

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ И СОЦИАЛЬНОГО РАЗВИТИЯ
РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ
по применению лекарственного препарата для медицинского применения

МЕЛОКСИКАМ КАНОН

наименование лекарственного препарата

Регистрационный номер

Торговое название

Мелоксикам Канон

Международное непатентованное название

мелоксикам

Лекарственная форма

Суппозитории ректальные

Состав

1 суппозиторий содержит:

активное вещество: мелоксикам - 7,5 мг или 15 мг

вспомогательное вещество: жирных кислот глицериды (Витепсол Н 15) – 992,5 мг или 985 мг.

Описание

Суппозитории желтого цвета, торпедообразной формы, без вкраплений на продольном срезе. На срезе допускается наличие воздушного стержня или воронкообразного углубления.

Фармакотерапевтическая группа

Нестероидный противовоспалительный препарат.

Код АТХ: [M01AC06].

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Мелоксикам – нестероидный противовоспалительный препарат (НПВП), обладающий обезболивающим, противовоспалительным и жаропонижающим действием. 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 применении в высоких дозах, длительном применении и индивидуальных особенностях организма ЦОГ-2 селективность снижается. Подавляет синтез простагландинов в области воспаления в большей степени, чем в слизистой оболочке желудка или почек, что связано с относительно избирательным ингибированием ЦОГ-2. В меньшей степени мелоксикам действует на циклооксигеназу-1 (ЦОГ-1), участвующую в синтезе простагландинов, защищающих слизистую оболочку желудочно-кишечного тракта (ЖКТ) и принимающих участие в регуляции кровотока в почках.

Фармакокинетика

Всасывание

Мелоксикам хорошо вс�ывается после ректального введения, абсолютная биодоступность – 89 %.

Средняя максимальная концентрация в плазме достигается в течение 5 – 6 часов. При многократном применении устойчивое состояние фармакокинетики достигается в срок от 3 до 5 дней.

Максимальная концентрация препарата в плазме в период устойчивого состояния фармакокинетики достигается приблизительно через 5 часов после применения препарата. Диапазоны различий между максимальными (C_{max}) и базальными концентрациями (C_{min}) схожи для таблеток и суппозиториев и составляют после его приема один раз в день 0,4 – 1,0 мкг/мл – для дозы 7,5 мг, и 0,8 – 2,0 мкг/мл – для дозы 15 мг.

Распределение

Связывание с белками плазмы составляет более 99 %. Диапазон различий между максимальными и базальными концентрациями препарата после его приема один раз в день относительно невелик и составляет при использовании дозы 7,5 мг 0,4 – 1,0 мкг/мл, а при использовании дозы 15 мг – 0,8 – 2,0 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.

Метаболизм

Почти полностью метаболизируется в печени с образованием четырех неактивных в фармакологическом отношении производных. Основной метаболит, 5'-карбокси-мелоксикам (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 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. Период полувыведения ($T_{1/2}$) мелоксикама составляет 15 – 20 часов. Плазменный клиренс составляет в среднем 8 мл/мин. У лиц пожилого возраста клиренс препарата снижается. Объем распределения низкий и составляет в среднем 11 л.

Недостаточность функции печени и/или почек

Недостаточность функции печени, а также умеренно выраженная почечная недостаточность существенного влияния на фармакокинетику мелоксикама не оказывает. 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.

Пожилые пациенты

У пожилых пациентов средний плазменный клиренс в период устойчивого состояния фармакокинетики немного ниже, чем у молодых пациентов.

Показания

- Симптоматическое лечение остеоартроза;
- Симптоматическое лечение ревматоидного артрита;
- Симптоматическое лечение анкилозирующего спондилита (болезнь Бехтерева), других заболеваний суставов, сопровождающихся болевым синдромом.
Больше информации об этом лекарстве на ПроТаблетки
<https://protabletka.ru/meloxicam/>