Месипол



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:

Раствор для в/м введения желтого или зеленовато-желтого цвета, прозрачный, с характерным запахом.

	1 мл
мелоксикам	10 мг

Вспомогательные вещества: меглюмин - 6.25 мг, гликофурол - 100 мг, полоксамер 188 - 50 мг, натрия хлорид - 3 мг, глицин - 5 мг, натрия гидроксид - 152 мкг, вода д/и - до 1 мл.

1.5 мл - ампулы стеклянные вместимостью 2 мл (3) - пачки картонные.
1.5 мл - ампулы стеклянные вместимостью 2 мл (5) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

НПВП. Оказывает анальгезирующее, противовоспалительное и жаропонижающее действие. 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 ЖКТ и принимающего участие в регуляции кровотока в почках.

Фармакокинетика

Всасывание

Мелоксикам полностью абсорбируется после в/м введения. Биодоступность препарата составляет около 100%. После в/м введения 15 мг мелоксикама C_{max} в плазме, составляющая 1.62 мкг/мл, достигается приблизительно через 1 ч.

Распределение

Мелоксикам связывается с белками плазмы (главным образом с альбумином) в значительной степени - 99%. Проходит через гистогематические барьеры, проникает в синовиальную жидкость. Концентрация в синовиальной жидкости составляет 50% от плазменной концентрации препарата. V_d низкий и составляет 11 л.

Метаболизм

Мелоксикам почти полностью метаболизируется в печени с образованием четырех фармакологически неактивных метаболитов. Основной метаболит, 5'-карбоксимелоксикам (60% от введенной дозы), образуется посредством окисления промежуточного метаболита, 5'-гидроксиметилмелоксикама (9% от введенной дозы). In vitro исследования показали, что в данном метаболическом превращении важную роль играет изофермент CYP2C9 и дополнительное значение имеет изофермент CYP3A4. В образовании двух других метаболитов, которые составляют 16% и 4% от введенной дозы препарата, вероятно, принимает участие пероксидаза, активность которой индивидуально варьирует.

Выведение

Значительная кишечно-печеночная циркуляция, характерная для мелоксикама, не влияет на элиминацию препарата. Мелоксикам выводится преимущественно в виде метаболитов, в равной степени почками и кишечником. В неизмененном виде выводится менее 5% мелоксикама кишечником, и лишь следовые количества неизмененного препарата определяются в моче.

Средний $T_{1/2}$ мелоксикама составляет 20 ч. Плазменный клиренс составляет в среднем 8 мл/мин.

Показания к применению:

Симптоматическое лечение:

— ревматоидного артрита;

— остеоартроза;

— анкилозирующего спондилита (болезнь Бехтерева);

— других воспалительных и дегенеративных заболеваний суставов, сопровождающихся болевым синдромом.

Относится к болезням:

- Артрит
- Артроз
- Болевой синдром
- Остеоартрит
- Остеоартроз

Противопоказания:

— полное или неполное сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза носа и околоносовых пазух и непереносимости ацетилсалициловой кислоты и других НПВП (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);

— период после проведения аортокоронарного шунтирования;

— декомпенсированная сердечная недостаточность;

— цереброваскулярное кровотечение или иные кровотечения;

— выраженная печеночная недостаточность или активное заболевание печени;

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

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

— беременность;

— период грудного вскармливания;

— детский возраст до 18 лет;

— повышенная чувствительность к активному веществу или вспомогательным компонентам.

С *осторожностью:* пожилой возраст, ИБС, хроническая сердечная недостаточность, цереброваскулярные

заболевания, дислипидемия/гиперлипидемия, сахарный диабет, заболевания периферических артерий, курение, клиренс креатинина менее 60 мл/мин, язвенные поражения ЖКТ в анамнезе, наличие инфекции Helicobacter pylori, длительное использование НПВП, частое употребление алкоголя, тяжелые соматические заболевания, одновременный прием пероральных ГКС (в т.ч. преднизолона), антикоагулянтов (в т.ч. варфарина), антиагрегантов (в т.ч. ацетилсалициловой кислоты, клопидогрела), селективных ингибиторов обратного захвата серотонина (в т.ч. циталопрама, флуоксетина, пароксетина, сертралина).

Способ применения и дозы:

В/м 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 вводится посредством глубокой в/м инъекции.

Учитывая возможную несовместимость, содержимое ампул Месипол не следует смешивать в одном шприце с другими лекарственными средствами.

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

Препарат нельзя вводить в/в.

Максимальная суточная доза мелоксикама составляет 15 мг.

Комбинированное применение: суммарная суточная доза препарата Месипол, применяемого в виде таблеток, свечей, суспензии для приема внутрь и инъекций, не должна превышать 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, эрозивно-язвенные поражения ЖКТ, скрытое или явное кровотечение из ЖКТ, стоматит; менее 0.1% - перфорация органов 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 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, ощущение сердцебиения, 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 органа зрения: менее 0.1% - конъюнктивит, нарушение зрения (в т.ч. нечеткость зрения).

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

Местные реакции: возможны жжение и боль в месте инъекции.

Передозировка:

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

Лечение: специфический антидот отсутствует. Рекомендуется промывание желудка и симптоматическая терапия. В клинических исследованиях показано, что колестирамин ускоряет выведение мелоксикама. Гемодиализ малоэффективен из-за высокой связи с белками крови.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат противопоказан при беременности и в период грудного вскармливания.

Применение мелоксикама, как и других препаратов, блокирующих синтез простагландинов может влиять на фертильность, поэтому не рекомендуется женщинам, желающим забеременеть.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с другими НПВП (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, показан периодический контроль общего анализа крови).

При одновременном применении с диуретиками возрастает риск развития почечной недостаточности.

При одновременном применении с циклоспорином усиливается нефротоксическое действие мелоксикама.

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;

Миелотоксические лекарственные средства усиливают проявления гематотоксичности мелоксикама.

Особые указания и меры предосторожности:

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 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 недостаточность (КК более 25 мл/мин) не требуется коррекции режима дозирования.

У пациентов, находящихся на диализе, доза препарата не должна превышать 7.5 мг/сут.

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 НПВП, 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 и

головокружений, сонливости. Следует отказаться от управления транспортными средствами и обслуживания машин и механизмов, требующих концентрации внимания.

При нарушениях функции почек

Противопоказан при выраженной почечной недостаточности у больных, не подвергающихся диализу (КК менее 30 мл/мин); прогрессирующих заболеваниях почек, в т.ч. подтвержденных гиперкалиемией.

При нарушениях функции печени

Противопоказан при выраженной печеночной недостаточности или активном заболевании печени.

Применение в пожилом возрасте

С *осторожностью:* пожилой возраст.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в защищенном от света, недоступном для детей месте при температуре не выше 25°С.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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