Мовалис (свечи)



Код АТХ:

- M01AC06

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:

Суппозитории ректальные гладкие, желтовато-зеленого цвета, с углублением в основании.

	1 супп.
мелоксикам	7.5 мг
-"-	15 мг

Вспомогательные вещества: суппозиторная масса (суппоцир BP), макрогола глицерилгидроксистеарат (полиэтиленгликоля глицерилгидроксистеарат), (cremophor RH40).

6 шт. - упаковки контурные (1) - пачки картонные.
6 шт. - упаковки контурные (2) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Ненаркотические анальгетики, включая нестероидные и другие противовоспалительные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

НПВС, относится к производным еноловой кислоты и оказывает противовоспалительное, анальгезирующее и жаропонижающее действие. Выраженное противовоспалительное действие мелоксикама установлено на всех стандартных моделях воспаления.

Механизм действия мелоксикама состоит в его способности ингибировать синтез простагландинов - известных медиаторов воспаления. In vivo мелоксикам ингибирует синтез простагландинов в месте воспаления в большей степени, чем в слизистой оболочке желудка или почках. Эти различия связаны с более селективным ингибированием ЦОГ-2 по сравнению с ЦОГ-1.

Считается, что ингибирование ЦОГ-2 обеспечивает терапевтический эффект НПВС, тогда как ингибирование постоянно присутствующего изофермента ЦОГ-1 может быть причиной побочных действий со стороны желудка и

почек.

Селективность мелоксикама в отношении ЦОГ-2 подтверждена в различных тест-системах, как in vitro, так и ex vivo. Селективная способность мелоксикама ингибировать ЦОГ-2 показана при использовании в качестве тест-системы цельной крови человека in vitro. Ex vivo установлено, что мелоксикам (в дозах 7.5 мг и 15 мг) активнее ингибировал ЦОГ-2 (оказывая большее ингибирующее влияние на продукцию простагландина E_2, стимулируемую липополисахаридом /реакция, контролируемая ЦОГ-2/), чем на продукцию тромбоксана, участвующего в процессе свертывания крови (реакция, контролируемая ЦОГ-1). Эти эффекты зависели от величины дозы.

Ex vivo показано, что мелоксикам в рекомендуемых дозах не влиял на агрегацию тромбоцитов и время кровотечения в отличие от индометацина, диклофенака, ибупрофена и напроксена, которые значительно подавляли агрегацию тромбоцитов и увеличивали время кровотечения.

В клинических исследованиях побочные эффекты со стороны ЖКТ в целом возникали реже при приеме мелоксикама 7.5 мг и 15 мг, чем при приеме других НПВС, с которыми проводилось сравнение. Это различие в частоте побочных эффектов со стороны ЖКТ в основном связано с тем, что при приеме мелоксикама реже наблюдались такие явления как диспепсия, рвота, тошнота, абдоминальные боли. Частота перфораций в верхних отделах ЖКТ, язв и кровотечений, которые были связаны с применением мелоксикама, была низкой и зависела от величины дозы препарата.

Фармакокинетика

Всасывание и распределение

Показано, что суппозитории биоэквивалентны таблеткам. C_{max} препарата в плазме в период устойчивого состояния фармакокинетики достигается приблизительно через 5 ч после применения препарата. Диапазоны различий между C_{max} и C_{min} схожи для таблеток и суппозиториев.

Мелоксикам хорошо связывается с белками плазмы (с альбуминами - 99%). Мелоксикам проникает в синовиальную жидкость; местные концентрации составляют примерно 50% от концентраций в плазме. V_d низкий, в среднем составляет 11 л. Индивидуальные колебания - 30-40%.

Метаболизм

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 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.

Выведение

Выводится в равной степени с калом и мочой, преимущественно в виде метаболитов. В неизмененном виде с калом выводится менее 5% от величины суточной дозы, в моче в неизмененном виде препарат обнаруживается только в следовых количествах. Средний $T_{1/2}$ составляет 20 ч. Плазменный клиренс составляет в среднем 8 мл/мин.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Недостаточность функции печени, а также слабо или умеренно выраженная почечная недостаточность существенного влияния на фармакокинетику мелоксикама не оказывает. При терминальной почечной недостаточности увеличение V_d может привести к более высоким концентрациям свободного мелоксикама, поэтому у этих пациентов суточная доза не должна превышать 7.5 мг.

У пожилых пациентов средний плазменный клиренс в период устойчивого состояния фармакокинетики немного ниже, чем у молодых пациентов.

Во время исследования мелоксикама у детей была изучена фармакокинетика препарата в дозах, применявшихся из расчета 0.25 мг/кг. При сравнении показателей у детей разного возраста (2-6 лет, n=7 и 7-14 лет, n=11) установлена тенденция к более низкой C_{max} (уменьшение на 34%) и AUC (уменьшение на 28%) у детей младшего возраста, а клиренс препарата (с поправкой на массу тела) у этой группы детей был более высоким. Концентрации мелоксикама в плазме *у* детей старшего возраста и взрослых сходны. У детей обеих возрастных групп $T_{1/2}$ мелоксикама из плазмы были одинаковыми и составляли 13 ч, но несколько более короткими, чем у взрослых - 15-20 ч.

Показания к применению:

Симптоматическое лечение:

— остеоартрит (артроз, дегенеративные заболевания суставов);

— ревматоидный артрит;

— анкилозирующий спондилит.

Относится к болезням:

- Артрит
- Артроз
- Остеоартрит
- Остеоартроз
- Ревматоидный артрит

Противопоказания:

— пациенты, у которых ранее после приема ацетилсалициловой кислоты или других НПВС отмечались симптомы бронхиальной астмы, полипоз носа, ангионевротический отек или крапивница;

— язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки в фазе обострения, с перфорацией или недавно перенесенная;

— обострение острых воспалительных заболеваний кишечника (болезнь Крона, язвенный колит);

— тяжелая недостаточность функции печени;

— почечная недостаточность тяжелой степени (КК менее 30 мл/мин, без проведения гемодиализа);

— активное желудочно-кишечное кровотечение, недавно перенесенное цереброваскулярное кровотечение или диагностированные системные геморрагические заболевания;

— тяжелая неконтролируемая сердечная недостаточность;

— подтвержденная гиперкалиемия;

— беременность;

— лактация (грудное вскармливание);

— детский и подростковый возраст до 12 лет (за исключением применения при установленном диагнозе - ювенильный ревматоидный артрит);

— повышенная чувствительность к компонентам препарата (существует вероятность перекрестной чувствительности к ацетилсалициловой кислоте и другим НПВС).

Не следует применять препарат для устранения послеоперационных болей (после операции коронарного шунтирования).

С *осторожностью* следует применять препарат у пациентов со сниженным почечным кровотоком или уменьшенным ОЦК, у пациентов пожилого возраста, пациентов с дегидратацией, застойной сердечной недостаточностью, циррозом печени, нефротическим синдромом или клинически выраженным заболеванием почек; на фоне лечения диуретиками, ингибиторами АПФ, антагонистами рецепторов ангиотензина II, при гиповолемии вследствие серьезного хирургического вмешательства, приводящие к гиповолемии; у пациентов с терминальной стадией почечной недостаточности, находящихся на гемодиализе.

Способ применения и дозы:

Ректальные суппозитории рекомендуется применять в дозе 7.5 мг 1 раз/сут. В более тяжелых случаях возможно назначение дозы 15 мг.

Т.к. риск возникновения побочных реакций зависит от величины дозы и длительности применения препарат следует принимать в течение как можно более короткого срока и в наименьшей эффективной дозе.

Максимальная суммарная суточная доза препарата Мовалис в виде суппозиториев, таблеток и инъекций составляет 15 мг.

У **пациентов с терминальной стадией почечной недостаточности, находящихся на гемодиализе,** доза препарата Мовалис не должна превышать 7.5 мг.

У **пациентов с небольшими или умеренными нарушениями функции почек (КК более 30 мл/мин)** снижение дозы не требуется.

Побочное действие:

Ниже описаны нежелательные явления, связь которых с применением препарата Мовалис, расценивалась как возможная. Нежелательные явления, связь которых с приемом препарата расценивалась как возможная, зарегистрированные при широком применении препарата, отмечены (*).

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, перфорация ЖКТ, гастродуоденальная язва, скрытое или явное желудочно-кишечное кровотечение, колит, гастрит*, эзофагит, стоматит, боли в животе, диспепсия, диарея, рвота, запор, метеоризм, отрыжка, гепатит*, изменения функции печени (повышение активности печеночных трансаминаз или билирубина). Желудочно-кишечное кровотечение, язва или перфорация ЖКТ могут приводить к летальному исходу.

Со стороны системы кроветворения: изменение лейкоцитарной формулы, лейкопения, тромбоцитопения, анемия. Предрасполагающим фактором для возникновения цитопении является одновременное применение потенциально миелотоксических лекарственных средств, в частности метотрексата.

Дерматологические реакции: фотосенсибилизация.

Со стороны дыхательной системы: бронхиальная астма (бронхоспазм) у пациентов с повышенной чувствительностью к ацетилсалициловой кислоте и другим НПВС.

Со стороны ЦНС: сонливость, головная боль, спутанность сознания*, дезориентация*, изменения настроения*.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: сердцебиение, отеки, повышение АД, чувство прилива крови к лицу.

Со стороны мочевыделительной системы: острая почечная недостаточность*, изменения показателей функции почек (повышение уровня креатинина и/или мочевины в крови). При применении НПВС возможно нарушение мочевыделения, включая острую задержку мочи*.

Со стороны органов чувств: головокружение, шум в ушах, конъюнктивит*, нарушения зрения, в т.ч. нечеткость зрения*.

Аллергические реакции: ангионевротический отек*, реакции гиперчувствительности немедленного типа (в т.ч. анафилактические* и анафилактоидные*), токсический эпидермальный некролиз*, синдром Стивенса-Джонсона*, многоформная эритема*, буллезный дерматит*, кожная сыпь, крапивница, зуд.

Передозировка:

Симптомы: усиление побочных эффектов.

Лечение: промывание желудка, проведение симптоматической терапии. Специфических антидотов и антагонистов нет.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Мовалис противопоказан во время беременности. Подавление синтеза простагландинов может оказывать нежелательное воздействие на беременность и развитие плода. Данные эпидемиологических исследований указывают на увеличение риска самопроизвольных абортов, пороков сердца и гастрошизиса у плода после применения ингибиторов синтеза простагландинов во время беременности. Абсолютный риск развития пороков сердца увеличивался с менее 1% до 1.5%. Такой риск повышается с увеличением дозы и продолжительности терапии.

В III триместре беременности применение ингибиторов синтеза простагландинов может привести к следующим нарушениям у плода:

— преждевременное закрытие артериального протока и легочная гипертензия вследствие токсического воздействия на сердечно-легочную систему;

— дисфункция почек, с дальнейшим развитием почечной недостаточности с уменьшением количества амниотической жидкости.

У матери во время родов может увеличиваться продолжительность кровотечения и снижаться сократительная способность матки, и как следствие, увеличиваться время родов. Антиагрегантный эффект может проявляться даже при применении низких доз.

Известно, что НПВС проникают в грудное молоко, поэтому Мовалис не рекомендуется применять в период грудного вскармливания.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Другие ингибиторы синтеза простагландинов, в т.ч. ГКС и салицилаты (ацетилсалициловая кислота): при одновременном применении увеличивается риск образования язв ЖКТ и желудочно-кишечных кровотечений вследствие синергизма действия. Совместное применение мелоксикама и других НПВС не рекомендуется. Совместное применение ацетилсалициловой кислоты (1 г 3 раза/сут) и мелоксикама у здоровых добровольцев приводило к увеличению AUC (10%) и C_{max} (24%) мелоксикама. Клиническое значение этого взаимодействия неизвестно.

Антикоагулянты для приема внутрь, антиагреганты, гепарин для системного применения, тромболитические средства, селективные ингибиторы обратного захвата серотонина при одновременном применении с Мовалисом повышают риск развития кровотечений. В случае невозможности избежать одновременного применения этих препаратов, необходимо тщательное наблюдение за эффектами антикоагулянтов.

НПВС повышают концентрацию лития в плазме за счет снижения почечной экскреции лития. Концентрация лития в плазме может достигать токсических значений. Совместное применение лития и НПВС не рекомендуется. В случае необходимости такой комбинированной терапии следует контролировать концентрацию лития в плазме в начале лечения, при подборе дозы и отмене мелоксикама.

НПВС могут уменьшать канальцевую секрецию метотрексата и таким образом увеличивать концентрацию метотрексата в плазме. В связи с этим больным, получающим высокие дозы метотрексата (более 15 мг в неделю), одновременное применение НПВС не рекомендуется. Риск взаимодействия при одновременном применении метотрексата и НПВС возможен также у пациентов, получающих низкие дозы метотрексата, особенно у пациентов с нарушениями функции почек. При необходимости комбинированной терапии следует контролировать формулу крови и функцию почек. Необходимо соблюдать осторожность в случае, если НПВС и метотрексат применяются одновременно в течение 3 дней, т.к. концентрация метотрексата в плазме может повышаться и, как следствие, могут возникать токсические эффекты. Одновременное применение мелоксикама не влияло на фармакокинетику метотрексата в дозе 15 мг в неделю, однако следует принимать во внимание, что гематологическая токсичность метотрексата усиливается при одновременном приеме НПВС.

Ранее сообщалось о снижении эффективности внутриматочных контрацептивных средств при применении НПВС. Это наблюдение требует дальнейшего подтверждения.

Применение НПВС повышает риск развития острой почечной недостаточности у пациентов с обезвоживанием. У пациентов, получающих Мовалис и диуретики, должна поддерживаться адекватная гидратация. До начала лечения необходимо исследование функции почек.

НПВС снижают эффект антигипертензивных средств (например, бета-адреноблокаторы, ингибиторы АПФ, вазодилататоры, диуретики), вследствие ингибирования простагландинов, обладающих вазодилатирующими свойствами.

Совместное применение НПВС и антагонистов рецепторов ангиотензина II (также как и ингибиторов АПФ) усиливает эффект снижения гломерулярной фильтрации. У пациентов с нарушением функции почек это может привести к развитию острой почечной недостаточности.

Колестирамин, связывая мелоксикам в ЖКТ, приводит к его более быстрому выведению.

НПВС, оказывая действие на почечные простагландины, могут усиливать нефротоксичность циклоспорина. В случае проведения комбинированной терапии следует контролировать функцию почек.

Мелоксикам выводится из организма преимущественно путем печеночного метаболизма, около 2/3 количества препарата, подвергающегося метаболизму в печени, разрушается изоферментами CYP450 (основной путь метаболизма - изофермент CYP2C9, дополнительный - изофермент CYP3A4), около 1/3 метаболизируется другими системами, например, путем перекисного окисления. При использовании совместно с мелоксикамом лекарственных препаратов, которые обладают известной способностью ингибировать CYP2C9 и/или CYP3A4 (или метаболизируются при участии этих ферментов), следует принимать во внимание возможность фармакокинетического взаимодействия.

При одновременном применении мелоксикама, циметидина, дигоксина или фуросемида значимого фармакокинетического взаимодействия выявлено не было.

Нельзя исключить возможность взаимодействия с пероральными гипогликемическими средствами.

Особые указания и меры предосторожности:

Следует соблюдать осторожность при лечении пациентов с заболеваниями ЖКТ в анамнезе и у пациентов,

получающих антикоагулянты. Пациенты, у которых отмечаются симптомы со стороны ЖКТ, должны регулярно наблюдаться. При возникновении язвенного поражения ЖКТ или желудочно-кишечного кровотечения Мовалис необходимо отменить.

Желудочно-кишечное кровотечение, язвы и перфорации, потенциально опасные для жизни пациента, могут возникать в ходе лечения в любое время, как при наличии симптомов или сведений о серьезных желудочно-кишечных осложнениях в анамнезе, так и при отсутствии этих признаков. Последствия данных осложнений в целом более серьезны у лиц пожилого возраста.

Во время применения НПВС очень редко сообщалось о развитии серьезных аллергических реакций (некоторые из которых с летальным исходом), в т.ч. эксфолиативного дерматита, синдрома Стивенса-Джонсона и токсического эпидермального некролиза. Наибольший риск развития этих реакций, по-видимому, отмечается в самом начале курса лечения, в большинстве случаев они начинались в течение первого месяца лечения. В случае появления первых признаков кожной сыпи, изменений слизистых оболочек или любых других симптомов гиперчувствительности Мовалис следует отменить.

При применении НПВС возможно повышение риска развития серьезных тромботических сердечно сосудистых заболеваний, инфаркта миокарда и инсульта, которые могут приводить к летальному исходу. Этот риск может повышаться по мере увеличения длительности применения НПВП. Наибольший риск отмечается у пациентов с сердечно-сосудистыми заболеваниями или при наличии факторов риска развития сердечно-сосудистых заболеваний, почечной недостаточности, у пациентов, находящихся на гемодиализе, доза препарата не должна превышать 7.5 мг.

В редких случаях НПВС могут вызвать интерстициальный нефрит, гломерулонефрит, медуллярный почечный некроз или нефротический синдром.

При использовании препарата Мовалис сообщалось об эпизодическом повышении уровня трансаминаз или других показателей функции печени в сыворотке крови. В большинстве случаев это повышение было небольшим и преходящим. Если выявленные изменения существенны или не уменьшаются со временем, Мовалис следует отменить и проводить наблюдение за выявленными лабораторными изменениями.

У пациентов с клинически стабильным циррозом печени снижение дозы препарата не требуется.

Ослабленные или истощенные пациенты могут хуже переносить нежелательные явления, поэтому таким пациентам требуется тщательное наблюдение. Необходима осторожность при лечении пациентов пожилого возраста, у которых выше вероятность нарушений функции почек, печени и сердца.

Применение НПВС совместно с диуретиками может приводить к задержке натрия, калия и воды, и оказывать влияние на натрийуретический эффект мочегонных средств. В результате этого у предрасположенных пациентов возможно усиление признаков сердечной недостаточности или артериальной гипертензии. Рекомендуется контролировать состояние пациентов, имеющих риск развития таких осложнений.

Мелоксикам, также как и другие НПВС, может маскировать симптомы инфекционного заболевания. Препарат предназначен для симптоматической терапии, уменьшения боли и воспаления. Для эффективного лечения Мовалис следует применять в комбинации с препаратами для лечения инфекционных заболеваний.

Суппозитории не следует применять у пациентов с какими-либо воспалительными процессами прямой кишки или заднего прохода, или у пациентов с недавно отмечавшимся кровотечением из прямой кишки или заднего прохода.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Специальных исследований в отношении влияния препарата на способность управлять автотранспортом и механизмами не проводилось. От этой деятельности следует воздерживаться пациентам с нарушениями зрения, пациентам, отмечающим сонливость или другие нарушения со стороны ЦНС.

При нарушениях функции почек

Препарат противопоказан при почечной недостаточности тяжелой степени (без проведения гемодиализа).

При нарушениях функции печени

Препарат противопоказан при тяжелой печеночной недостаточности.

Применение в пожилом возрасте

С *осторожностью* следует применять препарат у пациентов пожилого возраста.

Применение в детском возрасте

Противопоказание: детский и подростковый возраст до 12 лет (за исключением применения при установленном диагнозе - ювенильный ревматоидный артрит).

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 30°C.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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