

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению лекарственного препарата
МОВАСИН

Регистрационный номер: ЛСР-003632/10

Торговое название препарата: Мовасин

Международное непатентованное название: мелоксикам

Лекарственная форма: раствор для внутримышечного введения

Состав на 1 мл:

Активное вещество: мелоксикам - 10 мг,

Вспомогательные вещества: натрия хлорид, глицин, гликофурфурол (тетрагликоль), полоксамер 188, меглюмин (меглумин), натрия гидроксид, вода для инъекций.

Описание:

Прозрачный или слегка опалесцирующий раствор желтого с зеленоватым оттенком цвета.

Фармакотерапевтическая группа: нестероидный противовоспалительный препарат (НПВП)

Код АТХ: [M01AC06]

Фармакологическое действие

Фармакодинамика

Мелоксикам - нестероидный противовоспалительный препарат, обладающий обезболивающим, противовоспалительным и жаропонижающим действием. 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 желудочно-кишечного тракта (ЖКТ) и принимающего участие в регуляции кровотока в почках.

Фармакокинетика

Относительная биодоступность составляет почти 100 %. После внутримышечного введения препарата в дозе 5 мг максимальная концентрация (C_{max}) составляет 1,62 мкг/мл и достигается в течение приблизительно 60 мин. Мелоксикам хорошо связывается белками плазмы, особенно с альбумином (99%). Проникает в синовиальную жидкость, концентрация в синовиальной жидкости составляет примерно 50% концентрации в плазме. Объем распределения (V_d) низкий, в среднем составляет 11 л. Межиндивидуальные различия составляют 30-40%.

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.

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 период полувыведения ($T_{1/2}$) составляет 20 ч. Плазменный клиренс составляет в среднем 8 мл/мин.

Мелоксикам демонстрирует линейную фармакокинетику в дозах 7,5-15 мг при внутримышечном введении.

Печеночная или почечная недостаточность средней тяжести не оказывает существенного влияния на фармакокинетику мелоксикама.

Показания к применению

- Симптоматическое лечение остеоартроза;
- Симптоматическое лечение ревматоидного артрита;
- Симптоматическое лечение анкилозирующего спондилита (болезнь Бехтерева).

Противопоказания

- гиперчувствительность к активному веществу или вспомогательным компонентам;
- противопоказан в период после проведения аорто-коронарного шунтирования;
- декомпенсированная сердечная недостаточность;
- полное или неполное сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза слизистой оболочки носа и околоносовых пазух и непереносимости ацетилсалициловой кислоты и других нестероидных противовоспалительных препаратов (НПВП) (в т.ч. в анамнезе);
- эрозивно-язвенные изменения слизистой оболочки желудка и 12-перстной кишки, активное желудочно-кишечное кровотечение;
- обострение воспалительных заболеваний кишечника (неспецифический язвенный колит, болезнь Крона);
- цереброваскулярное кровотечение или иные кровотечения;
- выраженная печеночная недостаточность или активное заболевание печени;
- выраженная почечная недостаточность у больных, не подвергающихся диализу (клиренс креатинина (КК) менее 30 мл/мин), прогрессирующие заболевания почек в т. ч. подтвержденная гиперкалиемия;
- беременность, период грудного вскармливания;
- детский возраст до 18 лет.

С осторожностью

Ишемическая болезнь сердца, цереброваскулярные заболевания, хроническая сердечная недостаточность, дислипидемия/гиперлипидемия, сахарный диабет, заболевания периферических артерий, курение, КК от 30 до 60 мл/мин.

Анамнестические данные о развитии язвенного поражения желудочно-кишечного тракта (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 глюкокортикостероиды (например, преднизолон);
- селективные ингибиторы обратного захвата серотонина (например, циталопрам, флуоксетин, пироксетин, сертралин).

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

Способ применения и дозы

Внутримышечно. Внутримышечное введение препарата показано только в течение первых 2-3 дней. В дальнейшем лечение продолжают с применением пероральных форм (таблетки).

Рекомендуемая доза составляет 7,5 или 15 мг 1 раз/сут, в зависимости от интенсивности болей и тяжести воспалительного процесса.

Препарат вводят глубоко внутримышечно. Внутривенное введение препарата запрещено!

У пациентов с повышенным риском побочных реакций суточная доза не должна превышать 7,5 мг.

У пациентов с терминальной стадией почечной недостаточности, находящихся на гемодиализе, доза препарата не должна превышать 7,5 мг. 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 внутримышечных 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: более 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; менее 0,1 % - перфорация 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, мультиформная эритема, в т.ч. синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз.

Со стороны дыхательной системы: менее 0,1 % - бронхоспазм.

Со стороны центральной нервной системы (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 (ССС): более 1 % - периферические отеки; 0,1-1 % - повышение артериального давления (АД), сердцебиение, «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 органов чувств: менее 0,1 % - конъюнктивит, нарушения зрения, в т.ч. нечеткость зрения.

Аллергические реакции: менее 0,1 % - ангионевротический отек, анафилактические/анафилактоидные реакции.

Местные реакции: более 1 % - отечность в месте введения; менее 1 % - болезненные ощущения в месте введения.

Передозировка

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

Лечение: специфического антидота нет: симптоматическая терапия. Форсированный диурез, защелачивание мочи, гемодиализ - малоэффективны из-за высокой связи препарата с белками крови.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

При одновременном приеме с другими НПВП (а также с ацетилсалициловой кислотой) увеличивается риск возникновения эрозивно-язвенных поражений и кровотечений из ЖКТ.

При одновременном применении с гипотензивными препаратами, возможно снижение эффективности действия последних.

При одновременном применении с препаратами лития возможно развитие кумуляции лития и увеличение 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 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 (гепарин, тиклопидин, варфарин), антиагрегантами (ацетилсалициловая кислота, клопидогрел), а также с фибринолитическими препаратами (стрептокиназа, фибринолизин) увеличивается риск развития кровотечений (необходим периодический контроль показателей свертываемости крови).

При одновременном применении с селективными ингибиторами обратного захвата серотонина возрастает риск развития желудочно-кишечных кровотечений.

Особые указания

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 заболеваний ЖКТ.

Следует соблюдать осторожность и контролировать показатели функции почек при применении препарата у пациентов пожилого возраста, у пациентов с хронической сердечной недостаточностью с клиническими проявлениями, у пациентов с циррозом печени, а также у пациентов с гиповолемией в результате хирургических вмешательств.

У пациентов с почечной недостаточностью, если КК более 30 мл/мин, не требуется коррекции режима дозирования.

У пациентов, находящихся на диализе, дозировка препарата не должна превышать 7,5 мг/сутки.

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 обратиться к врачу с целью решения вопроса о прекращении приема препарата.

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

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

Управление транспортными средствами, обслуживание машин и механизмов

Применение препарата может вызвать возникновение нежелательных эффектов в виде головной боли и головокружения, сонливости. В период лечения необходимо воздерживаться от вождения автотранспорта и занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Раствор для внутримышечного введения 10 мг/мл

1,5 мл препарата в ампулы нейтрального стекла марки НС-3.

3, 5 ампул помещают в контурные ячейковые упаковки из плёнки поливинилхлоридной.

1 контурную ячейковую упаковку помещают в пачку из картона.

В каждую пачку вкладывают инструкцию по применению и скарификатор ампульный.

В случае использования ампул с кольцом излома или с надрезом и точкой излома скарификатор ампульный не вкладывают.

Срок годности

3 года. Не применять по истечении срока годности

Условия хранения

В сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 30 °С.

Хранить в местах, недоступных для детей.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Владелец регистрационного удостоверения

Общество с ограниченной ответственностью «Биоком Инвест» (ООО «Биоком Инвест»)

230025, Республика Беларусь, г. Гродно, ул. К. Маркса, д. 3

Производитель/Организация, принимающая претензии

Открытое акционерное общество «Акционерное Курганское общество медицинских препаратов и изделий «Синтез» (ОАО «Синтез»), Россия,

640008, Курганская обл., г. Курган, проспект Конституции, д. 7

Тел/факс: (3522) 48-16-89

e-mail: real@kurgansintez.ru

Интернет-сайт: www.kurgansintez.ru