Оксикамокс



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 светло-желтого до светло-желтого со слабым зеленоватым оттенком цвета, круглые, плоские, с риской на одной стороне и фаской.

	1 таб.
мелоксикам	7.5 мг

Вспомогательные вещества: крахмал кукурузный - 22 мг, крахмал прежелатинизированный - 9.5 мг, кремния диоксид коллоидный безводный - 0.8 мг, натрия цитрата дигидрат - 10 мг, лактозы моногидрат - 43 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 66.4 мг, магния стеарат - 0.8 мг.

10 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (5) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (10) - пачки картонные.

Таблетки от светло-желтого до светло-желтого со слабым зеленоватым оттенком цвета, круглые, плоские, с риской на одной стороне и фаской.

	1 таб.
мелоксикам	15 мг

Вспомогательные вещества: крахмал кукурузный - 44 мг, крахмал прежелатинизированный - 19 мг, кремния диоксид безводный - 1.6 мг, натрия цитрата дигидрат - 20 мг, лактозы моногидрат - 86 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 132.8 мг, магния стеарат - 1.6 мг.

10 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (5) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (10) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Ненаркотические анальгетики, включая нестероидные и другие противовоспалительные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

НПВП, обладающий анальгезирующим, противовоспалительным и жаропонижающим действием. Механизм выраженного противовоспалительного действия мелоксикама связан с избирательным подавлением фермента ЦОГ-2, который участвует в биосинтезе простагландинов в области воспаления.

Ex vivo установлено, что мелоксикам (в дозах 7.5 мг и 15 мг) активнее ингибировал ЦОГ-2, оказывая большее ингибирующее влияние на продукцию простагландина Е2 (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. При назначении в высоких дозах, длительном применении и индивидуальных особенностях ЦОГ-2 селективность 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 поражения ЖКТ. В меньшей степени мелоксикам действует на ЦОГ-1, участвующую в синтезе простагландинов, защищающих слизистую оболочку ЖКТ и принимающих участие в регуляции кровотока в почках.

Фармакокинетика

Всасывание

Мелоксикам хорошо всасывается из ЖКТ, при приеме внутрь биодоступность 89%, прием пищи не влияет на абсорбцию. Равновесная концентрация в плазме достигается через 3-5 сут от начала приема препарата. При приеме внутрь C_{max} в плазме достигается через 5-6 ч. Не кумулирует.

Распределение

Связывание с беками плазмы составляет более 99%. Диапазон различий между максимальными и базальными концентрациями мелоксикама при приеме 1 раз/сут относительно невелик и находится в пределах 0.4-1 мкг/мл для дозы 7.5 мг и 0.8-2 мкг/мл для дозы 15 мг (приведены, соответственно, значения C_{min} и C_{max}). Мелоксикам проникает через гистогематические барьеры, концентрация в синовиальной жидкости достигает 50% от C_{max} препарата в плазме.

Метаболизм

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'-гидроксикарбоксимелоксикама, 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 через кишечник и почки в равных пропорциях, преимущественно в виде метаболитов. 5% суточной дозы выводится в неизмененном виде через кишечник, в моче в неизмененном виде препарат обнаруживается только в следовых количествах. $T_{1/2}$ мелоксикама 15-20 ч.

Плазменный клиренс в среднем составляет 8 мл/мин (снижается в пожилом возрасте). V_d низкий, и составляет в среднем 11 л.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Печеночная и почечная недостаточность легкой и средней степени тяжести существенно не влияют на фармакокинетические параметры мелоксикама. При тяжелой степени почечной недостаточности из-за снижения выведения препарата суточная доза не должна превышать 7.5 мг.

Показания к применению:

Симптоматическая терапия следующих заболеваний:

— остеоартроза;

— острого и хронического ревматоидного артрита;

— анкилозирующего спондилита;

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

Относится к болезням:

- Артрит
- Артроз
- Болевой синдром
- Остеоартрит
- Остеоартроз
- Подагра

Противопоказания:

— непереносимость лактозы, дефицит лактазы или глюкозо-галактозная мальабсорбция;

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

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

— желудочно-кишечные, цереброваскулярные и другие кровотечения, в т.ч. в анамнезе (или подозрение на кровотечение);

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

— 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;

— состояние после проведения аортокоронарного шунтирования;

— декомпенсированная сердечная недостаточность;

— беременность;

— период грудного вскармливания;

— детский возраст (до 15 лет);

— повышенная чувствительность к мелоксикаму или любому другому компоненту препарата и другим НПВП.

С *осторожностью:* ИБС, цереброваскулярные заболевания, застойная сердечная недостаточность, дислипидемия/гиперлипидемия, сахарный диабет, заболевания периферических артерий, курение, хроническая почечная недостаточность с 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: антикоагулянтами (например, варфарин), антиагрегантами (ацетилсалициловая кислота, клопидогрел), пероральными ГКС (например, преднизолон), селективными ингибиторами обратного захвата серотонина (например, циталопрам, флуоксетин, пароксетин, сертралин).

Для снижения риска развития нежелательных явлений следует использовать минимальную эффективную дозу максимально возможным коротким курсом.

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь во время еды в суточной дозе 7.5-15 мг. Препарат следует принимать во время или после еды, запивая водой или молоком (объем жидкости не менее 100 мл). Рекомендуемая суточная доза 7.5 мг; максимальная -15 мг. У пожилых пациентов и у пациентов с тяжелой почечной недостаточностью, находящихся на гемодиализе, суточная доза не должна превышать 7.5 мг. При умеренной почечной недостаточности (КК более 25 мл/мин), а также при умеренной печеночной недостаточности, коррекция дозы не требуется.

Побочное действие:

Частота возникновения побочных эффектов характеризуется как часто (≥1/10), нечасто (≥1/1000, <1/10), редко (≥1/1000).

Со стороны пищеварительной системы: часто - диспепсия, тошнота, рвота, абдоминальные боли, запор, метеоризм, диарея; нечасто - желудочно-кишечные кровотечения (в т.ч. скрытые), пептические язвы, гастродуоденальная язва, эзофагит, стоматит, преходящее повышение активности печеночных трансаминаз, гипербилирубинемия, отрыжка; редко - перфорация ЖКТ, гастрит, колит, гепатит.

Со стороны ЦНС: часто - головокружение, головная боль; нечасто - шум в ушах, сонливость; редко - спутанность сознания, дезориентация, бессонница, эмоциональная лабильность.

Со стороны органов кроветворения: часто – анемия; нечасто - изменение формулы крови, лейкоцитопения, тромбоцитопения; редко - агранулоцитоз.

Аллергические реакции: редко - ангионевротический отек, анафилактоидные/анафилактические реакции.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - периферические отеки; нечасто - повышение АД, ощущение сердцебиения, "приливы" крови к коже лица.

Со стороны дыхательной системы: редко - бронхоспазм.

Со стороны кожных покровов: часто - зуд, кожная сыпь; нечасто – крапивница; редко - буллезные высыпания, в т.ч. синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз, многоформная эритема, фотосенсибилизация.

Со стороны органов чувств: редко - конъюнктивит, нарушения зрения, в т.ч. нечеткость зрения.

Со стороны мочевыделителъной системы: нечасто - гиперкреатининемия и/или повышение мочевины в сыворотке крови, задержка натрия и воды, гиперкалиемия; редко - острая почечная недостаточность у пациентов с повышенным риском; связь с приемом мелоксикама не установлена - интерстициальный нефрит, альбуминурия, гематурия.

Передозировка:

Симптомы: головокружение, тошнота, рвота, боли в области эпигастрия. Возможно кровотечение из желудочно-кишечного тракта, острая почечная недостаточность, острая печеночная недостаточность, остановка дыхания, асистолия.

Лечение: промывание желудка не позднее чем через 6 ч после приема, форсированный диурез, симптоматическая терапия. Специфического антидота нет. Гемодиализ малоэффективен.

Применение при беременности и кормлении грудью:

В I и II триместрах беременности назначение препарата возможно только в том случае, если предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода. При необходимости назначения препарата при лактации необходимо решить вопрос о прекращении грудного вскармливания.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Не рекомендуется совместное применение мелоксикама и других НПВП или ацетилсалициловой кислоты, поскольку может увеличиться риск развития изъязвления ЖКТ и кровотечения.

Совместное применение мелоксикама с препаратами лития может приводить к повышению концентрации данных препаратов в сыворотке.

НПВП могут ослаблять эффект диуретиков и антигипертензивных препаратов. У пациентов с нарушением почечной функции (например, обезвоженные или пожилые пациенты) совместный прием ингибиторов АПФ или антагонистов рецепторов ангиотензина II с препаратами, ингибирующими цилооксигеназу, может приводить к дальнейшему ухудшению почечной функции, включая возможное развитие острой почечной недостаточности, которая в большинстве случаев обратима.

При совместном применении мелоксикама и глюкокортикоидов, селективных ингибиторов обратного захвата серотонина (циталопрам, флуоксетин, пароксетин, сертралин) увеличивается риск развития язв ЖКТ и серьезных желудочно-кишечных кровотечений.

Совместное применение мелоксикама с метотрексатом может привести к повышению концентрации последнего в сыворотке крови и усилению его токсического воздействия (опасность возникновения анемии и лейкопении, рекомендуется периодическое проведение общего анализа крови).

Риск нефротоксического воздействия, связанный с приемом циклоспорина, препаратов золота, повышается при совместном применении с мелоксикамом. При совместном применении также повышается гепатотоксичность циклоспорина.

При совместном применении мелоксикама и антикоагулянтов (варфарин) или тромболитиков (алтеплаза, стрептокиназа, урокиназа) повышается риск развития кровотечений.

Индукторы микросомального окисления (фенитоин, этанол, барбитураты, рифампицин, фенилбутазон, трициклические антидепрессанты) увеличивают продукцию гидроксилированных активных метаболитов, повышая риск развития тяжелой интоксикации.

Ингибиторы микросомального окисления снижают риск гепатотоксического действия мелоксикама.

При одновременном применении с внутриматочными контрацептивными средствами возможно снижение эффективности действия последних.

Кофеин усиливает анальгезирующий эффект мелоксикама.

Колестеринамин снижает абсорбцию мелоксикама.

Особые указания и меры предосторожности:

Во время длительного лечения необходим контроль картины периферической крови, электролитного баланса, свертывающей системы крови и функционального состояния печени и почек. При применении препарата может наблюдаться повышение концентрации печеночных ферментов и мочевины в сыворотке крови. Эти изменения слабовыраженные и являются преходящими. В случае сильно выраженных изменений прием препарата необходимо отменить.

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 эрозивно-язвенных поражений ЖКТ.

При появлении симптомов гастропатии показан тщательный контроль, включающий проведение эзофагогастродуоденоскопии, анализ крови с определением гемоглобина, гематокрита, анализ кала на скрытую кровь.

Для предупреждения развития гастропатии рекомендуется комбинировать с протективными препаратами, например, мизопростолом или ингибиторами протонной помпы.

Длительный прием Оксикамокса пациентами с неконтролируемым высоким АД, сердечной недостаточностью, сопутствующей ИБС, окклюзионными поражениями периферических артерий и/или цереброваскулярными заболеваниями, с факторами риска развития сердечно-сосудистых заболеваний (например, высокое АД, гиперлипидемия, сахарный диабет, курение), должен осуществляться лишь после тщательного обследования.

При необходимости определения 17-кетостероидов препарат следует отменить за 48 ч до исследования.

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

У пациентов с незначительным или умеренным снижением функции почек (КК более 30 мл/мин) не требуется коррекция режима дозирования.

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

Если в процессе лечения возникли аллергические реакции (зуд, кожная сыпь, крапивница, фотосенсибилизация) необходимо обратиться к врачу с целью решения вопроса о прекращении приема препарата. У больных с повышенным риском развития побочных эффектов лечение начинают с дозы 7.5 мг.

У пациентов с дегидратацией различной этиологии, хронической сердечной недостаточностью, циррозом печени, нефротическим синдромом, принимающих диуретики, с клинически выраженными заболеваниями почек следует мониторировать суточный диурез и функцию почек.

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

В период лечения не рекомендуется прием этанола.

Специальные меры предосторожности при уничтожении неиспользованного лекарственного препарата

Нет необходимости в специальных мерах предосторожности при уничтожении неиспользованного препарата

Оксикамокс.

Влияние на способность к управлению автотранспортом и другими механизмами

Специальных исследований в отношении влияния препарата на способность управлять автотранспортом и механизмами не проводилось, тем не менее, следует соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятиях другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Противопоказан при хронической почечной недостаточности у больных, не подвергающихся диализу (клиренс креатинина менее 30 мл/мин), при прогрессирующих заболеваниях почек, в том числе подтвержденной гиперкалиемии.

С осторожностью: хроническая почечная недостаточность с клиренсом креатинина 30-60 мл/мин.

У пациентов с тяжелой почечной недостаточностью, находящихся на гемодиализе, суточная доза не должна превышать 7.5 мг. При умеренной почечной недостаточности (клиренс креатинина более 25 мл/мин) коррекция дозы не требуется.

При нарушениях функции печени

Противопоказан при выраженной печеночной недостаточности или активном заболевании печени.

Применение в пожилом возрасте

Принимать с осторожностью в пожилом возрасте.

У пожилых пациентов суточная доза не должна превышать 7.5 мг.

Применение в детском возрасте

Противопоказан детям до 15 лет.

Условия хранения:

Препарат хранить в недоступном для детей, сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25°C. Срок годности - 2.5 года. Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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