

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ
И СОЦИАЛЬНОГО РАЗВИТИЯ
РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ
ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата
для медицинского применения

МЕЛОКСИКАМ

наименование лекарственного препарата

Регистрационный номер: ЛС-001708

Торговое название препарата: Мелоксикам

Международное непатентованное название:

мелоксикам

Лекарственная форма: таблетки

Состав

1 таблетка содержит:

действующее вещество: мелоксикам 7,5 мг и 15 мг;

вспомогательные вещества: крахмал картофельный 16,7 мг; 33,4 мг, кремния диоксид коллоидный 2,2 мг; 4,4 мг, лактозы моногидрат 82,5 мг; 165 мг, магния стеарат 1,1 мг; 2,2 мг.

Описание: таблетки плоскоцилиндрические с фаской, светло-желтого с зеленоватым оттенком цвета.

Фармакотерапевтическая группа: нестероидный противовоспалительный препарат (НПВП).

Код АТХ: M01AC06

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Мелоксикам - нестероидный противовоспалительный препарат, обладающий обезболивающим, противовоспалительным и жаропонижающим действием. Механизм действия связан с ингибированием синтеза простагландинов в результате избирательного подавления ферментативной активности циклооксигеназы-2 (ЦОГ-2), участвующей в биосинтезе простагландинов в области воспаления. При применении в высоких дозах, длительном применении и индивидуальных особенностях организма ЦОГ-2 селективность снижается. Подавляет синтез простагландинов в области воспаления в большей степени, чем в слизистой оболочке желудка или почках, что связано с относительно избирательным ингибированием ЦОГ-2. Реже вызывает эрозивно-язвенные изменения желудочно-кишечного тракта (ЖКТ). В меньшей степени мелоксикам действует на циклооксигеназу-1 (ЦОГ-1), участвующую в синтезе простагландинов, защищающих слизистую оболочку ЖКТ и принимающих 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. Равновесная концентрация 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'-карбоксии-мелоксикам (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.

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. Объем распределения низкий, и составляет в среднем 11 л.

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

Показания к применению

Симптоматическое лечение остеоартроза;

Симптоматическое лечение ревматоидного артрита;

Симптоматическое лечение анкилозирующего спондилита (болезнь Бехтерева), других дегенеративных заболеваний суставов, сопровождающихся болевым синдромом.

Противопоказания

- гиперчувствительность к мелоксикаму или вспомогательным компонентам препарата; в состав входит лактоза, поэтому пациенты с редкими наследственными заболеваниями, такими как непереносимость лактозы, дефицит лактазы или глюкозо-галактозной мальабсорбцией не должны принимать препарат;

- состояние после проведения аортокоронарного шунтирования;

- декомпенсированная сердечная недостаточность;

- анамнестические данные о приступе бронхообструкции, ринита,

- крапивницы после приема ацетилсалициловой кислоты или иного НПВП (полное или неполное сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза носа и околоносовых пазух и непереносимости ацетилсалициловой кислоты или других нестероидных противовоспалительных препаратов (в т.ч. в анамнезе);

- эрозивно-язвенные изменения слизистой оболочки желудка или 12-перстной кишки, активное желудочно-кишечное кровотечение;

- воспалительные заболевания кишечника (язвенный колит, болезнь Крона);

- цереброваскулярное кровотечение или иные кровотечения;

- выраженная печеночная недостаточность или активное заболевание печени;

- хроническая почечная недостаточность (ХПН) 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 12 лет.

С осторожностью

Ишемическая болезнь сердца, цереброваскулярные заболевания, застойная сердечная недостаточность, дислипидемия/гиперлипидемия, сахарный диабет, заболевания периферических артерий, курение, анамнестические данные о развитии язвенного поражения ЖКТ, наличие инфекции *Helicobacter pylori*, ХПН с клиренсом креатинина 30-60 мл/мин, 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 максимально возможным коротким курсом.

Применение в период беременности и грудного вскармливания

Препарат не рекомендуется применять в период беременности и лактации.

Способ применения и дозы

Препарат принимают внутрь во время еды в суточной дозе 7,5-15 мг.

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 спондилит: 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 тяжелой почечной недостаточностью, находящихся на гемодиализе, доза не должна превышать 7,5 мг в сутки.

Побочное действие

Частота побочных реакций, приведенных ниже, определяется соответственно следующему:

- очень часто ($\geq 1/10$);
- часто ($\geq 1/100$, $< 1/10$);
- нечасто ($\geq 1/1000$, $< 1/100$);
- редко ($\geq 1/10\,000$, $< 1/1000$);
- очень редко ($< 1/10\,000$, включая отдельные сообщения)

Со стороны пищеварительной системы: часто - диспепсия, в т.ч. тошнота, рвота, абдоминальные боли, запор, метеоризм, диарея; нечасто - переходящее повышение активности "печеночных" трансаминаз, гипербилирубинемия, отрыжка, эзофагит, гастродуоденальная язва, кровотечение из ЖКТ (в т.ч. скрытое), стоматит; редко - перфорация ЖКТ, 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, многоформная 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, анафилактикоидные/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. Форсированный диурез, защелачивание мочи, 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 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, показано периодическое проведение 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, ускоряется выведение препарата из организма.

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 эрозивно-язвенных поражений ЖКТ. 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 незначительным или умеренным снижением функции почек (клиренс креатинина более 30 мл/мин) не требуется коррекции режима дозирования. Пациенты, принимающие одновременно мочегонные средства и мелоксикам, должны принимать достаточное количество жидкости.

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, планирующим беременность.

Если в процессе лечения возникли аллергические реакции (зуд, кожная сыпь, крапивница, фотосенсибилизация), а также пациентам, отмечающим на фоне приема препарата нарушения зрения, необходимо обратиться к врачу с целью решения вопроса о прекращении приема препарата.

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Таблетки по 7,5 мг и 15 мг.

По 10 или 30 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной или пленки ПВХ/ПВДХ и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 1, 2, 3 контурных ячейковых упаковки по 10 таблеток или по 1, 2 контурных ячейковых упаковки по 30 таблеток вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения

При температуре не выше 25 °С в упаковке производителя. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

4 года.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Юридическое лицо, на имя которого выдано регистрационное удостоверение

ЗАО «Канонфарма продакшн», Россия
141100, Московская область, г. Щелково, ул. Заречная, д. 105.
Тел.: (495) 797-99-54, факс: (495) 797-96-63.

Информация об организациях, в которые могут быть направлены претензии по качеству лекарственного препарата

ЗАО «Канонфарма продакшн», Россия.
141100, Московская область, г. Щелково, ул. Заречная, д. 105.
Тел.: (495) 797-99-54, факс: (495) 797-96-63.

Электронный адрес: safety@canonpharma.ru

Получить дополнительные данные о препарате, сообщить о нежелательных лекарственных реакциях можно по телефону 8 (800) 700-59-99 (бесплатная линия 24 часа) или на сайте www.canonpharma.ru в разделе "Политика в области качества" - "Безопасность препаратов".

Производитель

ЗАО «Канонфарма продакшн», Россия
141100, г. Щелково, Московская область,
ул. Заречная, д. 105.
Тел.: (495) 797-99-54, факс: (495) 797-96-63.

www.canonpharma.ru