

# ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению препарата

## АРТРОЗАН®

**Регистрационный номер:** ЛС-001013

**Торговое название препарата:** Артрозан®

**Международное непатентованное название (МНН):** мелоксикам

**Лекарственная форма:** таблетки

### Состав

1 таблетка содержит

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

*вспомогательные вещества:*

для дозировки 7,5 мг - крахмал картофельный 64,5 мг, лактозы моногидрат 100 мг, повидон (поливинилпирролидон среднемолекулярный медицинский) 3,2 мг, натрия цитрат 18,8 мг, магния стеарат 2 мг, кремния диоксид коллоидный (аэросил) 4 мг;

для дозировки 15 мг - крахмал картофельный 94,5 мг, лактозы моногидрат 150 мг, повидон (поливинилпирролидон среднемолекулярный медицинский) 4,5 мг, натрия цитрат 27 мг, магния стеарат 3 мг, кремния диоксид коллоидный (аэросил) 6 мг.

### Описание

Таблетки от светло-желтого до желтого цвета, круглые, плоскоцилиндрические, с фаской и риской. Допускается незначительная мраморность.

**Фармакотерапевтическая группа:** нестероидный противовоспалительный препарат

**Код АТХ:** [M01AC06]

### Фармакологические свойства

#### Фармакодинамика

Артрозан® - нестероидный противовоспалительный препарат (НПВП), обладающий противовоспалительным, жаропонижающим и анальгезирующим действием.

Относится к классу оксикамов, является производным энолиевой кислоты.

Механизм действия связан с ингибированием синтеза простагландинов в результате избирательного торможения ферментативной активности циклооксигеназы второго типа (ЦОГ-2), участвующей в биосинтезе простагландинов в области воспаления. При назначении в высоких дозах, длительном применении и индивидуальных особенностях организма избирательность в отношении ЦОГ-2 снижается. В меньшей степени действует на циклооксигеназу первого типа (ЦОГ-1), участвующую в синтезе простагландинов, защищающих слизистую оболочку желудочно-кишечного тракта и принимающих участие в регуляции кровотока в почках. За счет указанной селективности подавления активности ЦОГ-2 препарат реже вызывает эрозивно-язвенные поражения желудочно-кишечного тракта.

#### Фармакокинетика

Хорошо всасывается из желудочно-кишечного тракта, абсолютная биодоступность - 89%. Одновременный прием пищи не изменяет всасывание препарата. При использовании препарата внутрь в дозах 7,5 и 15 мг его концентрации пропорциональны дозам. Равновесные концентрации достигаются в течение 3-5 дней лечения. При длительном применении препарата (более 1 года) концентрации сходны с таковыми, которые отмечаются после первого достижения устойчивого состояния фармакокинетики.

Связывание с белками плазмы составляет 99%. При применении дозы 7,5 мг минимальная концентрация ( $C_{\min}$ ) составляет 0,4 мкг/мл, максимальная концентрация ( $C_{\max}$ ) - 1,0 мкг/мл; при использовании дозы 15 мг  $C_{\min}$  - 0,8 мкг/мл,  $C_{\max}$  - 2,0 мкг/мл. 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'-

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 CYP 2C9, дополнительное значение имеет изофермент CYP 3A4. В образовании двух других метаболитов, (составляющих, соответственно, 16% и 4% от величины дозы препарата), принимает участие пероксидаза, активность которой, вероятно, варьирует.

Препарат проникает через гистогематические барьеры, концентрация в синовиальной жидкости составляет 50% максимальной концентрации в плазме.

Плазменный клиренс составляет в среднем 8 мл/мин. У лиц пожилого возраста клиренс препарата снижается. Объем распределения низкий, и составляет в среднем 11 л. Печеночная или почечная недостаточность средней степени тяжести существенного влияния на фармакокинетику мелоксикама не оказывает.

Выводится в равной пропорции с калом и мочой, преимущественно в виде метаболитов. Через кишечник в неизменном виде выводится менее 5% суточной дозы, в моче в неизменном виде препарат обнаруживается только в следовых количествах. Период полувыведения ( $T_{1/2}$ ) мелоксикама составляет 15-20 часов.

### **Показания к применению**

Симптоматическое лечение остеоартроза, ревматоидного артрита, анкилозирующего спондилита (болезнь Бехтерева), остеохондроза и других воспалительных и дегенеративных заболеваний мышечно-суставной системы, сопровождающихся болевым синдромом.

### **Противопоказания**

- гиперчувствительность к мелоксикаму или вспомогательным компонентам препарата; в состав входит лактоза, поэтому пациенты с редкими наследственными заболеваниями, такими как непереносимость галактозы, лактазная недостаточность или глюкозо-галактозная мальабсорбция, не должны принимать препарат;
- сердечная недостаточность в стадии декомпенсации;
- ранний послеоперационный период после аорто-коронарного шунтирования;
- полное или неполное сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза носа и околоносовых пазух и непереносимости ацетилсалициловой кислоты или других НПВП (в т.ч. в анамнезе);
- обострение язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки; активное желудочно-кишечное кровотечение;
- воспалительные заболевания кишечника (язвенный колит, болезнь Крона в стадии обострения);
- цереброваскулярное кровотечение или иные кровотечения;
- выраженная печеночная недостаточность или активное заболевание печени;
- хроническая почечная недостаточность (у больных, не подвергающихся гемодиализу (клиренс креатинина менее 30 мл /мин); прогрессирующее заболевание почек, в т.ч. подтвержденная гиперкалиемия);
- детский возраст до 15 лет;
- беременность; период грудного вскармливания.

### **С осторожностью**

Препарат следует применять с осторожностью у пациентов пожилого возраста и при наличии следующих состояний в анамнезе: ИБС, застойная сердечная недостаточность, цереброваскулярное заболевание, дислипидемия/гиперлипидемия, сахарный диабет, болезнь периферических сосудов, ХПН с клиренсом креатинина 30-60 мл/мин; язвенное поражение желудочно-кишечного тракта, наличие инфекции *Helicobacter pylori*.

Длительное применение НПВП, злоупотребление алкоголем, сопутствующая терапия антикоагулянтами (например, варфарин), антиагрегантами (например, ацетилсалициловая кислота, клопидогрел), пероральными глюкокортикостероидами (например, преднизолон), селективными ингибиторами обратного захвата серотонина (например, циталопрам, флу-

оксетин, сертралин, пароксетин) должны обязательно учитываться при назначении мелоксикама.

Для снижения риска развития нежелательных явлений со стороны ЖКТ 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.

Рекомендуемый режим дозирования:

- Ревматоидный артрит: 15 мг в сутки. По необходимости доза может быть снижена до 7,5 мг в сутки.

- Остеоартроз, остеохондроз и другие воспалительные и дегенеративные заболевания мышечно-суставной системы, сопровождающиеся болевым синдромом: 7,5 мг в сутки. При неэффективности доза может быть увеличена до 15 мг в сутки.

- Анкилозирующий спондилит: 15 мг в сутки.

Максимальная суточная доза не должна превышать 15 мг.

У пациентов с повышенным риском развития побочных эффектов, а также у пациентов с выраженной почечной недостаточностью, находящихся на гемодиализе, доза не должна превышать 7,5 мг в сутки.

### **Побочное действие**

*Со стороны пищеварительной системы:* более 1% - диспепсия, в т.ч. тошнота, рвота, боль в животе, диарея, запор, метеоризм; 0,1-1% - преходящее повышение активности «печеночных» трансаминаз, гипербилирубинемия, отрыжка, эзофагит, язва желудка или 12-перстной кишки, желудочно-кишечное кровотечение (скрытое или явное), стоматит; менее 0,1% - перфорация органов ЖКТ, колит, гепатит, гастрит.

*Со стороны органов кроветворения:* более 1% - анемия; 0,1-1% - 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:* более 1% - головокружение, головная боль; 0,1-1% - шум в ушах, сонливость; менее 0,1% - эмоциональная лабильность, спутанность сознания, дезориентация.

*Со стороны сердечно-сосудистой системы:* более 1% - периферические отеки; 0,1-1% - повышение артериального давления, ощущение сердцебиения, гиперемия лица.

*Со стороны мочевыделительной системы:* 0,1-1% - гиперкреатининемия, повышение концентрации сывороточной мочевины; менее 0,1% - острая почечная недостаточность; связь с приемом мелоксикама не установлена - интерстициальный нефрит, альбуминурия, гематурия.

*Со стороны органов чувств:* менее 0,1% - конъюнктивит, нечеткость зрения.

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

### **Передозировка**

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

*Лечение:* специфических антидотов и антагонистов нет. При передозировке препарата - промывание желудка, прием активированного угля (в течение ближайшего часа), симптоматическая терапия. Форсированный диурез, защелачивание мочи, гемодиализ малоэффективны из-за высокой связи препарата с белками крови.

### **Взаимодействие с другими лекарственными средствами**

- при одновременном применении с другими нестероидными противовоспалительными препаратами (в том числе с ацетилсалициловой кислотой) увеличивается риск возникновения эрозивно-язвенных поражений и кровотечений желудочно-кишечного тракта;
- 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 циклоспорином возрастает риск развития почечной недостаточности;
- при одновременном применении с внутриматочными контрацептивными средствами возможно снижение эффективности действия последних;
- при одновременном применении с антикоагулянтами (гепарин, варфарин), тромболитическими препаратами (стрептокиназа, фибринолизин), и антиагрегантами (тиклопидин, клопидогрел, ацетилсалициловая кислота) увеличивается риск развития кровотечений (необходим периодический контроль показателей свертываемости крови);
- при одновременном применении с колестирамином ускоряется выведение мелоксикама через желудочно-кишечный тракт
- при одновременном применении с селективными ингибиторами обратного захвата серотонина возрастает риск развития желудочно-кишечных кровотечений.

#### **Особые указания**

- Следует соблюдать осторожность при применении препарата пациентами, в анамнезе которых есть указания на язвенную болезнь желудка и 12-перстной кишки, и пациентами, находящимися на антикоагулянтной терапии. У таких пациентов повышен риск возникновения эрозивно-язвенных заболеваний желудочно-кишечного тракта.
- Следует соблюдать осторожность и контролировать суточный диурез и функцию почек при применении препарата у пожилых и больных с уменьшенным ОЦК и сниженной клубочковой фильтрацией (дегидратация, хроническая сердечная недостаточность, цирроз печени, нефротический синдром, клинически выраженные заболевания почек, прием диуретиков, обезвоживание после больших хирургических операций).
- У пациентов с незначительным или умеренным снижением функции почек (клиренс креатинина 30-60 мл/мин) коррекция дозы не требуется.
- Пациенты, принимающие одновременно мочегонные средства и мелоксикам, должны принимать достаточное количество жидкости.
- При возникновении аллергических реакций (зуд, кожная сыпь, крапивница, фотосенсибилизация) в процессе лечения 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 для приема женщинам, планирующим беременность.

Применение препарата может вызывать возникновение головной боли, головокружения и сонливости. При возникновении этих явлений следует отказаться от управления транспортными средствами и выполнения других потенциально опасных видов деятельности, требующих повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

#### **Форма выпуска**

Таблетки 7,5 мг, 15 мг.

По 10, 15, 20 таблеток в контурную ячейковую упаковку. По 1, 2, 3 или 5 контурных ячейковых упаковок с инструкцией по применению в пачку из картона.

**Условия хранения**

Хранить при температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.

**Срок годности**

3 года. Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

**Условия отпуска из аптек**

По рецепту.

**Наименование и адрес предприятия-производителя/организация, принимающая претензии:**

ОАО "Фармстандарт-Лексредства", 305022, Россия, г. Курск, ул. 2-я Агрегатная, д.1а/18

Тел./факс: (4712) 34-03-13

[www.pharmstd.ru](http://www.pharmstd.ru)