

ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению препарата
Мелоксикам ДС

Регистрационный номер:

Торговое название препарата: Мелоксикам ДС

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

Международное непатентованное название: Мелоксикам

Лекарственная форма: раствор для внутримышечного введения

Состав:

1 ампула содержит:

Активный компонент – мелоксикам – 15 мг;

Вспомогательные компоненты: этанол, полоксамер 188, натрия хлорид, глицин, меглюмин, натрия гидроксид, вода для инъекций.

Описание: прозрачный раствор желтого с зеленым оттенком цвета.

Фармакотерапевтическая группа: Нестероидные противовоспалительные препараты

Код АТХ: M01AC06

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Мелоксикам – нестероидный противовоспалительный 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.

Фармакокинетика

Относительная биодоступность составляет почти 100%. После в/м введения препарата в дозе 5 мг C_{max} составляет 1.62 мкг/мл и достигается в течение приблизительно 60 мин. Мелоксикам хорошо связывается с белками плазмы, особенно с альбумином (99%). Проникает в синовиальную жидкость, концентрация в синовиальной жидкости составляет примерно 50% концентрации в плазме. V_d низкий, в среднем составляет 11 л. Межиндивидуальные различия составляют 30-40%.

Мелоксикам почти полностью метаболизируется в печени с образованием 4 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 изофермент СУР2С9, дополнительное значение имеет изофермент СУР3А4. 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 калом и мочой, преимущественно в виде метаболитов. В неизменном виде с калом выводится менее 5% от величины суточной дозы, в моче в неизменном виде препарат обнаруживается только в следовых количествах. Средний $T_{1/2}$ составляет 20 ч. Плазменный клиренс составляет в среднем 8 мл/мин.

Мелоксикам демонстрирует линейную фармакокинетику в дозах 7.5-15 мг при в/м введении.

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).

Противопоказания

- гиперчувствительность к активному веществу или вспомогательным компонентам;
- противопоказан в период после проведения аортокоронарного шунтирования;
- декомпенсированная сердечная недостаточность;
- полное или неполное сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза слизистой оболочки носа и околоносовых пазух и непереносимости ацетилсалициловой кислоты и других нестероидных противовоспалительных препаратов (в т.ч. в анамнезе);
- эрозивно-язвенные изменения слизистой оболочки желудка и 12-перстной кишки, активное желудочно-кишечное кровотечение;
- обострение воспалительных заболеваний 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 18 лет.

С осторожностью

Ишемическая болезнь сердца, цереброваскулярные заболевания, хроническая сердечная недостаточность, дислипидемия/гиперлипидемия, сахарный диабет, заболевания периферических артерий, курение, клиренс креатинина от 30 до 60 мл/мин. Анамнестические данные о развитии язвенного поражения желудочно-кишечного тракта, наличие инфекции *Helicobacter pylori*, пожилой возраст, длительное использование нестероидных противовоспалительных препаратов (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

Внутримышечно. Внутримышечное введение препарата показано только в течение первых 2-3 дней. В дальнейшем лечение продолжают с применением пероральных форм (таблетки).

Рекомендуемая доза составляет 7.5 мг или 15 мг 1 раз/сут, в зависимости от интенсивности болей и тяжести воспалительного процесса.

Препарат вводят глубоко внутримышечно. Внутривенное введение препарата запрещено! У пациентов с повышенным риском побочных реакций суточная доза не должна превышать 7.5 мг.

У пациентов с терминальной стадией почечной недостаточности, находящихся на гемодиализе, доза препарата не должна превышать 7.5 мг. У пациентов с небольшими или умеренными нарушениями функции почек (КК более 30 мл/мин) доза препарата не должна превышать 7.5 мг.

Режим дозирования препарата для внутримышечных инъекций у детей и подростков не определен, данная лекарственная форма может применяться только у взрослых пациентов. Максимальная рекомендуемая суточная доза - 15 мг.

При комбинированном применении различных лекарственных форм препарата его максимальная суточная доза в таблетках, суппозиториях и в виде раствора для инъекций составляет 15 мг.

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; <0.1% - перфорация ЖКТ, колит; гепатит, гастрит.

Со стороны системы кроветворения: более 1% - анемия; 0.1-1% - изменение формулы крови, в т.ч. лейкопения, тромбоцитопения.

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 ЦНС: более 1% - головокружение, головная боль; 0.1-1% - вертиго, шум в ушах, сонливость; менее 0.1% - спутанность сознания, дезориентация, 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, нарушения зрения, в т.ч. нечеткость зрения.

Аллергические реакции: менее 0.1% - ангионевротический отек, анафилактические/анафилактоидные реакции.

Местные реакции: более 1% - отечность в месте введения; менее 1% - болезненные ощущения в месте введения.

Передозировка

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

Лечение: специфического антидота нет; 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 НПВП (а также ацетилсалициловой кислотой) увеличивает риск возникновения эрозивно-язвенных поражений и кровотечений из желудочно-кишечного тракта;
- 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), антиагрегантами (ацетилсалициловая кислота, клопидогрел), а также с фибринолитическими препаратами (стрептокиназа, фибринолизин) увеличивается риск развития кровотечений (необходим периодический контроль показателей свертываемости крови);
- при одновременном применении с селективными ингибиторами обратного захвата серотонина возрастает риск желудочно-кишечных кровотечений.

Особые указания

- Следует соблюдать осторожность при применении препарата у пациентов, в анамнезе у которых язвенная болезнь желудка или двенадцатиперстной кишки, а также у пациентов, находящихся на антикоагулянтной терапии. У таких пациентов повышен риск возникновения эрозивно-язвенных 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 недостаточностью, если клиренс креатинина более 30 мл/мин не требуется коррекции режима дозирования.
- У пациентов, находящихся на диализе, дозировка препарата 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, фотосенсибилизация) необходимо обратиться к врачу с целью решения вопроса о прекращении приема препарата.

- Мелоксикам, как и другие нестероидные противовоспалительные препараты, может маскировать симптомы инфекционных заболеваний.
- Применение мелоксикама, как и других препаратов, блокирующих синтез простагландинов, может влиять на фертильность, поэтому не рекомендуется женщинам, планиующим беременность.

Управление транспортными средствами, обслуживание машин и механизмов

Применение препарата может вызвать возникновение нежелательных эффектов в виде головной боли и головокружения, сонливости. Следует отказаться от управления транспортными средствами и обслуживания машин и механизмов, требующих концентрации внимания.

Форма выпуска

Раствор для внутримышечного введения 10 мг/мл (15 мг/ 1,5 мл).

По 1,5 мл препарата в стеклянную ампулу. По 3 стеклянные ампулы в поддон пластмассовый контурный. По 1 поддону пластмассовому контурному вместе с инструкцией по медицинскому применению в картонную пачку.

Условия хранения

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

Хранить в местах, недоступных для детей!

Срок годности: 3 года.

Не использовать после истечения срока годности.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Производитель: Чжанцзякоу Кайвэй Фармасьютикал Ко. Лтд., Китай
№ 27, Лингиван Роуд, Чжанцзякоу, провинция Хэбэй, Китай

Адрес и телефон уполномоченной организации:

ЗАО «ДОМИНАНТА-СЕРВИС»

142100, Московская область, г. Подольск, ул. Комсомольская, д. 1

Тел./факс (495) 580-3060, (495) 580-3061.

Директор «Дансон Трейдинг
Фармасьютикал Компани Лимитед»



Фам Хак Ха

