Мовалис (таблетки)



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:

Таблетки от бледно-желтого до желтого цвета, круглые, одна сторона выпуклая со скошенным краем, на выпуклой стороне - логотип фирмы, на другой стороне - код и вогнутая риска; допускается шероховатость таблеток.

	1 таб.
мелоксикам	7.5 мг

Вспомогательные вещества: натрия цитрата дигидрат - 15 мг, лактозы моногидрат - 23.5 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 102 мг, повидон K25 - 10.5 мг, кремния диоксид коллоидный - 3.5 мг, кросповидон - 16.3 мг, магния стеарат - 1.7 мг.

10 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Таблетки от бледно-желтого до желтого цвета, круглые, одна сторона выпуклая со скошенным краем, на выпуклой стороне - логотип фирмы, на другой стороне - код и вогнутая риска; допускается шероховатость таблеток.

	1 таб.
мелоксикам	15 мг

Вспомогательные вещества: натрия цитрата дигидрат - 30 мг, лактозы моногидрат - 20 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 87.3 мг, повидон K25 - 9 мг, кремния диоксид коллоидный - 3 мг, кросповидон - 14 мг, магния стеарат - 1.7 мг.

10 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Ненаркотические анальгетики, включая нестероидные и другие противовоспалительные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Нестероидный противовоспалительный препарат (НПВП), относится к производным эноловой кислоты и оказывает противовоспалительное, анальгетическое и антипиретическое действие. Выраженное противовоспалительное действие мелоксикама установлено на всех стандартных моделях воспаления.

Механизм действия мелоксикама состоит в его способности ингибировать синтез простагландинов - известных медиаторов воспаления.

Мелоксикам in vivo 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 НПВП, 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 in vivo. Селективная способность мелоксикама ингибировать ЦОГ-2 показана при использовании в качестве тест-системы цельной крови человека in vitro. 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. В исследованиях ex vivo показано, что мелоксикам (в дозах 7.5 мг и 15 мг) не оказывал влияния на агрегацию тромбоцитов и 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 НПВП, 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

Мелоксикам хорошо всасывается из ЖКТ, о чем свидетельствует высокая абсолютная биодоступность (90%) после приема внутрь. После однократного применения мелоксикама C_{max} в плазме достигается в течение 5-6 ч. Одновременный прием пищи и неорганических антацидов не изменяет всасывание. При использовании препарата внутрь (в дозах 7.5 и 15 мг) его концентрации пропорциональны дозам. Устойчивое состояние фармакокинетики достигается в пределах 3-5 дней. Диапазон различий между C_{max} и C_{min} препарата после его приема 1 раз/сут относительно невелик и составляет 0.4-1.0 мкг/мл при использовании дозы 7.5 мг, а при использовании дозы 15 мг - 0.8-2.0 мкг/мл (приведены, соответственно, значения C_{min} и C_{max} в период устойчивого состояния фармакокинетики), хотя отмечались и значения, выходящие за указанный диапазон. C_{max} в плазме в период устойчивого состояния фармакокинетики достигается в течение 5-6 ч после приема внутрь.

Распределение

Мелоксикам очень 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 после многократного приема внутрь мелоксикама (в дозах от 7.5 мг до 15 мг) составляет около 16 л, с коэффициентом вариации от 11 до 32%.

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 через кишечник и почками, 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 $T_{1/2}$ мелоксикама варьирует от 13 до 25 ч. Плазменный клиренс составляет в среднем 7-12 мл/мин после однократного приема мелоксикама.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Недостаточность функции печени, а также слабо выраженная почечная недостаточность существенного влияния на фармакокинетику мелоксикама не оказывает. Скорость выведения мелоксикама из организма значительно выше у пациентов с умеренно выраженной почечной недостаточностью. Мелоксикам хуже связывается с белками плазмы у пациентов с терминальной почечной недостаточностью. 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.

Пожилые пациенты по сравнению с молодыми пациентами имеют сходные фармакокинетические показатели. У пожилых пациентов средний плазменный клиренс в период равновесного состояния фармакокинетики немного ниже, чем у молодых пациентов. У женщин пожилого возраста более высокие значения AUC и более длинный $T_{1/2}$, по сравнению с молодыми пациентами обоих полов.

Показания к применению:

Симптоматическое лечение:

— остеоартроз (артроз, дегенеративные заболевания суставов), в т.ч. с болевым компонентом;

— ревматоидный артрит;

— анкилозирующий спондилит.

Относится к болезням:

- Артрит
- Артроз
- Остеоартрит
- Остеоартроз
- Ревматоидный артрит

Противопоказания:

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

— эрозивно-язвенные поражения желудка и двенадцатиперстной кишки в стадии обострения или недавно перенесенные;

— воспалительные заболевания кишечника - болезнь Крона или язвенный колит в стадии обострения;

— тяжелая печеночная недостаточность;

— тяжелая почечная недостаточность (если не проводится гемодиализ, КК менее 30 мл/мин, а также при подтвержденной гиперкалиемии), прогрессирующее заболевание почек;

— активное желудочно-кишечное кровотечение, недавно перенесенное цереброваскулярное кровотечение или установленный диагноз заболеваний свертывающей системы крови;

— выраженная неконтролируемая сердечная недостаточность;

— терапия периоперационных болей при проведении шунтирования коронарных артерий;

— беременность;

— лактация (грудное вскармливание);

— детский возраст до 12 лет;

— редкая наследственная непереносимость галактозы (в максимальной суточной дозе препарата с дозой мелоксикама 7.5 мг и 15 мг содержится 47 мг и 20 мг лактозы соответственно);

— гиперчувствительность к активному ингредиенту или вспомогательным компонентам препарата (существует вероятность перекрестной чувствительности к ацетилсалициловой кислоте и другим НПВП).

С *осторожностью:*

— заболевания ЖКТ в анамнезе (язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, заболевания печени);

— застойная сердечная недостаточность;

— почечная недостаточность (КК 30-60 мл/мин);

— ИБС;

— цереброваскулярные заболевания;

— дислипидемия/гиперлипидемия;

— сахарный диабет;

— сопутствующая терапия следующими препаратами: пероральные ГКС, антикоагулянты (в т.ч. варфарин), антиагреганты, селективные ингибиторы обратного захвата серотонина (в т.ч. циталопрам, флуоксетин, пароксетин, сертралин);

— заболевания периферических артерий;

— пожилой возраст;

— длительное использование НПВП;

— курение;

— частое употребление алкоголя.

Способ применения и дозы:

При *остеоартрите* суточная доза составляет 7.5 мг, при необходимости эта доза может быть увеличена до 15 мг/сут.

При *ревматоидном артрите* препарат назначают в дозе 15 мг/сут, в зависимости от лечебного эффекта эта доза может быть снижена до 7.5 мг/сут.

При *анкилозирующем спондилите* препарат назначают в дозе 15 мг/сут, в зависимости от лечебного эффекта эта доза может быть снижена до 7.5 мг/сут.

У **пациентов с повышенным риском побочных реакций** рекомендуется начинать лечение с дозы 7.5 мг.

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

Так как потенциальный риск побочных реакций зависит от величины дозы и продолжительности лечения следует использовать максимально возможные низкие дозы и длительность применения.

Максимальная рекомендуемая суточная доза - 15 мг.

Максимальная доза у **подростков** составляет 0.25 мг/кг.

Как правило, препарат должен применяться только у подростков старше 12 лет и взрослых. Общую суточную дозу следует принимать в 1 прием, во время еды, запивая водой или другой жидкостью.

Комбинированное применение

Не следует применять препарат одновременно с другими НПВП. Суммарная суточная доза препарата Мовалис, применяемого в виде разных лекарственных форм не должна превышать 15 мг.

Побочное действие:

Ниже описаны побочные эффекты, связь которых с применением препарата Мовалис, расценивалась как возможная.

Внутри системно-органных классов по частоте возникновения побочных эффектов используются следующие категории: очень часто (≥1/10); часто (≥1/100, <1/10); нечасто (≥1/1000, <1/100); редко (≥1/10 000, <1/1000); очень редко (<1/10 000); не установлено.

Со стороны системы кроветворения: нечасто - анемия; редко - изменение числа клеток крови, включая изменения лейкоцитарной формулы, лейкопения, тромбоцитопения.

Со стороны иммунной системы: частота не установлена - анафилактический шок, анафилактоидные/анафилактические реакции; нечасто - другие реакции гиперчувствительности немедленного типа.

Со стороны нервной системы: часто - головная боль; нечасто - головокружение, сонливость.

Со стороны психики: часто - изменения настроения; частота не установлена - спутанность сознания, дезориентация.

Со стороны органов чувств: нечасто - вертиго; редко - конъюнктивит, нарушения зрения, включая нечеткость зрения, шум в ушах.

Со стороны пищеварительной системы: часто - боль в животе, диспепсия, диарея, тошнота, рвота; нечасто - скрытое или явное желудочно-кишечное кровотечение, гастрит, стоматит, запор, вздутие живота, отрыжка, транзиторные изменения показателей функции печени (например, повышение активности трансаминаз или билирубина); редко - гастродуоденальные язвы, колит, эзофагит; очень редко - перфорация ЖКТ, гепатит.

Со стороны кожи и подкожных тканей: нечасто - ангионевротический отек, зуд, кожная сыпь; редко - токсический эпидермальный некролиз, синдром Стивенса-Джонсона, крапивница; очень редко - буллезный дерматит, многоформная эритема; частота не установлена - фотосенсибилизация.

Со стороны дыхательной системы: редко - бронхиальная астма (у пациентов с аллергией к ацетилсалициловой кислоте или другим НПВП).

Со стороны сердечно-сосудистой системы: нечасто - повышение АД, чувство "прилива" крови к лицу; редко - сердцебиение.

Со стороны мочевыделительной системы: нечасто - изменения показателей функции почек (повышение уровня креатинина и/или мочевины в сыворотке крови), нарушения мочеиспускания, включая острую задержку мочи; очень редко - острая почечная недостаточность.

Совместное применение с лекарственными средствами, угнетающими костный мозг (например, метотрексат) может спровоцировать цитопению.

Желудочно-кишечное кровотечение, язва или перфорация могут приводить к летальному исходу.

Как и для других НПВП не исключена возможность появления интерстициального нефрита, гломерулонефрита, почечного медуллярного некроза, нефротического синдрома.

Передозировка:

Данных о случаях, связанных с передозировкой препарата накоплено недостаточно. Вероятно, будут присутствовать *симптомы*, свойственные передозировке НПВП, в тяжелых случаях: сонливость, нарушения сознания, тошнота, рвота, боли в эпигастрии, желудочно-кишечное кровотечение, острая почечная недостаточность, изменения АД, остановка дыхания, асистолия.

Лечение: антидот не известен, в случае передозировки препарата следует провести эвакуацию содержимого желудка и общую поддерживающую терапию. Колестирамин ускоряет выведение мелоксикама.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение препарата Мовалис противопоказано при беременности.

Известно, что НПВП проникают в грудное молоко, поэтому применение препарата Мовалис в период кормления грудью противопоказано.

Как препарат, ингибирующий синтез циклооксигеназы/простагландина, Мовалис может оказывать влияние на фертильность, и поэтому не рекомендуется женщинам, планирующим беременность. Мелоксикам может приводить к задержке овуляции. В связи с этим у женщин, имеющих проблемы с зачатием и проходящим обследование по поводу подобных проблем, рекомендуется отмена приема препарата Мовалис.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с мелоксикамом других ингибиторов синтеза простагландинов, в т.ч. ГКС и салицилатов (ацетилсалициловая кислота), увеличивается риск образования язв ЖКТ и желудочно-кишечных кровотечений вследствие синергизма действия. Совместное применение мелоксикама и других НПВП не

рекомендуется.

Антикоагулянты для приема внутрь, гепарин для системного применения, тромболитические средства при одновременном применении с мелоксикамом повышают риск развития кровотечения. В случае одновременного применения необходим тщательный контроль за свертывающей системой крови.

Антитромбоцитарные препараты, ингибиторы обратного захвата серотонина при одновременном применении с мелоксикамом повышают риск развития кровотечения. В случае одновременного применения необходим тщательный контроль свертывающей системой крови.

НПВП повышают уровень лития в плазме, посредством уменьшения выведения его почками. Одновременное применение мелоксикама с препаратами лития не рекомендуется. В случае необходимости одновременного применения рекомендуется тщательный контроль концентрации лития в плазме в течение всего курса применения препаратов лития.

НПВП могут уменьшать канальцевую секрецию метотрексата, тем самым, повышая его концентрацию в плазме. Одновременное применение мелоксикама и метотрексата (в дозе более 15 мг в неделю) не рекомендуется. В случае одновременного применения необходим тщательный контроль функции почек и формулой крови. Мелоксикам может усиливать гематологическую токсичность метотрексата, особенно у пациентов с нарушением функции почек. При совместном применении мелоксикама и метотрексата в течении 3 дней возрастает риск повышения токсичности последнего.

Есть данные, что НПВП могут снижать эффективность внутриматочных контрацептивных устройств, однако это не доказано.

Применение НПВП на фоне приема диуретиков в случае обезвоживания пациентов сопровождается риском развития острой почечной недостаточности.

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

Совместное применение НПВП и антагонистов рецепторов ангиотензина II усиливает эффект снижения клубочковой 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.

НПВП, оказывая действие на почечные простагландины, могут усиливать нефротоксичность циклоспорина.

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.

Нельзя исключить возможность взаимодействия с гипогликемическими препаратами для приема внутрь.

При одновременном применении антацидов, циметидина, дигоксина и фуросемида, значимого фармакокинетического взаимодействия выявлено не было.

Особые указания и меры предосторожности:

Пациенты с заболеваниями ЖКТ должны регулярно наблюдаться. При возникновении язвенного поражения ЖКТ или желудочно-кишечного кровотечения Мовалис необходимо отменить.

Желудочно-кишечное кровотечение, язвы и перфорации могут возникать в ходе лечения в любое время как при наличии настораживающих 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.

При применении НПВП могут развиваться такие серьезные реакции со стороны кожи, как эксфолиативный дерматит, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз. Поэтому следует уделять особое внимание пациентам, сообщающим о развитии нежелательных явлений со стороны кожи и слизистых оболочек, а также реакций повышенной чувствительности к препарату, особенно, если подобные реакции наблюдались в течение предыдущих курсов лечения. Развитие подобных реакций наблюдается, как правило, в течение первого месяца лечения. В случае появления первых признаков кожной сыпи, изменения слизистых оболочек или других признаков гиперчувствительности должен рассматриваться вопрос о прекращении применения препарата Мовалис.

Описаны случаи при приеме НПВП повышения риска развития серьезных сердечно-сосудистых тромбозов, инфаркта миокарда, приступа стенокардии, возможно со смертельным исходом. Такой риск повышается при длительном применении препарата, а также у пациентов с выше указанными заболеваниями в анамнезе и предрасположенных к таким заболеваниям.

НПВП ингибируют в почках синтез простагландинов, которые участвуют в поддержании почечной перфузии.

Применение НПВП у пациентов со сниженным почечным кровотоком или уменьшенным ОЦК может привести к декомпенсации скрыто протекающей почечной недостаточности. После отмены НПВП функция почек обычно восстанавливается до исходного уровня. В наибольшей степени риску развития этой реакции подвержены пожилые пациенты, пациенты, у которых отмечается дегидратация, застойная сердечная недостаточность, цирроз печени, нефротический синдром или острые нарушения функции почек, пациенты, одновременно принимающие диуретические средства, ингибиторы АПФ, антагонисты рецепторов ангиотензина II, а также пациенты, перенесшие серьезные хирургические вмешательства, которые ведут к гиповолемии. У таких пациентов в начале терапии следует тщательно контролировать диурез и функцию почек.

Применение НПВП совместно с диуретиками может приводить к задержке натрия, калия и воды, а также к снижению натрийуретического действия мочегонных средств. В результате этого у предрасположенных пациентов возможно усиление признаков сердечной недостаточности или гипертензии. Поэтому необходим тщательный контроль состояния таких пациентов, а также у них должна поддерживаться адекватная гидратация. До начала лечения необходимо исследование функции почек.

В случае проведения комбинированной терапии следует также контролировать функцию почек.

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.

Ослабленные или истощенные пациенты могут хуже переносить нежелательные явления, поэтому таким пациентам требуется тщательное наблюдение.

Мелоксикам, также как и другие НПВП, может маскировать симптомы инфекционного заболевания.

Как препарат, ингибирующий синтез циклооксигеназы/простагландина, Мовалис может оказывать влияние на фертильность, и поэтому не рекомендуется женщинам, имеющим трудности с зачатием. В связи с этим у женщин, проходящих обследование по этому поводу, рекомендуется отмена приема препарата Мовалис.

У пациентов со слабой или умеренной почечной недостаточностью (КК более 25 мл/мин) коррекции дозы не требуется.

У пациентов с циррозом печени (компенсированным) коррекции дозы не требуется.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Специальных клинических исследований влияния препарата на способность управлять автомобилем и механизмами не проводилось. Однако при управлении автомобилем и работе с механизмами следует принимать во внимание возможность развития головокружения, сонливости, нарушения зрения или других нарушений со стороны ЦНС. Пациентам следует соблюдать осторожность при вождении автомобиля и управлении механизмами.

При нарушениях функции почек

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

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 25 мл/мин)** снижение дозы не требуется.

При нарушениях функции печени

Препарат противопоказан при тяжелой печеночной недостаточности.

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

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью следует назначать препарат пациентам пожилого возраста.

Применение в детском возрасте

Противопоказан детям до 12 лет

Условия хранения:

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

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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