

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

АМЕЛОТЕКС®

Регистрационный номер:

Торговое наименование: АМЕЛОТЕКС®

Международное непатентованное или группировочное наименование: мелоксикам

Лекарственная форма: суппозитории ректальные

Состав

Состав на один суппозиторий:

действующее вещество: мелоксикам – 7,5 мг или 15,0 мг;

вспомогательные вещества: жир твердый (Суппосир ВР), макрогола глицерилгидроксистеарат.

Описание: суппозитории зеленовато-желтого цвета торпедообразной формы.

Фармакотерапевтическая группа: противовоспалительные и противоревматические препараты; нестероидные противовоспалительные и противоревматические препараты; оксикамы.

Код АТХ: M01AC06

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

АМЕЛОТЕКС® – нестероидный противовоспалительный и противоревматический 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 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.

Подавляет синтез простагландинов в области воспаления в большей степени, чем в слизистой оболочке желудка или почках, что связано с относительно избирательным ингибированием ЦОГ-2.

Фармакокинетика

Абсорбция

Абсолютная биодоступность мелоксикама – 89 %.

Максимальная концентрация (C_{\max}) мелоксикама в плазме в период устойчивого состояния фармакокинетики достигается приблизительно через 5 часов после применения мелоксикама. При однократном приеме мелоксикама средняя C_{\max} в плазме крови достигается в течение 5-6 ч. При применении мелоксикама внутрь в дозах 7,5 мг и 15 мг его концентрации пропорциональны дозам. Равновесные концентрации достигаются в течение 3-5 дней. Диапазон различий между C_{\max} и минимальной концентрацией (C_{\min}) мелоксикама после его приема один раз в день относительно невелик и составляет при применении дозы 15 мг – 0,8-2,1 мкг/мл, (приведены, соответственно, значения C_{\min} и C_{\max}).

Распределение

Связывание с белками плазмы составляет более 99 %. Мелоксикам проникает через гистогематические барьеры, концентрация в синовиальной жидкости достигает 50 % C_{\max} мелоксикама в плазме. Объем распределения низкий, в среднем составляет 11 л. Индивидуальные колебания – 30-40 %.

Трансформация

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 изофермент CYP2C9, дополнительное значение имеет изофермент CYP3A4. В образовании двух других метаболитов (составляющих, соответственно, 16 % и 4 % от величины дозы мелоксикама) принимает участие пероксидаза, активность которой, вероятно, индивидуально варьирует.

Элиминация

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 мелоксикам обнаруживается только в следовых количествах. Период полувыведения ($T_{1/2}$) мелоксикама составляет 15-20 часов. Плазменный клиренс составляет в среднем 8 мл/мин.

Недостаточность функции печени и/или почек

Недостаточность функции печени, а также почечная недостаточность легкой и средней степени тяжести существенного влияния на фармакокинетику мелоксикама не оказывают. При терминальной стадии 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 (старше 65 лет)

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

Показания к применению

АМЕЛОТЕКС® показан к применению у взрослых и детей старше 15 лет для симптоматического лечения остеоартроза, ревматоидного артрита, анкилозирующего спондилита (болезнь Бехтерева) и других воспалительных и дегенеративных заболеваний суставов. Препарат предназначен для симптоматической терапии, уменьшения боли и воспаления на момент использования, на прогрессирование заболевания не влияет.

Противопоказания

- гиперчувствительность к мелоксикаму или другим компонентам препарата;
- 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 поражения слизистой оболочки желудка и двенадцатиперстной кишки в фазе обострения;
- активное желудочно-кишечное кровотечение, недавнее цереброваскулярное кровотечение или другое кровотечение;
- тяжелая недостаточность функции печени;
- тяжелая почечная недостаточность у пациентов, не подвергающихся диализу (клиренс креатинина менее 30 мл/мин), прогрессирующие заболевания почек, в т.ч. подтвержденная гиперкалиемия;
- воспалительные заболевания кишечника в фазе обострения (язвенный колит, болезнь Крона);
- период после проведения аортокоронарного шунтирования;
- тяжелая неконтролируемая сердечная недостаточность;
- гемофилия и другие нарушения свертываемости крови;

- анамнестические данные о приступе бронхообструкции, рините;
- беременность, период грудного вскармливания;
- детский возраст до 15 лет.

Суппозитории не должны применяться у пациентов с какими-либо воспалительными заболеваниями прямой кишки или заднего прохода, или у пациентов с недавно отмечавшимся кровотечением из прямой кишки или заднего прохода.

С осторожностью

Пожилой возраст, ишемическая болезнь сердца, хроническая сердечная недостаточность, цереброваскулярные заболевания, дислипидемия/гиперлипидемия, сахарный диабет, заболевания периферических артерий, курение, почечная недостаточность с клиренсом креатинина от 30 до 60 мл/мин, туберкулез, выраженный остеопороз, анамнестические данные о развитии язвенного поражения желудочно-кишечного тракта, наличие инфекции *Helicobacter pylori*, длительное применение нестероидных противовоспалительных препаратов, алкоголизм, тяжелые соматические заболевания, одновременный прием пероральных глюкокортикостероидов (в том числе преднизолона), антикоагулянтов (в том числе варфарина), антиагрегантов (в том числе клопидогрела), селективных ингибиторов обратного захвата серотонина (циталопрама, флуоксетина, пароксетина, сертралина).

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Применение препарата АМЕЛОТЕКС® противопоказано во время беременности.

Применение нестероидных противовоспалительных препаратов (НПВП) женщинами с 20-ой недели беременности может привести к развитию маловодия и/или патологии почек у новорожденных (неонатальная почечная дисфункция).

Известно, что НПВП проникают в грудное молоко, поэтому применение препарата АМЕЛОТЕКС® в период грудного вскармливания противопоказано.

Как препарат, ингибирующий синтез циклооксигеназы/простагландинов, препарат АМЕЛОТЕКС® может оказывать влияние на фертильность, и поэтому не рекомендуется его применение у женщин, планирующих беременность. Мелоксикам может приводить к задержке овуляции. В связи с этим, у женщин, имеющих проблемы с зачатием и проходящим обследование по поводу подобных проблем, рекомендуется отмена приема препарата АМЕЛОТЕКС®

Способ применения и дозы

Ректально, освободив суппозиторий от контурной упаковки, вводят глубоко в задний

проход. Перед применением суппозитория рекомендуется опорожнить кишечник.

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 необходимости доза может быть увеличена до 15 мг в сутки.

Анкилозирующий спондилит: 15 мг в сутки. В зависимости от лечебного эффекта доза может быть снижена до 7,5 мг в сутки.

Ректальные суппозитории рекомендуется применять в дозе 7,5 мг один раз в день. В более тяжелых случаях возможно использование суппозиториев в дозе 15 мг. При комбинированном применении мелоксикама в виде таблеток, суппозиториев, суспензий и инъекций суммарная доза не должна превышать 15 мг в сутки.

Препарат должен применяться ректально в течение как можно более короткого времени, учитывая суммирование риска местной токсичности и риска, связанного с системным действием препарата.

Особые группы пациентов

Пациенты с повышенным риском развития побочных эффектов

Доза не должна превышать 7,5 мг в сутки.

Пациенты с нарушением функции почек

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

Дети

Максимальная суточная доза у подростков составляет 0,25 мг/кг, но не более 15 мг в сутки. Безопасность и эффективность мелоксикама у детей в возрасте до 15 лет на данный момент не установлены.

Побочное действие

Частота побочных действий приведена в соответствии с классификацией Всемирной организации здравоохранения (ВОЗ): очень часто ($\geq 1/10$); часто ($\geq 1/100, < 1/10$); нечасто ($\geq 1/1000, < 1/100$); редко ($\geq 1/10000, < 1/1000$); очень редко ($< 1/10000$), включая отдельные сообщения.

Со стороны желудочно-кишечного тракта: часто – диспепсия, в т.ч. тошнота, рвота, абдоминальная боль, запор, метеоризм, диарея; нечасто – преходящее повышение активности "печеночных" трансаминаз, гипербилирубинемия, отрыжка, эзофагит, гастродуоденальная язва, кровотечение из желудочно-кишечного тракта (в т.ч. скрытое),

стоматит; редко – перфорация желудочно-кишечного тракта, колит, гепатит, гастрит.

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

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

Со стороны дыхательной системы: редко – бронхоспазм.

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

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто – периферические отеки; нечасто – повышение артериального давления, ощущение сердцебиения, "приливы" крови к коже лица.

Со стороны мочевыделительной системы: нечасто – гиперкреатининемия и/или повышение концентрации мочевины в сыворотке крови; редко – острая почечная недостаточность; связь с приемом мелоксикама не установлена – интерстициальный нефрит, альбуминурия, гематурия.

Со стороны органов чувств: редко – конъюнктивит, нарушение зрения, в т. ч. нечеткость зрительного восприятия.

Аллергические реакции: редко – ангионевротический отек, анафилактические/анафилактические реакции.

Местные реакции при ректальном применении: возможны позывы к дефекации и чувство дискомфорта, которые проходят самостоятельно и не требуют отмены препарата; зуд, жжение в перианальной области, раздражение слизистой оболочки прямой кишки.

Передозировка

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

Лечение: симптоматическая терапия. Специфического антидота нет. Колестирамин ускоряет выведение препарата из организма. Форсированный диурез, гемодиализ – малоэффективны из-за высокой связи мелоксикама с белками крови.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Совместное применение мелоксикама и других НПВП не рекомендуется.

При одновременном применении с другими НПВП (а также с ацетилсалициловой кислотой)

увеличивается риск возникновения эрозивно-язвенных поражений и кровотечений из желудочно-кишечного тракта.

При одновременном применении с гипотензивными препаратами (например, бета-адреноблокаторы, ингибиторы ангиотензинпревращающего фермента (иАПФ), вазодилататоры, диуретики), возможно снижение эффективности действия последних, вследствие ингибирования простагландинов, обладающих вазодилатирующими свойствами.

Совместное применение НПВП и антагонистов рецепторов ангиотензина II (также, как и ингибиторов АПФ) усиливает эффект снижения гломерулярной фильтрации. У пациентов с нарушением функции почек это может привести к развитию острой почечной недостаточности.

При одновременном применении с препаратами лития возможна кумуляция лития за счет снижения почечной экскреции и увеличения его токсического действия (рекомендуется контроль концентрации лития в плазме крови при необходимости такой комбинированной терапии).

При одновременном применении с метотрексатом НПВП могут уменьшать канальцевую секрецию метотрексата и, таким образом, увеличивать концентрацию метотрексата в плазме, усиливая его побочное действие на кроветворную систему (опасность возникновения анемии и лейкопении, показан периодический контроль общего анализа крови). В связи с этим у пациентов, получающих высокие дозы метотрексата (более 15 мг в неделю) одновременное применение НПВП не рекомендуется. Риск взаимодействия при одновременном применении метотрексата и НПВП возможен также у пациентов, получающих низкие дозы метотрексата, особенно у пациентов с нарушениями функции почек. При необходимости комбинированной терапии следует контролировать формулу крови и функцию почек. Необходимо соблюдать осторожность в случае, если НПВП и метотрексат применяются одновременно в течение 3 дней, т.к. концентрация метотрексата в плазме может повышаться и, как следствие, могут возникать токсические эффекты. Одновременное применение мелоксикама не влияло на фармакокинетику метотрексата в дозе 15 мг в неделю, однако следует принимать во внимание, что гематологическая токсичность метотрексата усиливается при одновременном приеме НПВП.

При одновременном применении с диуретиками и с циклоспорином возрастает риск развития острой почечной недостаточности. У пациентов, получающих АМЕЛОТЕКС® и диуретики, должна поддерживаться адекватная регидратация. До начала лечения необходимо провести исследование функции почек.

НПВП, оказывая действие на почечные простагландины, могут усиливать

нефротоксичность циклоспорина. В случае проведения комбинированной терапии следует контролировать функцию почек.

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 желудочно-кишечный тракт (см. раздел «Передозировка»).

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

При одновременном применении с гипогликемическими препаратами для приема внутрь мелоксикам может усиливать их действие, тем самым способствуя риску возникновения гипогликемии.

Особые указания

Как и при применении других НПВП, желудочно-кишечное кровотечение, язвы и перфорации, потенциально опасные для жизни пациента, могут возникать 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. Следует соблюдать осторожность при применении препарата АМЕЛТЕКС® (также, как и при применении других НПВП) у пациентов с заболеваниями желудочно-кишечного тракта в анамнезе, пациентов пожилого возраста, а также у пациентов, находящихся на антикоагулянтной терапии. У таких пациентов повышен риск возникновения эрозивно-язвенных заболеваний желудочно-кишечного тракта. В этом случае, а также для лечения пациентов, требующего применения низкой дозы ацетилсалициловой кислоты или других лекарственных средств, повышающих желудочно-кишечные риски, следует рассмотреть комбинированную терапию с защитными лекарственными препаратами (такими как мизопростол или ингибиторы протонной помпы).

При возникновении язвенного поражения желудочно-кишечного тракта или желудочно-кишечного кровотечения лечение препаратом АМЕЛТЕКС® необходимо прекратить.

НПВП могут повышать риск развития серьезных тромботических сердечно-сосудистых заболеваний, инфаркта миокарда и инсульта, которые могут приводить к летальному исходу. Этот риск может повышаться по мере увеличения длительности применения НПВП. Наибольший риск может отмечаться у пациентов с сердечно-сосудистыми заболеваниями или при наличии факторов риска развития сердечно-сосудистых заболеваний, почечной недостаточности, а также находящихся на гемодиализе. У пациентов с небольшими или умеренными нарушениями функции почек (то есть, если клиренс креатинина больше 25 мл/мин) снижение дозы не требуется. Ослабленные или истощенные пациенты могут хуже переносить нежелательные явления, поэтому такие пациенты должны тщательно наблюдаться. Осторожность (как и в случае применения других НПВП) должна соблюдаться при лечении пациентов пожилого возраста, у которых выше вероятность нарушений функции почек, печени и сердца. Применение НПВП совместно с диуретиками может приводить к задержке натрия, калия и воды, и оказывать влияние на натрийуретический эффект мочегонных средств. В результате этого у предрасположенных пациентов возможно усиление признаков сердечной недостаточности или гипертензии. Рекомендуется клиническое наблюдение пациентов, имеющих риск развития этих осложнений.

Особое внимание следует уделять пациентам, сообщающим о развитии нежелательных явлений со стороны кожи и слизистых оболочек (зуд, кожная сыпь, крапивница, фотосенсибилизация). В таких случаях должен рассматриваться вопрос о прекращении применения препарата АМЕЛОТЕКС®.

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. В наибольшей степени риску развития этой реакции подвержены пациенты пожилого возраста; пациенты, у которых отмечается дегидратация, хроническая сердечная недостаточность, цирроз печени, нефротический синдром или заболевания почек; пациенты, получающие диуретические средства, ингибиторы АПФ, антагонисты рецепторов ангиотензина II, а также пациенты, перенесшие серьезные хирургические вмешательства, приводящие к гиповолемии. У таких пациентов в начале терапии следует тщательно контролировать диурез и функцию почек (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами»).

У пациентов с почечной недостаточностью, если КК более 30 мл/мин, не требуется коррекции режима дозирования.

У пациентов с терминальной стадией почечной недостаточности, находящихся на гемодиализе, дозировка препарата АМЕЛОТЕКС® не должна превышать 7,5 мг/сутки.

При стойком и существенном повышении активности «печеночных» трансаминаз и изменений других показателей функции печени препарат следует отменить и проводить наблюдение за выявленными лабораторными изменениями. У пациентов с циррозом печени в стадии компенсации снижение дозы препарата не требуется.

Пациенты, принимающие одновременно мочегонные средства и препарат АМЕЛОТЕКС®, должны принимать достаточное количество жидкости.

АМЕЛОТЕКС®, также, как и другие НПВП, может маскировать симптомы инфекционных заболеваний.

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

Влияние лекарственного препарата на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Применение препарата может вызывать нежелательные эффекты в виде головной боли и головокружений, сонливости. Следует отказаться от управления транспортными средствами и механизмами.

Форма выпуска

Суппозитории ректальные, 7,5 мг и 15 мг.

По 1, 3 или 5 суппозитория в контурной ячейковой упаковке из пленки поливинилхлоридной/полиэтиленовой (ПВХ/ПЭ).

1 контурная ячейковая упаковка по 1 суппозиторию; 1, 2, 3 или 4 контурные ячейковые упаковки по 3 суппозитория; 1 или 2 контурные ячейковые упаковки по 5 суппозитория вместе с инструкцией по медицинскому применению в пачку из картона.

Срок годности

2 года.

Условия хранения

Не храните при температуре выше 25 °С.

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 31.01.2023 № 1767
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0002)

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Производитель

АО «Фармпроект», Россия

192236, г. Санкт-Петербург, ул. Софийская, д. 14, лит. А

Владелец регистрационного удостоверения/Организация, принимающая претензии потребителей

ЗАО «ФармФирма «Сотекс», Россия

141345, Московская обл., г. Сергиев Посад, пос. Беликово, д. 11.

Т./ф.: +7 (495) 956-29-30.