Мовасин



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 круглые, плоскоцилиндрические, с фаской, без риски, светло-желтого цвета, на поверхности допускается незначительная мраморность.

	1 таб.
мелоксикам	7.5 мг

Вспомогательные вещества: повидон 12600 - 6 мг, лактозы моногидрат - 52.5 мг, кросповидон (коллидон CL-M) - 4.5 мг, крахмал картофельный - 1.25 мг, тальк - 4.5 мг, магния стеарат - 1.5 мг, целлюлоза микрокристаллическая - до 150 мг.

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

Таблетки круглые, плоскоцилиндрические, с фаской, с риской, светло-желтого цвета, на поверхности допускается незначительная мраморность.

	1 таб.
мелоксикам	15 мг

Вспомогательные вещества: повидон 12600 - 12 мг, лактозы моногидрат - 105 мг, кросповидон (коллидон CL-M) - 9 мг, крахмал картофельный - 2.5 мг, тальк - 9 мг, магния стеарат - 3 мг, целлюлоза микрокристаллическая - до 300 мг.

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

Раствор для в/м введения желтого с зеленоватым оттенком цвета, прозрачный или слегка опалесцирующий.

	1 мл	**1 амп.**
мелоксикам	10 мг	15 мг

Вспомогательные вещества: гликофурфурол - 100 мг, глицин - 5 мг, меглюмин - 6.25 мг, натрия гидроксид - 0.152 мг, натрия хлорид - 3 мг, полоксамер 188 - 50 мг, вода д/и - до 1 мл.

1.5 мл - ампулы стеклянные (3) - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
1.5 мл - ампулы стеклянные (5) - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Ненаркотические анальгетики, включая нестероидные и другие противовоспалительные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

НПВП. Оказывает анальгезирующее, противовоспалительное и жаропонижающее действие. Механизм действия связан с ингибированием синтеза простагландинов в результате избирательного подавления ферментативной активности циклооксигеназы-2 (ЦОГ-2), участвующей в биосинтезе простагландинов в области воспаления. При назначении в высоких дозах, длительном применении и индивидуальных особенностях организма селективность в отношении ЦОГ-2 снижается. Подавляет синтез простагландинов в области воспаления в большей степени, чем в слизистой оболочке желудка или почках, что связано с относительно избирательным ингибированием ЦОГ-2. Реже вызывает эрозивно-язвенные заболевания ЖКТ. В меньшей степени мелоксикам действует на циклооксигеназу-1 (ЦОГ-1), участвующую в синтезе простагландинов, защищающих слизистую оболочку ЖКТ и принимающих участие в регуляции кровотока в почках.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема препарата внутрь мелоксикам хорошо всасывается из ЖКТ, абсолютная биодоступность составляет 89%. Одновременный прием с пищей не изменяет всасывание. Величина концентрации мелоксикама при приеме препарата внутрь в дозах 7.5 и 15 мг пропорциональна дозе.

После в/м введения относительная биодоступность составляет почти 100%. После в/м введения препарата в дозе 5 мг C_{max} составляет 1.62 мкг/мл и достигается в течение приблизительно 60 мин.

Мелоксикам демонстрирует линейную фармакокинетику в дозах 7.5-15 мг при в/м введении.

Распределение

C_{ss} достигаются в течение 3-5 дней регулярного приема. При длительном применении препарата (более 1 года) концентрации сходны с таковыми, которые отмечаются после первого достижения устойчивого состояния фармакокинетики. Связывание с белками плазмы (особенно альбумином) составляет более 99%.

Диапазон различий между максимальными и базальными концентрациями препарата после его приема 1 раз/сут относительно невелик и составляет при использовании дозы 7.5 мг 0.4-1 мкг/мл, а при использовании дозы 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 11 л. Межиндивидуальные различия составляют 30-40%.

Метаболизм

Мелоксикам почти полностью метаболизируется в печени с образованием четырех фармакологически неактивных метаболитов. 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 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 после приема внутрь составляет 15-20 ч, при в/м введении - 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 тяжести существенного влияния на фармакокинетику мелоксикама не оказывают.

Показания к применению:

Симптоматическая терапия:

— остеоартроза;

— ревматоидного артрита;

— анкилозирующего спондилита (болезнь Бехтерева).

Относится к болезням:

- Артрит
- Артроз
- Остеоартрит
- Остеоартроз

Противопоказания:

— состояние после проведения аортокоронарного шунтирования;

— декомпенсированная сердечная недостаточность;

— полное или неполное сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза слизистой оболочки 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 (язвенный колит, болезнь Крона);

— цереброваскулярное кровотечение или иные кровотечения;

— выраженная печеночная недостаточность или активное заболевание печени;

— хроническая почечная недостаточность у больных, не подвергающихся диализу (КК менее 30 мл/мин), прогрессирующие заболевания почек (в т.ч. подтвержденная гиперкалиемия);

— детский возраст до 12 лет (для таблеток);

— детский возраст до 18 лет (для раствора для в/м введения);

— беременность;

— лактация (грудное вскармливание);

— повышенная чувствительность к мелоксикаму и другим компонентам препарата.

В состав препарата в форме таблеток входит лактоза, поэтому пациенты с редкими наследственными заболеваниями, такими как непереносимость галактозы, дефицит лактазы или глюкозо-галактозная мальабсорбция, не должны принимать препарат.

С *осторожностью*

— ИБС;

— цереброваскулярные заболевания;

— компенсированная сердечная недостаточность;

— дислипидемия/гиперлипидемия;

— сахарный диабет;

— заболевания периферических артерий;

— курение;

— КК 30-60 мл/мин;

— анамнестические данные о развитии язвенного поражения ЖКТ;

— наличие инфекции Helicobacter pylori;

— пожилой возраст;

— длительное использование НПВП;

— частое употребление алкоголя;

— тяжелые соматические заболевания;

— сопутствующая терапия следующими препаратами: антикоагулянты (например, варфарин); антиагреганты (например, ацетилсалициловая кислота, клопидогрел); пероральные ГКС (например, преднизолон); селективные ингибиторы обратного захвата серотонина (например, циталопрам, флуоксетин, пароксетин, сертралин).

Для снижения риска развития нежелательных явлений со стороны ЖКТ следует использовать минимальную эффективную дозу минимально возможным коротким курсом.

Способ применения и дозы:

Таблетки

Препарат принимают внутрь, во время приема пищи, в суточной дозе 7.5-15 мг, 1 раз/сут.

При *ревматоидном артрите* рекомендуемая доза составляет 15 мг/сут; в зависимости от терапевтического эффекта доза может быть снижена до 7.5 мг/сут.

При *остеоартрозе* препарат назначают в дозе 7.5 мг/сут, при отсутствии эффекта дозу можно повысить до 15 мг/сут.

При *анкилозирующем спондилоартрите* суточная доза составляет 15 мг.

Максимальная суточная доза препарата Мовасин не должна превышать 15 мг.

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

Раствор для в/м введения

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 вводят глубоко в/м. В/в введение препарата запрещено!

У пациентов с повышенным риском побочных реакций суточная доза не должна превышать 7.5 мг.

При в/м введении у **пациентов с терминальной стадией почечной недостаточности, находящихся на гемодиализе, и у пациентов с небольшими или умеренными нарушениями функции почек (КК более 30 мл/мин)** доза препарата не должна превышать 7.5 мг.

Режим дозирования препарата для в/м инъекций у **детей и подростков** не определен, данная лекарственная форма может применяться только у взрослых пациентов. Максимальная рекомендуемая суточная доза - 15 мг.

При комбинированном применении различных лекарственных форм препарата его максимальная суточная доза в таблетках, суппозиториях и в виде раствора для инъекций составляет 15 мг.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: >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; <0.1% - перфорация ЖКТ, колит, гепатит, гастрит.

Со стороны органов кроветворения: >1% - анемия; 0.1-1% - изменение формулы крови, в т.ч. лейкопения, тромбоцитопения.

Со стороны кожных покровов: >1% - зуд, кожная сыпь; 0.1-1% - крапивница; <0.1% - фотосенсибилизация, буллезные

высыпания, многоформная эритема, в т.ч. синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз.

Со стороны дыхательной системы: <0.1% - бронхоспазм.

Со стороны нервной системы: >1% - головокружение, головная боль; 0.1-1% - вертиго, шум в ушах, сонливость; <0.1% - спутанность сознания, дезориентация, эмоциональная лабильность.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: >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; <0.1% - острая почечная недостаточность; связь с приемом мелоксикама не установлена - интерстициальный нефрит, альбуминурия, гематурия.

Со стороны органов чувств: <0.1% - конъюнктивит, нарушение зрения, в т.ч. нечеткость зрения.

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

Местные реакции: >1% - отечность в месте введения; <0.1% - болезненные ощущения в месте введения

Передозировка:

Симптомы: нарушение сознания, тошнота, рвота, боли в эпигастрии, кровотечение из ЖКТ, острая почечная недостаточность, печеночная недостаточность, остановка дыхания, асистолия.

Лечение: при приеме препарата внутрь - промывание желудка, прием активированного угля (в течение ближайшего часа); при необходимости проводят симптоматическую терапию. Форсированный диурез, защелачивание мочи, гемодиализ малоэффективны из-за высокой степени связывания мелоксикама с белками крови. Специфического антидота нет.

Применение при беременности и кормлении грудью:

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

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

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с другими НПВС (в т.ч. с ацетилсалициловой кислотой) увеличивается риск возникновения эрозивно-язвенных поражений и кровотечений 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 повышается вероятность развития токсических эффектов на кроветворение и возникновения анемии и лейкопении (показано периодическое проведение 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 (в т.ч. с гепарином, тиклопидином, варфарином), а также с тромболитическими препаратами (в т.ч. со стрептокиназой, фибринолизином) увеличивается риск развития кровотечений (необходим периодический контроль показателей свертываемости крови).

При одновременном применении с колестирамином увеличивается выведение мелоксикама через ЖКТ (за счет связывания).

При одновременном применении с селективными ингибиторами обратного захвата серотонина возрастает риск развития кровотечения из ЖКТ.

Особые указания и меры предосторожности:

Следует соблюдать осторожность при применении препарата у пациентов, имеющих в анамнезе язвенную болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, и у пациентов, получающих терапию антикоагулянтами, т.к. у данной категории больных повышен риск развития эрозивно-язвенных поражений 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 незначительным или умеренным снижением функции почек (КК более 30 мл/мин) не требуется коррекция режима дозирования.

Пациенты, принимающие одновременно мочегонные средства и мелоксикам, должны принимать достаточное количество жидкости.

При появлении аллергических реакций (зуд, кожная сыпь, крапивница, фотосенсибилизация) следует 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 и головокружений, сонливости, поэтому в период приема препарата следует отказаться от управления транспортными средствами и обслуживания машин и механизмов, требующих концентрации внимания.

При нарушениях функции почек

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

У **пациентов с нарушениями функции почек (КК более 25 мл/мин)** при приеме препарата в форме таблеток коррекции режима дозирования не требуется.

У **пациентов с небольшими или умеренными нарушениями функции почек (КК более 30 мл/мин)** доза препарата для в/м введения не должна превышать 7.5 мг.

Препарат противопоказан при тяжелой почечной недостаточности (если не проводится гемодиализ).

При нарушениях функции печени

Препарат противопоказан при тяжелой печеночной недостаточности.

Применение в пожилом возрасте

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

Применение в детском возрасте

Препарат противопоказан к применению: в детском возрасте до 12 лет (для таблеток); в детском возрасте до 18 лет (для раствора для в/м введения).

Условия хранения:

Список Б. Препарат в форме таблеток следует хранить в сухом, защищенном от света и недоступном для детей месте при температуре не выше 25°С. Срок годности – 3 года.

Препарат в форме раствора для в/м введения следует хранить в сухом, защищенном от света и недоступном для детей месте при температуре не выше 30°С. Срок годности – 3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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