

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению лекарственного препарата

Элокс-СОЛОфарм

Регистрационный номер: ЛП-004221

Торговое наименование: Элокс-СОЛОфарм

Международное непатентованное наименование: Мелоксикам

Лекарственная форма: раствор для внутримышечного введения

Состав

1 мл препарата содержит:

Действующее вещество:

Мелоксикам	- 10,0 мг
Вспомогательные вещества:	
Тетрагидрофурил макрогол (гликофурил)	- 100,0 мг
Полюксамер 188	- 50,0 мг
Меглюмин	- 6,25 мг
Глицин	- 5,0 мг
Натрия хлорид	- 3,0 мг
10 М раствор натрия гидроксида	до pH 8,2-8,9
Вода для инъекций	до 1,0 мл

Описание

Прозрачная желтая или зеленовато-желтая жидкость.

Фармакотерапевтическая группа

Нестероидный противовоспалительный препарат (НПВП).

Код АТХ: M01AC06

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Мелоксикам – нестероидный противовоспалительный препарат, обладающий обезболивающим, противовоспалительным и жаропонижающим действием. Относится к классу оксикамов, производных энolioвой кислоты. Противовоспалительное действие связано с торможением ферментативной активности циклооксигеназы-2, участвующей в биосинтезе простагландинов в области воспаления. В меньшей степени мелоксикам действует на циклооксигеназу-1, участвующую в синтезе простагландина, защищающего слизистую оболочку желудочно-кишечного тракта и принимающего участие в регуляции кровотока в почках.

Фармакокинетика

Абсорбция

Относительная биодоступность составляет около 100 %. После внутримышечного введения препарата в дозе 15 мг максимальная концентрация препарата в плазме (C_{max}) составляет 1,62 мкг/мл и достигается в течение приблизительно 60 мин.

Распределение

Мелоксикам хорошо связывается с белками плазмы, особенно с альбумином (99 %). Проникает в синовиальную жидкость, концентрация в синовиальной жидкости составляет примерно 50 % концентрации в плазме. Объем распределения низкий, приблизительно 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 метаболитическом 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) принимают участие пероксидаза, активность которой, вероятно, индивидуально варьирует.

Выведение

Выводится в равной степени с калом и мочой, преимущественно в виде метаболитов. В неизменном виде с калом выводится менее 5 % от величины суточной дозы, в моче в неизменном виде препарат обнаруживается только в следовых количествах. Средний период полувыведения мелоксикама составляет 20 ч. Плазменный клиренс составляет в среднем 8 мл/мин.

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

Имеются сообщения, что при пероральном применении для мелоксикама характерна энтеропегетическая ретикуляция. При приеме лекарственных форм мелоксикама для приема внутрь средний период времени до достижения максимальной плазменной концентрации препарата в плазме крови (T_{max}) составляет 5-8 часов, при этом нарушение по каким-либо причинам энтеропегетической ретикуляции может увеличить элиминацию мелоксикама и снизить его период полувыведения до 13 ч и более (при приеме внутрь).

Недостаточность функции печени и/или почек

Недостаточность функции печени, а также легкая или умеренно выраженная почечная недостаточность существенно влияют на фармакокинетику мелоксикама не оказывая влияние на фармакодинамику мелоксикама. При терминальной почечной недостаточности увеличение объема распределения может привести к более высоким концентрациям свободного мелоксикама, поэтому у этих пациентов суточная доза не должна превышать 7,5 мг.

Пациенты пожилого возраста

У пациентов пожилого возраста средний плазменный клиренс в период равновесного состояния фармакокинетики немного ниже, чем у молодых пациентов.

Показания к применению

Начальная терапия и краткосрочное симптоматическое лечение при остеоартрите (артроз, дегенеративные заболевания суставов), ревматоидном артрите, анкилозирующем спондилите, других воспалительных и дегенеративных заболеваниях костно-мышечной системы, таких как артропатии, дорсопатии (например, ишиас, боль внизу спины, плечевой периартрит и другие), сопровождающихся болью.

Противопоказания

- Гиперчувствительность к активному ингредиенту и вспомогательным компонентам препарата, к ацетилсалициловой кислоте или другим НПВП.
- Полное или неполное сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза носа и околоносовых пазух, ангионевротического отека или крапивницы, вызванных непереносимостью ацетилсалициловой кислоты или других НПВП из-за существующей вероятности перекрестной чувствительности (в том числе 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 и сердечная недостаточность.

- Тяжелая почечная недостаточность (если не проводится гемодиализ, клиренс креатинина менее 30 мл/мин), прогрессирующее заболевание почек, в том числе подтвержденная гиперкалькемия.

- Активное заболевание печени.

- Активное желудочно-кишечное кровотечение, недавно перенесенные цереброваскулярные кровотечения или установленный диагноз заболеваний свертывающей системы крови.

- Возраст до 18 лет.

- Терапия периоперационных болей при проведении шунтирования коронарных артерий.

- Сопутствующая терапия антикоагулянтами, так как есть риск образования внутримышечных гематом.

- Беременность.

- Период грудного вскармливания.

С осторожностью

- Заболевания желудочно-кишечного тракта (ЖКТ) в анамнезе (наличие инфекции *Helicobacter pylori*).

- Застойная сердечная недостаточность.

- Почечная недостаточность (клиренс креатинина 30-60 мл/мин).

- Ишемическая болезнь сердца.

- Цереброваскулярные заболевания.

- Дислипидемия/гиперлипидемия.

- Сахарный диабет.

- Сопутствующая терапия следующими препаратами: антикоагулянтами, пероральными глюкокортикостероидами, антиагреганты, селективные ингибиторы обратного захвата серотонина.

- Заболевания периферических артерий.

- Пожилой возраст.

- Длительное использование НПВП.

- Курение.

- Частое употребление алкоголя.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Препарат противопоказан при беременности.

При необходимости назначения препарата в период грудного вскармливания, грудное вскармливание необходимо прекратить.

Не рекомендуется применение мелоксикама у женщин, планирующих беременность, а также у женщин, участвующих в исследовании бесплодия или по контролю рождаемости.

Безопасность применения во время беременности данного препарата не доказана. Влияние задержки синтеза простагландинов на эмбриогенез во время первых двух триместров беременности не ясно. В последний триместр беременности механизм действия мелоксикама характеризуется торможением родовой деятельности, преждевременным закрытием Ductus arteriosus Botalli у плода, повышается предрасположенность к кровотечениям у матери и ребенка и повышается риск образования отеков у матери.

Мелоксикам в небольших количествах проникает в материнское молоко, и в случае грудного вскармливания мелоксикам можно обнаружить в плазме крови младенца.

Как препарат, ингибирующий синтез циклооксигеназы/простагландина, мелоксикам 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 препарата.

Способ применения и дозы

Препарат вводится посредством глубокой внутримышечной инъекции.

Препарат нельзя вводить внутривенно.

Остеоартрит с болями синдромом: 7,5 мг в сутки. При необходимости эта доза может быть увеличена до 15 мг в день.

Ревматоидный артрит: 15 мг в сутки. В зависимости от лечебного эффекта эта доза может быть снижена до 7,5 мг в день.

Анкилозирующий спондилит: 15 мг в сутки.

В зависимости от лечебного эффекта эта доза может быть снижена до 7,5 мг в день.

У пациентов с повышенным риском побочных реакций (заболевания ЖКТ в анамнезе, наличие факторов риска сердечно-сосудистых заболеваний) рекомендуется начинать лечение с дозы 7,5 мг в день.

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

Общие рекомендации

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

Максимальная рекомендуемая суточная доза – 15 мг.

Комбинированное применение

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

Внутримышечное введение препарата показано только в течение первых нескольких дней терапии. В дальнейшем лечение продолжают с применением пероральных лекарственных форм.

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

Учитывая возможную несовместимость, препарат не следует сочетать в одном шприце с другими лекарственными средствами.

Порядок работы с полимерной ампулой:

1. Взять ампулу и встряхнуть ее, удерживая за горлышко.

2. Сдавить ампулу рукой, при этом не должно происходить выделение препарата, а вращающими движениями повернуть и отделить клапан.

3. Через образовавшееся отверстие немедленно соединить шприц с ампулой.

4. Перевернуть ампулу и медленно набрать в шприц ее содержимое.

5. Надеть иглу на шприц.

Побочное действие

Ниже описаны побочные эффекты, связь которых с применением препарата расценивалась, как возможная. Побочные эффекты, зарегистрированные при постмаркетинговом применении, связь которых с приемом препарата расценивалась, как возможная, отмечены знаком *.

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 (≥ 1/10000, < 1/1000), очень редко (< 1/10000), не установлено.

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы

Нечасто – анемия;

редко – лейкопения, тромбоцитопения, изменения числа клеток крови, включая изменения лейкоцитарной формулы.

Нарушения со стороны иммунной системы

Нечасто – другие реакции гиперчувствительности немедленного типа*.

не установлено – анафилактический шок*, анафилактические реакции*.

Нарушения психики

Редко – изменение настроения*;

не установлено – спутанность сознания*, дезориентация*.

Нарушения со стороны нервной системы

Часто – головная боль*;

нечасто – головокружение, сонливость.

Нарушения со стороны органов зрения, слуха и лабиринтные нарушения

Нечасто – вертиго*;

редко – конъюнктивит*, нарушения зрения, включая нечет-

кость зрения», шум в ушах.
Нарушения со стороны сердца и сосудов
Нечасто – повышение артериального давления, чувство «прили-
ва» крови к лицу;
редко – ощущение сердцебиения.

Нарушения со стороны дыхательной системы

Редко – бронхильная астма у пациентов с аллергией к ацетилса-
лицевой кислоте и др. НПВП.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта

Часто – боль в животе, диспепсия, диарея, тошнота, рвота;
нечасто – скрытое и явное желудочно-кишечное кровотечение,
гастрит*, стоматит, запор, вздутие живота, отрыжка;
редко – гастродуоденальные язвы, колит, эрозия;
очень редко – перфорация желудочно-кишечного тракта.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей

Нечасто – транзиторные изменения показателей функции печени
(например, повышение активности трансаминаз или билирубина);
очень редко – гепатит*.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей

Нечасто – ангиотек*, зуд, кожная сыпь;
редко – токсический эпидермальный некролиз*, синдром Стивен-
с-Джонсона*, крапивница;
очень редко – буллезный дерматит*, мультиформная эритема*;
не установлено – фотосенсибилизация.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей

Нечасто – изменение показателей функции почек (повышение
уровня креатинина и/или мочевины в сыворотке крови), наруше-
ние мочеиспускания, включая острую задержку мочи*;
очень редко – острая почечная недостаточность*.

Нарушения со стороны половых органов и молочных желез

Нечасто – поздняя овуляция*;
не установлено – бесплодие*, эректиция*.

Общие расстройства и нарушения в месте введения

Часто – боль и отек в месте введения;
нечасто – отеки.

Совместное применение с лекарственными средствами, угнета-
ющими костный мозг (например, метотрексат) может спрово-
цировать цитопению.

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

Как и для других НПВП не исключают возможность появления
интерстициального нефрита, гломерулонефрита, почечного ме-
дуллярного некроза, нефротического синдрома.

Передозировка

Симптомы: тошнота, рвота, боли в эпигастрии, желудочно-ки-
шечное кровотечение, острая почечная недостаточность,
печеночная недостаточность, остановка дыхания, асистолия,
легария, сонливость, повышение артериального давления, ко-
матозное состояние, судороги, сердечно-сосудистый коллапс,
остановка сердца, анафилактические реакции.

Лечение: специфический антидот отсутствует. В случае пере-
дозировки препарата проводить симптоматическую терапию.
Форсированный диурез, задержка мочеиспускания, гемодиализ – ма-
лоэффективны из-за высокой связи препарата с белками крови.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

- Другие ингибиторы синтеза простагландина, включая глюко-
кортикоиды и салицилаты – одновременный прием с мелоксика-
мом увеличивает риск образования язв в желудочно-кишечном
тракте и желудочно-кишечных кровотечений (вследствие синер-
гических действия). Одновременный прием с другими НПВП не
рекомендуется.

- Антикоагулянты для приема внутрь, гепарин для системного
применения, тромболитические средства – одновременный
прием с мелоксикамом повышает риск кровотечения. В случае
одновременного применения необходим тщательный контроль
за свертывающей системой крови.

- Антигипертензивные препараты, ингибиторы обратного захвата
серотонина – одновременный прием с мелоксикамом повышает
риск кровотечения вследствие ингибирования тромбоцитарной
функции. В случае одновременного применения необходим
тщательный контроль за свертывающей системой крови.

- Препараты лития – НПВП могут ускорить лития в плазме, по-
этому уменьшения выведения его почками. Одновременное
применение мелоксикама с препаратами лития не рекоменду-
ется. В случае необходимости одновременного применения реко-
мендуется тщательный контроль концентрации лития в плазме
в течение всего курса применения препаратов лития.

- Метотрексат – НПВП снижают секрецию метотрексата почками,
тем самым, повышая его концентрацию в плазме. Одновремен-
ное применение мелоксикама и метотрексата (в дозе более 15 мг
в неделю) не рекомендуется. В случае одновременного приме-
нения необходим тщательный контроль за функцией почек и фор-
мулой крови. Мелоксикам может усиливать гематологическую
токсичность метотрексата, особенно у пациентов с нарушением
функции почек.

- Контрацепция – есть данные, что НПВП могут снижать эффек-
тивность внутриматочных контрацептивных устройств, однако
это не доказано.

- Диуретики – применение НПВП в случае обезвоживания па-
циентов сопровождается риском развития острой почечной не-
достаточности.

- Антигипертензивные средства (бета-адреноблокаторы, инги-
биторы ангиотензинпревращающего фермента, вазодилатора,
диуретики). НПВП снижают эффект антигипертензивных
средств, вследствие ингибирования простагландинов, обладаю-
щих вазодилатирующими свойствами.

- Антагонисты ангиотензиновых рецепторов, также как и ингиби-
торы ангиотензинпревращающего фермента, при совместном
применении с НПВП усиливают снижение клубочковой фильтра-
ции, что тем самым, может привести к развитию острой почечной
недостаточности, особенно у пациентов с нарушением функции
почек.

- Колестирамин, связывая мелоксикам в желудочно-кишечном
тракте, приводит к его более быстрому выведению.

- Пеметрексед – при одновременном применении мелоксикама
и пеметрекседа у пациентов с клиренсом креатинина от 45
до 79 мл/мин прием мелоксикама следует прекратить за 5 дней
до начала приема пеметрекседа и возможно возобновить через
2 дня после окончания приема. Если существует необходимость
в совместном применении мелоксикама и пеметрекседа, то такие
пациенты должны находиться под тщательным контролем, espe-
циально в отношении миелосупрессии и возникновения побочных
явлений со стороны желудочно-кишечного тракта. У пациентов
с клиренсом креатинина менее 45 мл/мин прием мелоксикама
совместно с пеметрекседом не рекомендуется.

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

При использовании совместно с мелоксикамом лекарственных
препаратов, которые обладают известной способностью ин-
гибировать CYP2C9 и/или CYP3A4 (или метаболизируются при
участии этих ферментов), таких как производные сульфонил-
мочевины или пробенецид, следует принимать во внимание воз-
можность фармакокинетического взаимодействия.

При совместном применении с антидиабетическими средствами
для приема внутрь (например, производными сульфонилмочеви-
ны, натеглинидом) возможны взаимодействия, опосредованные
CYP2C9, которые могут привести к увеличению концентрации
как этих лекарственных средств, так и мелоксикама в крови.
Пациенты, одновременно принимающие мелоксикам с препа-
ратами сульфонилмочевины или натеглинидом, должны тщательно
контролировать уровень сахара в крови из-за возможности раз-
вития гипогликемии.

При одновременном применении антацидов, циметидина, дигок-

сина и фуросемида, значимых фармакокинетических взаимодей-
ствий выявлено не было.

Особые указания

Пациенты, страдающие заболеваниями желудочно-кишечного
тракта, должны регулярно наблюдаться. При возникновении
явного поражения ЖКТ или желудочно-кишечного кровоте-
чения препарат необходимо отменить.

Язва желудочно-кишечного тракта, перфорация или кровоте-
чения могут возникнуть в ходе применения НПВП 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 осложне-
ний в целом более серьезны у лиц пожилого возраста.

При применении препарата могут развиваться такие серьезные
реакции со стороны кожи, как эксфолиативный дерматит,
синдром Стивенса-Джонсона, токсичный эпидермальный не-
кролиз. Поэтому следует уделять особое внимание пациентам,
сообщающим о развитии нежелательных явлений со стороны
кожи и слизистых оболочек, а также реакций повышенной чув-
ствительности 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, изменений слизистых оболочек или других признаков ги-
перчувствительности пациент должен рассмотреть вопрос о пре-
кращении применения препарата.

Описаны случаи при приеме НПВП повышения риска развития
серьезных сердечно-сосудистых тромбозов, инфаркта миокар-
да, приступа стенокардии, возможно со смертельным исходом.
Такой риск повышается при длительном применении препарата,
особенно у пациентов с вышеуказанными заболеваниями в анам-
незе 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 умень-
шенным объемом циркулирующей крови может привести к де-
компенсации и развитию острой 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, стойкая сердечная недостаточ-
ность, цирроз печени, нефротический синдром или острое на-
рушение функции почек, пациенты, одновременно принимающие
диуретические средства, ингибиторы ангиотензин-превращаю-
щего фермента, антагонисты ангиотензин-II-рецепторов, а также
пациенты, перенесшие серьезные хирургические вмеша-
тельства, которые ведут к гиповолемии. У таких пациентов в начале
терапии следует тщательно контролировать диурез и функцию
почек.

Применение НПВП совместно с диуретиками может привести
к задержке натрия, калия и воды, а также к снижению натрий-
уретического действия мочегонных средств. В результате этого
у предрасположенных пациентов возможно усиление признаков
сердечной недостаточности или гипертонии. Поэтому необхо-
дима тщательная оценка 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 мелоксикама (также, как и большинство
других НПВП) возможно эпизодическое повышение активности
трансаминаз в сыворотке крови или других показателей функции
печени. В большинстве случаев это повышение было небольшим
и преходящим. Если выявлены изменения существенные или не
уменьшаются со временем, препарат следует отменить и про-
вести наблюдение за выявленными лабораторными изменениями.

Обычно пациенты, имеющие острые или хронические нежелатель-
ные явления, в связи с чем такие пациенты должны
тщательно наблюдаться.

Подобно другим НПВП, мелоксикам может маскировать симпто-
мы основного инфекционного заболевания.

Применение мелоксикама, как и других препаратов, ингибирую-
щих синтез циклооксигеназы/простагландина, может влиять
на фертильность, поэтому не рекомендуется женщинам, имеющим
трудности с зачатием.

У пациентов со слабой или умеренной почечной недостаточ-
ностью (клиренс креатинина более 25 мл/мин) коррекция дозы
не требуется.

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

Влияние на способность управления транспортными средствами и механизмами

В период лечения из-за возможных побочных эффектов со
стороны сердечно-сосудистой и нервной системы необходимо
соблюдать осторожность при управлении транспортными сред-
ствами и занятии другими потенциально опасными видами де-
ятельности, требующими повышенной концентрации внимания и
быстрых психомоторных реакций.

Форма выпуска

Раствор для внутримышечного введения 10 мг/мл.
По 1,5 мл в ампулы из полиэтилена низкой плотности или по-
липропилена, или в ампулы из бесцветного или окрашенного
стекла.

По 3 или 5 ампул из полиэтилена низкой плотности или полипро-
пилена вместе с инструкцией по применению в пачке из картона.
По 3 или 5 ампул из стекла в контурной ячейковой упаковке
из пленки поливинилхлоридной с пленкой полимерной или с
фольгой алюминиевой лакированной, или без пленки полимер-
ной и фольги алюминиевой лакированной, или в (предварительно
изготовленной) форме из картона с ячейками для укладки ампул.

По 1 контурной ячейковой упаковке или форме из картона вместе
с инструкцией по применению и скарификатором для ампульным,
или без скарификатора ампульного в пачке из картона.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

5 лет.

Не применять после окончания срока годности!

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Владелец регистрационного удостоверения

ООО «Гротек»

Россия, 195279, Санкт-Петербург

Индустриальный пр., д. 71, к. 2, лит. А

Тел: +7 812 385 47 88

Факс: +7 812 385 47 88

Производитель/организация, принимающая претензии

ООО «Гротек»

Россия, 195279, Санкт-Петербург

Индустриальный пр., д. 71, к. 2, лит. А

Тел: +7 812 385 47 88

Факс: +7 812 385 47 88

www.solopharm.com

www.eloccs.ru