

І Н С Т Р У К Ц І Я
для медичного застосування препарату
МЕЛОКСИКАМ-ЛХ
(MELOXICAMUM-LH)

Загальна характеристика.

міжнародна та хімічна назва: meloxicam; 4-гідрокси-2-метил-N-(5-метил-2-тіазоліл)-2Н-1,2-бензо-тіазин-3-карбоксамід 1,1-діоксид;

основні фізико-хімічні властивості: супозиторії світло-жовтого із зеленуватим відтінком кольору. На поверхні супозиторію допускається наявність нальоту;

склад: 1 супозиторій містить мелоксикаму 15 мг;

допоміжні речовини: твердий жир.

Форма випуску. Супозиторії ректальні.

Фармакотерапевтична група. Засоби, що впливають на опорно-руховий апарат. Нестероїдні протизапальні і протиревматичні засоби. Мелоксикам. Код АТС М01А С06.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Протизапальний, аналгетичний, жарознижувальний засіб. Механізм дії зумовлений переважно селективним пригніченням циклооксигенази-2, що призводить до пригнічення біосинтезу прозапальних простагландинів у вогнищі запалення. Завдяки низькій спорідненості до циклооксигенази-1 препарат в терапевтичних дозах не чинить негативного впливу на біосинтез цитопротективних простагландинів у шлунково-кишковому тракті і нирках, а також не пригнічує функціональну активність тромбоцитів. Є хондронейтральним препаратом, не впливає на синтез протеоглікану хондроцитами суглобового хряща.

Фармакокінетика. При ректальному застосуванні мелоксикам добре адсорбується у системний кровоток, біодоступність складає 89 %. Стабільна терапевтична концентрація в крові досягається після 3 - 5 днів після початку лікування. Зв'язування з білками плазми становить більше 99 %. Підлягає біотрансформації у печінці, переважно шляхом окиснення з утворенням 4-х неактивних метаболітів. Основну роль в метаболізмі мелоксикаму відіграють ферменти СYP2СР і СYP3А4, а також пероксидаза. Об'єм розподілу препарату низький – в середньому 11 л, плазмовий кліренс – 8 мл/хв. Період напіввиведення становить близько 20 годин, що дозволяє приймати його 1 раз на добу. Виведення з організму відбувається нирками і кишечником в рівних пропорціях; 5 % добової дози екскретується в незмінному вигляді кишечником. Препарат проходить крізь гістогематичні бар'єри, добре проникає у синовіальну рідину, де його концентрація становить 50 % від рівня в плазмі крові.

У осіб літнього віку спостерігається лише незначне збільшення періоду напіввиведення препарату, а також зниження плазмового кліренсу (особливо у жінок).

Не помічено суттєвої зміни фармакокінетики мелоксикаму і збільшення ризику розвитку побічних ефектів при призначенні препарату хворим з печінковою або помірною нирковою недостатністю (кліренс креатиніну 20 - 40 мл/хв).

Показання для застосування. Запальні і дегенеративні захворювання суглобів (артрози, остеоартрит), ревматоїдний артрит, анкілозуючий спондилоартрит.

Спосіб застосування та дози. Дорослим і дітям старше 15 років призначають по 1 супозиторію ректально 1 раз на добу.

Супозиторії мелоксикаму призначені для застосування упродовж нетривалого часу (5 - 7 діб), після чого слід переходити на застосування мелоксикаму у формі таблеток.

Побічна дія.

З боку шлунково-кишкового тракту: диспепсія, нудота, блювання, болі в животі, запор, метеоризм, діарея; рідко – езофагіт, стоматит, відрижка, ерозивно-виразкові ураження шлунково-кишкового тракту, прихована або макроскопічно видима шлунково-кишкова кровотеча, транзиторні зміни функції печінки (підвищення рівня печінкових трансаміназ або білірубину); у окремих випадках – перфорація кишечнику, коліт.

З боку центральної і периферичної нервової системи: головний біль; рідко - запаморочення, шум у вухах, сонливість; у окремих випадках – зміни настрою, порушення орієнтації, безсоння, нічні кошмари.

З боку серцево-судинної системи: набряки, рідко – підвищення артеріального тиску, тахікардія.

З боку сечовидільної системи: рідко – зміни лабораторних показників функції нирок (підвищення рівня креатиніну та/або сечовини у крові); у окремих випадках – гостра ниркова недостатність.

З боку системи кровотворення: рідко – анемія, лейкопенія, тромбоцитопенія.

Дерматологічні реакції: свербіж, висипи; рідко – кропив'янка; в окремих випадках – фотосенсибілізація, бульозні реакції, мультиформна еритема, синдром Стівенса-Джонсона, токсичний епідермальний некроліз.

Алергічні реакції: в окремих випадках – ангіоневротичний набряк, реакції гіперчутливості негайного типу (у тому числі анафілактичні і анафілактоїдні).

Інші: можливі реакції місцевого подразнення (печіння, свербіж в аноректальній ділянці), у окремих випадках – кон'юнктивіт, порушення зору (нечіткість).

Протипоказання. Запальні захворювання прямої кишки, ректальна або анальна кровотеча (у т.ч. в анамнезі), виразкова хвороба шлунка або дванадцятипалої кишки у фазі загострення, виражені порушення функції печінки, ниркова недостатність (без проведення гемодіалізу), підвищена індивідуальна чутливість до мелоксикаму та інших нестероїдних протизапальних засобів і/або компонентів препарату, вагітність, період годування груддю вигодовування, вік до 15 років.

Передозування. Симптомами гострого передозування є летаргія, сонливість, нудота, блювання, біль в епігастральній ділянці, можливі шлунково-кишкові кровотечі. Тяжке отруєння може призвести до артеріальної гіпертензії, гострої ниркової недостатності, дисфункції печінки, коми, зупинки серця. Можливі явища, що описані у розділі Побічна дія. Лікування: відміна препарату, промивання прямої кишки, симптоматична терапія. Специфічного антидоту немає.

Особливості застосування. З обережністю призначають хворим, що мають в анамнезі виразкову хворобу шлунка або дванадцятипалої кишки, а також пацієнтам, що отримують антикоагулянтну терапію. У випадку виникнення пептичної виразки або шлунково-кишкової кровотечі препарат слід відмінити.

З обережністю слід призначати препарат пацієнтам літнього віку з порушеннями функції печінки, нирок, вираженим атеросклерозом, артеріальною гіпертензією, ішемічною хворобою серця, серцевою недостатністю, порушеннями мозкового кровообігу, інсультом, інфарктом в анамнезі, а також виснаженим і ослабленим хворим.

При появі змін показників функції печінки лікування мелоксикамом слід припинити і провести контрольні лабораторні дослідження.

Нестероїдні протизапальні засоби пригнічують синтез ниркових простагландинів, що беруть участь у підтриманні нормального рівня ниркового кровотоку. Тому при призначенні нестероїдних протизапальних засобів пацієнтам зі зниженим нирковим кровотоком або об'ємом циркулюючої крові існує ризик розвитку декомпенсації нирок. Зрідка препарати цієї групи можуть викликати інтерстиціальний нефрит, гломерулонефрит, некроз мозкової речовини нирок або нефротичний синдром. Можливий негативний вплив нестероїдних протизапальних засобів на нирки необхідно

враховувати при призначенні мелоксикаму пацієнтам з дегідратацією, застійною серцевою недостатністю, цирозом печінки, нефротичним синдромом, тяжкими порушеннями функції нирок, а також пацієнтам, що приймають діуретики, що перенесли оперативне втручання, яке призвело до гіповолемії. У пацієнтів цих категорій з початку лікування мелоксикамом слід контролювати діурез і функцію нирок. При виникненні побічних явищ з боку центральної нервової системи (сонливості та ін.), органу зору пацієнтам слід відмовитися від керування транспортними засобами або роботи з механізмами.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами. При одночасному застосуванні мелоксикаму з іншими нестероїдними протизапальними засобами підвищується ризик розвитку ерозивно-виразкових уражень і кровотеч у шлунково-кишковому тракті.

Слід уникати сумісного застосування препарату з антикоагулянтами, тромболітиками, антиагрегантами у зв'язку зі збільшенням ризику розвитку кровотеч.

При одночасному застосуванні з діуретиками підвищується ризик розвитку гострої ниркової недостатності у пацієнтів з дегідратацією, у зв'язку з чим пацієнти, що отримують мелоксикам у сполученні з діуретиками, повинні отримувати достатню кількість рідини. Цій категорії пацієнтів перед початком терапії мелоксикамом необхідно дослідити функцію нирок.

Мелоксикам може викликати затримку натрію, калію, рідини, в результаті чого у пацієнтів зі схильністю зростає ризик прогресування серцевої недостатності і артеріальної гіпертензії.

Мелоксикам знижує ефективність бета-адреноблокаторів, інгібіторів ангіотензинперетворюючого ферменту, вазодилататорів, діуретиків, внутрішньоматкових контрацептивів.

Мелоксикам може підсилювати гематотоксичність метотрексату, у зв'язку з чим при одночасному їх застосуванні необхідний лабораторний контроль периферичної крові. Мелоксикам підсилює нефротоксичність циклоспорину, тому при одночасному їх застосуванні слід контролювати функцію нирок.

При одночасному застосуванні мелоксикаму з препаратами літію помічається підвищення рівня літію в плазмі крові. Холестирамін прискорює виведення мелоксикаму.

Можлива фармакокінетична взаємодія мелоксикаму з гіпоглікемічними препаратами, а також засобами, що модифікують активність або такими, що метаболізуються за допомогою цитохрому 2C9 або цитохрому 3A4.

Не виявлено клінічно значущої взаємодії з антацидами, циметидином, дигоксином і фуросемідом.

Умови та термін зберігання. Зберігати в захищеному від світла місці, при температурі від +8 °С до +15 °С. Зберігати у недоступному для дітей місці!

Термін придатності – 2 роки.

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка. По 5 супозиторіїв у блістері, по 2 блістера в пачці з картону.

Виробник. ЗАТ «Лекхім-Харків».

Адреса. 61115, Україна, м. Харків, вул. 17-го Партз'їзду, 36.