Амелотекс (таблетки)



Код АТХ:

- M02AA

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Мелоксикам

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Таблетки круглые, двояковыпуклые, бледно-желтого или бледно-желтого со слабым зеленоватым оттенком цвета, допускается наличие мраморности и легкой шероховатости.

	1 таб.
мелоксикам	7.5 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 76.92 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 57.6 мг, натрия цитрат - 18 мг, повидон - 5.4 мг, кросповидон - 10.8 мг, кремния диоксид коллоидный - 1.44 мг, магния стеарат - 2.34 мг.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.

Таблетки круглые, двояковыпуклые, с риской на одной стороне, бледно-желтого или бледно-желтого со слабым зеленоватым оттенком цвета, допускается наличие мраморности и легкой шероховатости.

	1 таб.
мелоксикам	15 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 71.22 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 55.8 мг, натрия цитрат - 18 мг, повидон - 5.4 мг, кросповидон - 10.8 мг, кремния диоксид коллоидный - 1.44 мг, магния стеарат - 2.34 мг.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Ненаркотические анальгетики, включая нестероидные и другие противовоспалительные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

НПВС. Обладает обезболивающим, противовоспалительным и жаропонижающим действием.

Противовоспалительное действие связано с торможением ферментативной активности ЦОГ-2, участвующей в биосинтезе простагландинов в области воспаления. В меньшей степени мелоксикам действует на ЦОГ-1, участвующую в синтезе простагландина, защищающего слизистую оболочку ЖКТ и принимающего участие в регуляции кровотока в почках.

Фармакокинетика

Всасывание и распределение

Хорошо всасывается из ЖКТ, абсолютная биодоступность мелоксикама - 89%. Одновременный прием пищи не изменяет всасывание. При применении препарата внутрь в дозах 7.5 и 15 мг его концентрации пропорциональны дозам.

C_{ss} достигаются в течение 3-5 дней. При длительном применении препарата (более 1 года), концентрации сходны с таковыми, которые отмечаются после первого достижения C_{ss}.

Связывание с белками плазмы составляет более 99%. Диапазон различий между максимальными и базальными концентрациями препарата после его приема 1 раз/сут относительно невелик и составляет при применении в дозе 7.5 мг 0.4-1 мкг/мл, а при применении в дозе 15 мг – 0.8-2 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. V_d низкий и составляет в среднем 11 л.

Метаболизм и выведение

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 препарата) принимает участие пероксидаза, активность которой, вероятно, индивидуально варьирует.

Выводится в равной степени через кишечник и почки, преимущественно в виде метаболитов. Через кишечник в неизмененном виде выводится менее 5% от величины суточной дозы, в моче в неизмененном виде препарат обнаруживается только в следовых количествах. $T_{1/2}$ мелоксикама составляет 15-20 ч. Плазменный клиренс составляет в среднем 8 мл/мин.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

У лиц пожилого возраста клиренс препарата снижается.

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

Показания к применению:

— остеоартроз;

— ревматоидный артрит;

— анкилозирующий спондилоартрит (болезнь Бехтерева).

Предназначен для симптоматической терапии, уменьшения боли и воспаления на момент использования, на прогрессирование заболевания не влияет.

Относится к болезням:

- Анкилозирующий спондилоартрит
- Артрит
- Артроз
- Воспаление
- Остеоартрит
- Остеоартроз
- Ревматоидный артрит
- Спондилоартрит

Противопоказания:

— период после проведения аортокоронарного шунтирования;

— декомпенсированная сердечная недостаточность;

— полное или неполное сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза носа и околоносовых пазух и непереносимости ацетилсалициловой кислоты и других НПВС (в т.ч. в анамнезе);

— эрозивно-язвенные изменения слизистой оболочки желудка или двенадцатиперстной кишки;

— активное желудочно-кишечное кровотечение;

— воспалительные заболевания кишечника (неспецифический язвенный колит, болезнь Крона);

— цереброваскулярное кровотечение или иные кровотечения;

— выраженная печеночная недостаточность или активное заболевание печени;

— выраженная почечная недостаточность у пациентов, не подвергающихся диализу (КК <30 мл/мин);

— прогрессирующие заболевания почек в т.ч. подтвержденная гиперкалиемия;

— беременность;

— период грудного вскармливания;

— детский возраст до 15 лет;

— повышенная чувствительность к активному веществу или вспомогательным компонентам.

В связи с наличием в составе препарата лактозы пациентам с редкими наследственными заболеваниями, такими как непереносимость лактозы, дефицит лактазы или глюкозо-галактозной мальабсорбцией принимать препарат не следует.

С осторожностью: для снижения риска развития нежелательных явлений следует использовать минимальную эффективную дозу минимально возможным коротким курсом при ИБС, цереброваскулярных заболеваниях, застойной сердечной недостаточности, дислипидемии/гиперлипидемии, сахарном диабете, заболеваниях периферических артерий, курении, КК <60 мл/мин, анамнестических данных о развитии язвенного поражения ЖКТ, при наличии инфекции Helicobacter pylori, при длительном использовании НПВС, тяжелых соматических заболеваниях, сопутствующей терапии антикоагулянтами (например, варфарин), антиагрегантами (например, ацетилсалициловая кислота, клопидогрел), ГКС для приема внутрь (например, преднизолон), селективными ингибиторами обратного захвата серотонина (например, циталопрам, флуоксетин, пароксетин, сертралин), частом употреблении алкоголя, в пожилом возрасте.

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь во время еды 1 раз/сут.

Рекомендуемый режим дозирования при *ревматоидном артрите* - 15 мг/сут. В зависимости от лечебного эффекта доза может быть снижена до 7.5 мг/сут.

При *остеоартрозе* – 7.5 мг/сут. При неэффективности доза может быть увеличена до 15 мг/сут.

При *анкилозирующем спондилоартрите* - 15 мг/сут.

Максимальная суточная доза не должна превышать 15 мг.

У пациентов с повышенным риском развития побочных эффектов, а также у **пациентов с выраженной почечной недостаточностью**, **находящихся на гемодиализе**, доза не должна превышать 7.5 мг/сут.

Побочное действие:

Со стороны ЖКТ: 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; менее 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, многоформная эритема, в т.ч. синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз.

Со стороны дыхательной системы: менее 0.1% - бронхоспазм.

Со стороны нервной системы: 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, нарушение зрения, в т.ч. нечеткость зрения.

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

Передозировка:

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

Лечение: специфического антидота нет; показано промывание желудка, применение активированного угля (в течение ближайшего часа), проведение симптоматической терапии. Колестирамин ускоряет выведение препарата из организма. Форсированный диурез и гемодиализ малоэффективны из-за высокой связывания препарата с белками крови.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат противопоказан при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

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

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с другими НПВС (а также с ацетилсалициловой кислотой) увеличивается риск возникновения эрозивно-язвенных поражений и кровотечений из ЖКТ.

При одновременном применении с антигипертензивными 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), а также с тромболитическими препаратами (стрептокиназа, фибринолизин) увеличивается риск развития кровотечений (необходим периодический контроль показателей свертываемости крови).

При одновременном применении с колестирамином, в результате связывания мелоксикама, усиливается его выведение через ЖКТ.

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

Особые указания и меры предосторожности:

Следует соблюдать осторожность при применении препарата у пациентов, в анамнезе у которых имеются указания на язвенную болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, а также у пациентов, получающих антикоагулянтную терапию. У таких пациентов повышен риск возникновения язвенно-эрозивных заболеваний 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 почечной недостаточностью, если КК >30 мл/мин, требуется коррекции режима дозирования.

У пациентов, находящихся на гемодиализе, дозировка препарата не должна превышать 7.5 мг/сут.

При стойком и существенном повышении активности трансаминаз и изменении других показателей функции печени препарат следует отменить и провести контрольные тесты.

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 прекратить прием препарата.

Мелоксикам, также как и другие НПВС, может маскировать симптомы инфекционных заболеваний.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

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

При нарушениях функции почек

Противопоказано применение препарата при выраженной почечной недостаточности у пациентов, не подвергающихся диализу (КК <30 мл/мин); прогрессирующих заболеваниях почек, в т.ч. при подтвержденной гиперкалиемии.

С осторожностью следут назначать препарат при КК <60 мл/мин.

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

У **пациентов с выраженной почечной недостаточностью**, **находящихся на гемодиализе**, доза не должна превышать 7.5 мг/сут.

При нарушениях функции печени

Противопоказано применение препарата при выраженной печеночной недостаточности или активном заболевании печени.

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью следует применять препарат у пациентов пожилого возраста.

Применение в детском возрасте

Противопоказано применение препарата в детском возрасте до 15 лет.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в сухом, защищенном от света, недоступном для детей месте при температуре не выше 25°С. Не использовать по истечении срока годности.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Ameloteks_tabletki