

МЕЛИЯ

Инструкция по медицинскому применению лекарственного средства

Торговое название: Мелия.

Международное непатентованное название: Мелоксикам.

Лекарственная форма: раствор для инъекций.

Состав: каждый мл содержит:

Мелоксикам ВР 5 мг;

Вода для инъекций ВР q.s.

Фармакотерапевтическая группа: НПВП—Оксикамы.

Код АТХ: M01AC06.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика:

Мелоксикам — НПВП, обладающий обезболивающим, противовоспалительным и жаропонижающим действием. Механизм действия — селективное торможение ферментативной активности ЦОГ-2, участвующей в биосинтезе ПГ в области воспаления. В значительно меньшей степени снижает активность ЦОГ-1, участвующей в синтезе ПГ, защищающей слизистую оболочку желудка и принимающей участие в регуляции кровотока в почках. При назначении в высоких дозах, длительном применении и индивидуальных особенностях организма селективность может снижаться.

Фармакокинетика:

Относительная биодоступность составляет почти 100%. После внутримышечного введения препарата в дозе 5 мг максимальная концентрация (С_{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. Объём 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 путём окисления промежуточного метаболита, 5'-гидрокси-метилмелоксикама, 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 неизменённом виде с калом выводится менее 5% от величины суточной дозы, в моче в неизменённом 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.

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

Показания к применению:

- ревматоидный артрит;
- остеоартриты;
- анкилозирующий спондилит;
- болезнь Бехтерева;
- ревматизм мягких тканей;
- острый приступ подагры;
- неревматические воспаления;
- болезненные состояния после операций, травм, зубоврачебных вмешательств.

Противопоказания:

- повышенная чувствительность к действующему веществу или другим ингредиентам препарата, так же к другим нестероидным противовоспалительным препаратам, включая ацетилсалициловую кислоту, или аспирин. Категорически противопоказан больным, у которых после приема любого нестероидного противовоспалительного средства были ангионевротический отек, полипы в носовой полости, признаки бронхиальной астмы или крапивница;
- желудочно-кишечные кровотечения;
- язвы в пищеварительной системе (учитывая сведения анамнеза жизни или текущие обострения);
- период беременности и кормления грудью;
- цереброваскулярные кровотечения;
- тяжелая почечная или печеночная недостаточность;
- кровотечения из других органов;
- возраст до 15 лет;
- некорректируемая выраженная сердечная недостаточность.

Способ применения и дозы:

Раствор для инъекций Мелия предназначен исключительно для введения в мышцу. Противопоказано внутривенное применение раствора. Внутримышечное введение используют в первые дни терапии. В дальнейшем переходят на внутреннее использование препарата в форме таблеток.

При *обострении артроза* назначают по 7,5 мг 1 раз в день. Можно увеличить дозировку до 15 мг, если терапевтический эффект недостаточен.

При *болезни Бехтерева и ревматоидном артрите* - по 15 мг 1 раз в день. Если наблюдается достаточный терапевтический эффект, то суточную дозировку снижают до 7,5 мг однократно в день. Не рекомендуется превышать дозировку препарата 15 мг в сутки.

Учитывая возможную несовместимость, содержащий ампул Мелия не следует смешивать в одном шприце с другими лекарственными средствами.

У пациентов с повышенным риском побочных реакций и с выраженной почечной недостаточностью, находящихся на гемодиализе доза не должна превышать 7,5 мг в день.

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

Побочные действия:

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, боли в животе, запоры, диарея, метеоризм, временные нарушения биохимических показателей функции печени (повышение трансаминаз или билирубина), отрыжка, эрозивно-язвенные поражения ЖКТ, скрытые или явные желудочно-кишечные кровотечения, стоматит;

Со стороны системы кроветворения: изменение формулы крови, анемия, лейкопения и тромбоцитопения;

Со стороны ЦНС: головокружение, головная боль, звон в ушах, сонливость;

Со стороны сердечно-сосудистой системы: повышение АД, «приливы», сердцебиение, отеки;

Со стороны мочевыделительной системы: изменение показателей функции почек (повышение креатинина и/или мочевины сыворотки крови);

Аллергические реакции: бронхоспазм, фотосенсибилизация, кожный зуд, сыпь, крапивница.

Передозировка:

Острая передозировка НПВП препаратами характеризуется появлением тошноты и рвоты, сонливости, болей в животе. Эти симптомы обычно купируются симптоматическими средствами. Редко могут развиваться кровотечения их желудочно-кишечного тракта. Отравление большими дозами препарата характеризуется повышением артериального давления, нарушениями функции печени, угнетением дыхания, развитием острой почечной недостаточности, судорогами, коллапсом. Может наступить кома или остановка сердца. После передозировки препаратом больные нуждаются в симптоматической и поддерживающей терапии.

Лечение проводят соответственно симптомам интоксикации и степени выраженности передозировки. Установлено, что прием 4000 мг колестирамина внутрь трехкратно увеличивает скорость элиминации мелоксикама.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

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 свёртываемости крови).

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

Особые указания:

Следует соблюдать осторожность (также как и при использовании других НПВП) при лечении пациентов с заболеваниями желудочно-кишечного тракта в анамнезе. Особое внимание следует уделять пациентам, сообщаящим о развитии нежелательных явлениях со стороны кожи и слизистых оболочек. Применение НПВП у пациентов со сниженным почечным кровотоком или уменьшенным объемом циркулирующей крови может привести к декомпенсации, скрыто протекающей почечной недостаточности. Применение препарата, как и других препаратов блокирующих циклооксигеназу/синтез простагландинов, может влиять на фертильность, поэтому не рекомендуется женщинам, желающим забеременеть.

Влияния препарата на способность управлять автотранспортом и механизмами:

Специальных исследований не проводилось. От этой деятельности следует воздерживаться пациентам с нарушениями зрения, пациентам, отмечающим сонливость или другие нарушения со стороны центральной нервной системы.

Форма выпуска:

Раствор для инъекций в ампулах по 3 мл. 3 ампулы в пластиковом лотке, вместе с инструкцией по применению в картонной упаковке.

Условия хранения:

Хранить в сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25°C и в местах недоступных для детей.

Срок годности:

Указано на упаковке. Не использовать по истечении срока годности.

Условия отпуска:

По рецепту врача.