксикама, поэтому у этих пациентов суточная доза не должна превышать 7,5 мг.

Пожилые пациенты

У пожилых пациентов средний плазменный клиренс в период 448241-070910 состояния фармакокинетики немного ниже, чем у молодых пациентов.

Показания к применению

Начальный период лечения болевого синдрома и краткосрочная симптоматическая терапия ревматоидного артрита, остеоартроза, анкилозирующего спондилита.

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к активному ингредиенту или вспомогательным компонентам препарата. Существует вероятность перекрестной чувствительности к ацетилсалициловой кислоте и другим НПВП;
- Симптомы бронхиальной астмы, полипы носа, ангионевротический отек или крапивница после приема ацетилсалициловой кислоты или других НПВП в анамнезе;
- Язвенная болезнь/перфорация желудка и двенадцатиперстной кишки в стадии обострения или недавно перенесенная;
- Болезнь Крона или язвенный колит в стадии обострения;
- Тяжелая печеночная недостаточность;
- Тяжелая почечная недостаточность (если не проводится гемодиализ, клиренс креатинина менее 30 мл/мин, а также при подтвержденной гиперкалиемии), прогрессирующее заболевание почек;
- Острые желудочно-кишечные кровотечения, недавно перенесенные цереброваскулярные кровотечения или установленный диагноз заболеваний свертывающей системы крови
- Выраженная неконтролируемая сердечная недостаточность;
- Детский возраст до 18 лет;
- Беременность;
- Грудное вскармливание;
- Терапия периоперационных болей при проведении шунтирования коронарных артерий

С осторожностью:

П N014482/01-070911

- заболевания желудочно-кишечного тракта в анамнезе (наличие инфекции *H.pylori*);
- застойная сердечная недостаточность;
- почечная недостаточность (клиренс креатинина 30 - 60 мл/мин);
- ишемическая болезнь сердца;
- цереброваскулярные заболевания;
- дислипидемия / гиперлипидемия;
- сахарный диабет;
- сопутствующая терапия следующими препаратами: антикоагулянты, пероральные глюкокортикостероиды, антиагреганты, селективные ингибиторы обратного захвата серотонина;
- заболевания периферических артерий;
- пожилой возраст;
- длительное использование НПВП;
- курение;
- частое употребление алкоголя.

Способ применения и дозы:

Внутримышечное введение препарата показано только в течение первых двух-трех дней терапии. В дальнейшем лечение продолжают с применением пероральных форм (таблетки). Рекомендуемая доза составляет 7,5 мг или 15 мг 1 раз в сутки, в зависимости от интенсивности боли и тяжести воспалительного процесса.

Так как потенциальный риск побочных реакций зависит от дозы и продолжительности лечения следует использовать максимально возможные низкие дозы и длительность применения.

Максимальная рекомендуемая суточная доза - 15 мг.

Препарат вводится посредством глубокой внутримышечной инъекции.

Учитывая возможную несовместимость, содержимое ампул Мовалис® не следует смешивать в одном шприце с другими лекарственными средствами.

У пациентов с тяжелой почечной недостаточностью, находящихся на гемодиализе, доза не должна превышать 7,5 мг в день.

Препарат нельзя вводить внутривенно.

Комбинированное применение.

Не следует применять препарат одновременно с другими НПВП.

Суммарная суточная доза препарата Мовалис[®], применяемого в виде таблеток, суппозиторий, суспензии для приема внутрь и раствора для инъекций, не должна превышать 15 мг.

Побочное действие

Ниже описаны побочные эффекты, связь которых с применением препарата Мовалис, расценивалась как возможная.

Побочные эффекты, связь которых с приемом препарата расценивалась как возможная, и которые были зарегистрированы при широком применении препарата, отмечены знаком *.

Со стороны органов кроветворения:

Изменения числа клеток крови, включая изменения лейкоцитарной формулы, лейкопению, тромбоцитопению, анемию.

Со стороны иммунной системы:

Анафилактический шок*, анафилактоидные/анафилактические реакции*, другие реакции гиперчувствительности немедленного типа*.

Со стороны центральной нервной системы:

головная боль, головокружение, шум в ушах, сонливость, спутанность сознания*, дезориентация*, изменение настроения*.

Со стороны желудочно-кишечного тракта:

перфорация желудочно-кишечного тракта, скрытое или явное желудочно-кишечное кровотечение, возможно со смертельным исходом, гастродуоденальные язвы, колит, гастрит*, эзофагит, стоматит, боль в животе, диспепсия, диарея, тошнота, рвота,

запор, вздутие живота, отрыжка, транзиторные изменения показателей фототести печени (например, повышение активности трансаминаз или билирубина), гепатит*.

Со стороны кожи и кожных придатков:

токсический эпидермальный некролиз*, синдром Стивенса-Джонсона*, ангиоотек*, буллезный дерматит*, мультиформная эритема*, зуд, кожная сыпь, крапивница, фотосенсибилизация.

Со стороны органов дыхания:

бронхиальная астма у пациентов с аллергией к ацетилсалициловой кислоте или другим НПВП.

Со стороны сердечно-сосудистой системы:

Повышение артериального давления, сердцебиение, чувство «прилива» крови к лицу, отеки.

Со стороны мочеполовой системы:

острая почечная недостаточность*, изменения показателей функции почек (повышение уровня креатинина и/или мочевины в сыворотке крови), нарушения мочеиспускания, включая острую задержку мочи*, как и для других НПВП не исключают возможность появления интерстициального нефрита, гломерулонефрита, почечного медуллярного некроза, нефротического синдрома.

Со стороны органа зрения:

конъюнктивит*, нарушения зрения, включая нечеткость зрения*.

Общие явления:

боль и отек в месте введения.

Передозировка

Данных о случаях, связанных с передозировкой препарата накоплено недостаточно. Вероятно, будут присутствовать симптомы, свойственные передозировке препаратами группы НПВП, в тяжёлых случаях:

сонливость, нарушения сознания, тошнота, рвота, боли в эпигастрии, желудочно-кишечное кровотечение, острая почечная недостаточность, изменения артериального давления, остановка дыхания, асистолия.

Лечение: антидот не известен. В случае передозировки препарата **ТАКОЛД** проводить симптоматическую терапию.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

- Другие ингибиторы синтеза простагландинов, включая глюкокортикоиды и салицилаты, при одновременном приеме с мелоксикамом увеличивают риск образования язв в желудочно-кишечном тракте и желудочно-кишечных кровотечений (вследствие синергизма действия) и поэтому не рекомендуются. Одновременный прием с другими НПВП не рекомендуется.
- Селективные ингибиторы обратного захвата серотонина – увеличение риска желудочно-кишечных кровотечений.
- Препараты лития - НПВП повышают концентрацию лития в плазме, посредством уменьшения выведения его почками. Рекомендуется мониторировать концентрацию лития в период назначения Мовалиса[®], при изменении дозы препаратов лития и их отмене.
- Метотрексат – НПВП снижают тубулярную секрецию метотрексата, тем самым повышая его концентрацию в плазме и гематологическую токсичность, фармакокинетика метотрексата при этом не меняется. В связи с этим одновременный прием Мовалиса[®] и метотрексата в дозе более 15 мг/неделя не рекомендуется.

Риск развития взаимодействия между НПВП и метотрексатом может иметь место и у пациентов, применяющих метотрексат в низких дозах, особенно у пациентов с нарушением функции почек. Поэтому необходим постоянный контроль за числом клеток крови и за функцией почек.

При совместном применении мелоксикама и метотрексата в течении 3-х дней возрастает риск повышения токсичности последнего.

- Контрацепция - НПВП снижают эффективность внутриматочных контрацептивных устройств.
- Диуретики - применение НПВП в случае обезвоживания пациентов сопровождается риском развития острой почечной недостаточности.

- При 144820140109
- Антигипертензивные средства (бета-адреноблокаторы, ангиотензинпревращающего фермента, вазодилататоры, диуретики) - НПВП снижают эффект антигипертензивных средств, вследствие ингибирования простагландинов, обладающих вазодилатирующими свойствами.
 - ангиотензина II рецепторов антагонисты при совместном назначении с НПВП усиливают снижение клубочковой фильтрации, что тем самым, может привести к развитию острой почечной недостаточности, особенно у пациентов с нарушением функции почек.
 - НПВП, оказывая действие на почечные простагландины, могут усиливать нефротоксичность циклоспорина.

При использовании совместно с мелоксикамом лекарственных препаратов, которые обладают известной способностью ингибировать CYP2C9 и/или CYP3A4 (или метаболизируются при участии этих ферментов), следует принимать во внимание возможность фармакокинетического взаимодействия.

Нельзя исключить возможность взаимодействия с гипогликемическими препаратами для приема внутрь.

При одновременном применении антацидов, циметидина, дигоксина и фуросемида, значимых фармакокинетических взаимодействий выявлено не было.

Особые указания

Пациенты, страдающие заболеваниями желудочно-кишечного тракта, должны регулярно наблюдаться. При возникновении язвенного поражения желудочно-кишечного тракта или желудочно-кишечного кровотечения Мовалис® необходимо отменить.

Язвы в желудочно-кишечном тракте, перфорация или кровотечение могут возникнуть в ходе лечения в любое время, как при наличиистораживающих симптомов или сведений о серьезных желудочно-кишечных осложнениях в анамнезе, так и при отсутствии этих признаков. Последствия данных осложнений в целом более серьезны у лиц пожилого возраста.

Особое внимание следует уделять пациентам, сообщающим о развитии нежелательных явлений со стороны кожи и слизистых оболочек, а также реакций

повышенной чувствительности к препарату, особенно, если подопытные реакции наблюдались в течение предыдущих курсов лечения. Развитие подобных реакций наблюдается, как правило, в течение первого месяца лечения. В таких случаях должен рассматриваться вопрос о прекращении применения Мовалиса®.

Как и прочие НПВП, Мовалис® может повышать риск развития серьезных сердечно-сосудистых тромбозов, инфаркта миокарда, приступа стенокардии, возможно со смертельным исходом. Такой риск повышается при длительном применении препарата, а также у пациентов с выше указанными заболеваниями в анамнезе и предрасположенных к таким заболеваниям.

НПВП ингибируют в почках синтез простагландинов, которые участвуют в поддержании почечной перфузии. Применение НПВП у пациентов со сниженным почечным кровотоком или уменьшенным объемом циркулирующей крови может привести к декомпенсации скрыто протекающей почечной недостаточности. После отмены НПВП функция почек обычно восстанавливается до исходного уровня. В наибольшей степени риску развития этой реакции подвержены пожилые пациенты, пациенты, у которых отмечается дегидратация, застойная сердечная недостаточность, цирроз печени, нефротический синдром или острые нарушения функции почек, пациенты, одновременно принимающие диуретические средства, а также пациенты, перенесшие серьезные хирургические вмешательства, которые ведут к гиповолемии. У таких пациентов в начале терапии следует тщательно контролировать диурез и функцию почек.

Применение НПВП совместно с диуретиками может приводить к задержке натрия, калия и воды, а также к снижению натрийуретического действия мочегонных средств. В результате этого у предрасположенных пациентов возможно усиление признаков сердечной недостаточности или гипертензии. Поэтому необходим тщательный контроль состояния таких пациентов, а также у них должна поддерживаться адекватная гидратация. До начала лечения необходимо исследование функции почек.

В случае проведения комбинированной терапии следует также контролировать функцию почек.

При использовании Мовалиса® (так же как и большинства других НПВП) возможно эпизодическое повышение активности трансаминаз в сыворотке крови или других показателей функции печени. В большинстве случаев это повышение было небольшим и преходящим. Если выявленные изменения существенны или не уменьшаются со временем, Мовалис® следует отменить, и проводить наблюдение за выявленными лабораторными изменениями.

Ослабленные или истощенные пациенты могут хуже переносить нежелательные явления, в связи с чем, такие пациенты должны тщательно наблюдаться.

Подобно другим НПВП Мовалис® может маскировать симптомы основного инфекционного заболевания.

Как препарат, ингибирующий синтез циклооксигеназы/простагландина, Мовалис® может оказывать влияние на фертильность, и поэтому не рекомендуется женщинам, имеющим трудности с зачатием. В связи с этим у женщин, проходящих обследование по этому поводу, рекомендуется отмена приема Мовалиса®.

Специальных клинических исследований влияния препарата на способность управлять автомобилем и механизмами не проводилось. Однако при управлении автомобилем и работе с механизмами следует принимать во внимание возможность развития головокружения, сонливости или других нарушений со стороны центральной нервной системы.

Не следует применять препарат одновременно с другими НПВП.

Форма выпуска

Раствор для внутримышечного введения 15 мг/1,5 мл.

По 1,5 мл в ампулу из бесцветного гидролитического стекла класса 1 с кольцом белого цвета над линией разлома ампулы и 2-мя кольцами зеленого и желтого цвета в верхней части ампулы. По 3 или 5 ампул в поддон из пластмассы, поддон в картонную коробку вместе с инструкцией по применению.

Условия хранения

В защищенном от света месте, при температуре не выше 30 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

5 лет.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

По рецепту.

Владелец регистрационного удостоверения

«Берингер Ингельхайм Интернешнл ГмбХ»

Бингерштрассе 173, 55216, Ингельхайм-на-Рейне, Германия

Претензии потребителей направлять по адресу Представительства в Москве:

117049, Москва, ул. Донская, д.29/9, строение 1

Телефон: (495) 411-7801, факс: (495) 411-7802

Производитель

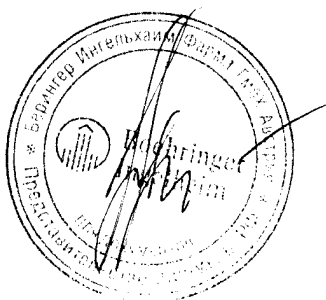
«Берингер Ингельхайм Эспана С.А»

08173 Сан-Кугат дель Вальес, Барселона, Испания,

Прат де ла Рибя, б/н, Сектор Туро де Кан Матас

Представитель фирмы

Менеджер по регистрации



Митрохина В.П.

