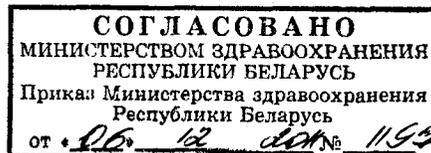


ЛИСТОК-ВКЛАДЫШ  
ПО ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

**ЛОКСИДОЛ**  
**LOXIDOL**

*ТОРГОВОЕ НАЗВАНИЕ*  
Локсидол, Loxidol



*МЕЖДУНАРОДНОЕ НЕПАТЕНТОВАННОЕ НАЗВАНИЕ*  
Мелоксикам, Meloxicam

*ХИМИЧЕСКОЕ НАЗВАНИЕ*  
4-гидрокси-2-метил-N-(5-метил-2-тиазолил)-2H-1,2-бензотиазин-3-карбоксамид-1,1-диоксид

*ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА*  
Раствор для инъекций.  
*Описание:* светло-желтая прозрачная жидкость.

*СОСТАВ*  
1 ампула содержит  
*Активное вещество:* мелоксикам 15,0 мг  
*Вспомогательные вещества:* меглумин, гликофуrol, полоксамер 188, глицин, натрия хлорид, натрия гидроксид, вода для инъекций.  
*КОД ПРЕПАРАТА ПО АТХ* M01AC06

*ФАРМАКОТЕРАПЕВТИЧЕСКАЯ ГРУППА*  
Нестероидное противовоспалительное средство. Противоревматическое средство.

*ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА*

*Фармакодинамика*

Мелоксикам является производным энолиевой кислоты и относится к группе нестероидных противовоспалительных средств, оказывает выраженное противовоспалительное, анальгетическое и жаропонижающее действие. Высокую противовоспалительную активность проявляет на всех стандартных моделях воспаления. Механизм действия обусловлен способностью ингибировать биосинтез простагландинов — медиаторов воспаления за счет селективного ингибирования ЦОГ-2, обеспечивая более безопасный механизм действия в связи с селективным ингибированием ЦОГ-2 по сравнению с ЦОГ-1. Терапевтический эффект НПВП связан с ингибированием синтеза ЦОГ-2, в то время как ингибирование ЦОГ-1 приводит к побочным эффектам со стороны желудка и почек.

Селективность ингибирования ЦОГ-2 мелоксикамом подтверждена как *in vitro*, так и *ex vivo*. Мелоксикам не влияет на агрегацию тромбоцитов и на время кровотечения при применении в рекомендованных дозах *ex vivo*, в отличие от индометацина, диклофенака, ибупрофена и напроксена, которые значительно ингибируют агрегацию тромбоцитов и увеличивают время кровотечения.

При применении мелоксикама в рекомендованных дозах выявлена низкая частота побочных явлений со стороны ЖКТ (перфорация, образование язв и кровотечение) по сравнению со стандартными дозами других НПВП.

#### *Фармакокинетика:*

Мелоксикам практически полностью всасывается при внутримышечном введении. Концентрация **Локсидола** (мелоксикама) в плазме пропорциональна вводимой дозе. Через 60 мин после внутримышечного введения 15 мг мелоксикама, максимальная концентрация в плазме составляет примерно 1,62 мг/л.

Мелоксикам очень хорошо связывается с белками плазмы, особенно с альбумином (90-100%). Проникает в синовиальную жидкость, концентрация в синовиальной жидкости составляет примерно 50% концентрации в плазме. Объем распределения низкий, в среднем 11 л.

Мелоксикам почти полностью метаболизируется в печени с образованием 4-х 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).

**Локсидол** 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 часов. Плазменный клиренс составляет в среднем 8 мл/мин.

У пожилых пациентов плазменный клиренс немного ниже.

#### *ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ*

- начальный период лечения и краткосрочная симптоматическая терапия болевого синдрома при ревматоидном артрите, остеоартрите, анкилозирующем спондилите.

#### *ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ*

- язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки в фазе обострения;
- тяжелая печеночная недостаточность;
- тяжелая почечная недостаточность (если не проводится гемодиализ);
- тяжелая сердечная недостаточность;
- дети до 16 лет;
- беременность и период лактации;
- явное желудочно-кишечное кровотечение, недавнее цереброваскулярное кровотечение или другое кровотечение;
- проводимая терапия антикоагулянтами

**Локсидол** не следует применять у пациентов с повышенной чувствительностью к мелоксикаму или любому компоненту препарата. Существует вероятность перекрестной чувствительности к ацетилсалициловой кислоте и другим НПВС. Также не следует назначать пациентам с признаками развития астмы, назального полипоза, ангионевротического отека или крапивницы вследствие применения ацетилсалициловой кислоты и других НПВС.

#### *ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ*

Применение **Локсидола**, как и других НПВП, требует строгого наблюдения за пациентами с желудочно-кишечными заболеваниями в анамнезе, а так же за больными, принимающими антикоагулянты. При наличии пептической язвы или желудочно-кишечного кровотечения прием **Локсидола** противопоказан.

Как и в случае применения других НПВП, потенциально летальные осложнения со стороны ЖКТ (желудочно-кишечные кровотечения, язва или перфорация) могут возникнуть в любое время в процессе лечения при наличии или без серьезных желудочно-кишечных заболеваний в анамнезе.

НПВП ингибируют синтез почечных простагландинов, необходимых для поддержания почечного кровотока. У пациентов со сниженным почечным кровотоком применение НПВП может вызвать почечную недостаточность, исчезающей после отмены препарата. У пациентов с незначительно или умеренно выраженными нарушениями функции почек дозу препарата можно не снижать, однако необходим тщательный контроль функции почек.

В отдельных редких случаях НПВП могут привести к развитию интерстициального нефрита, гломерулонефрита, ренального медулярного некроза или развитию нефротического синдрома. К таким осложнениям склонны пациенты с хронической почечной недостаточностью, после обширных хирургических операций (которые вызывали гиповолемию), а также пациенты с циррозом печени. В таком случае необходим контроль диуреза и функции почек с самого начала терапии.

НПВП при совместном приеме с диуретиками могут усилить задержку натрия, калия и воды в организме и влиять на натрийуретический эффект мочегонных препаратов, вследствие чего, у предрасположенных пациентов может возникать или усиливаться сердечная недостаточность или артериальная гипертензия.

С осторожностью назначают препарат ослабленным пациентам, лицам пожилого возраста, больным с сердечной недостаточностью.

Мелоксикам, как и любой другой НПВП, может маскировать симптомы основного инфекционного заболевания.

НПВП могут повышать риск сердечнососудистых тромбозов, инфаркта миокарда и нарушений мозгового кровообращения, вплоть до летальных исходов. Риск возрастает при увеличении сроков приема препарата. Большому риску подвержены пациенты с сердечнососудистыми заболеваниями или имеющие факторы, предрасполагающие к развитию сердечнососудистых заболеваний.

Как и другие лекарственные средства, ингибирующие синтез ЦОГ/простагландинов, мелоксикам может повредить процессу оплодотворения, поэтому не рекомендуется женщинам, которые планируют забеременеть.

### **ПОБОЧНОЕ ДЕЙСТВИЕ**

*Со стороны желудочно-кишечного тракта:* диспепсия, тошнота, рвота, боли в животе, запор, метеоризм, диарея (>1%); преходящие изменения показателей функции печени (в т.ч. повышение уровня трансаминаз или билирубина), отрыжка, эзофагит, язвенные поражения ЖКТ, скрытое или макроскопически видимое желудочно-кишечное кровотечение (0,1 – 1,0 %); колит (< 0,1 %).

*Со стороны системы кроветворения:* анемия (> 1,0 %); лейкопения, изменение лейкоцитарной формулы, тромбоцитопения (0,1 – 1,0 %).

*Со стороны кожных покровов:* зуд, кожная сыпь (> 1,0 %), крапивница (0,1 – 1,0 %); фотосенсибилизация (< 0,1 %). В редких случаях возможно развитие буллезных реакций, мультиформной эритемы, синдрома Стивенса-Джонсона, токсического эпидермального некролиза.

*Со стороны дыхательной системы:* острые приступы бронхиальной астмы (< 0,1 %).

*Со стороны нервной системы:* головная боль (> 1,0 %); головокружение, шум в ушах, сонливость (0,1 – 1,0 %); спутанность сознания, нарушение ориентации, изменение настроения (<0,1%).

*Со стороны сердечно-сосудистой системы:* отеки (> 1,0 %); повышение АД, сердцебиение, приливы (0,1 – 1,0 %).

*Со стороны мочевыделительной системы:* изменение лабораторных показателей функции почек (повышение уровня креатинина и/или мочевины в крови) (0,1 – 1,0 %); острая почечная недостаточность (<0,1%).

Аллергические реакции: ангионевротический отек, реакции гиперчувствительности немедленного типа (в т.ч. анафилактические и анафилактоидные) (<0.1%).

Местные реакции: отечность в месте введения (>1%); болезненные ощущения в месте введения(<1%).

### **СПОСОБ ПРИМЕНЕНИЯ И ДОЗЫ**

**Локсидол** назначают взрослым пациентам. Внутримышечное введение препарата показано только в течение первых 2-3 дней. Дальнейшее лечение продолжают с применением пероральных форм (таблетки).

Препарат вводится посредством глубокой внутримышечной инъекции.

Препарат нельзя вводить внутривенно.

Содержимое ампул **Локсидол** не следует смешивать в одном шприце с другими лекарственными средствами.

Максимальная рекомендуемая доза составляет 15 мг 1 раз в сутки.

У пациентов с повышенным риском развития побочных эффектов лечения начинают с дозы 7,5мг.

### **ПЕРЕДОЗИРОВКА**

Антидот не известен, в случае передозировки препаратом **Локсидол** следует провести симптоматическое и поддерживающее лечение.

### **ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ С ДРУГИМИ ЛЕКАРСТВЕННЫМИ СРЕДСТВАМИ**

Другие НПВС, в т.ч. салицилаты (ацетилсалициловая кислота): одновременное применение более чем одного НПВС увеличивает риск образования язв в ЖКТ и желудочно-кишечных кровотечений вследствие синергизма действия. Совместное применение мелоксикама и других НПВС не рекомендуется.

Антикоагулянты, антиагреганты, гепарин для системного применения, тромболитические средства: повышают риск кровотечения. В случае невозможности избежать одновременного применения этих препаратов, необходимо тщательное наблюдение за эффектом антикоагулянтов.

Литий: НПВС повышают концентрацию лития в плазме за счет снижения почечной экскреции лития. Совместное применение лития и НПВС не рекомендуется. В случае необходимости такой комбинированной терапии следует контролировать концентрацию лития в плазме в начале лечения, при подборе дозы и отмене мелоксикама.

Метотрексат: НПВС могут уменьшать канальцевую секрецию метотрексата и таким образом увеличивать концентрацию метотрексата в плазме. При необходимости комбинированной терапии следует контролировать формулу крови и функцию почек. Необходимо соблюдать осторожность в случае, если НПВС и метотрексат применяются одновременно в течение 3 дней, т.к. концентрация метотрексата в плазме может повышаться и, как следствие могут возникать токсические эффекты.

Циклоспорин: НПВС, оказывая действие на почечные простагландины, могут усиливать нефротоксичность циклоспорина. В случае проведения комбинированной терапии следует контролировать функцию почек.

Внутриматочные контрацептивы: НПВС снижают эффективность внутриматочных контрацептивов.

Диуретики: применение НПВС повышает риск развития острой почечной недостаточности у пациентов с обезвоживанием. Пациенты, принимающие одновременно мелоксикам и диуретики, должны получать достаточное количество жидкости. До начала лечения необходимо исследование функции почек.

Антигипертензивные средства (например, бета-адреноблокаторы, ингибиторы ангиотензинпревращающего фермента (АПФ), вазодилататоры, диуретики). НПВС

снижают эффект антигипертензивных средств, вследствие ингибирования простагландинов, обладающих вазодилатирующими свойствами.

Холестирамин: увеличивает выведение мелоксикама вследствие связывания его в ЖКТ.

#### *ПРИМЕНЕНИЕ В ПЕДИАТРИИ*

Препарат не применяется в педиатрической практике.

#### *ПРИМЕНЕНИЕ ПРИ БЕРЕМЕННОСТИ И КОРМЛЕНИИ ГРУДЬЮ*

Применение препарата в период беременности и лактации противопоказано.

#### *ВЛИЯНИЕ НА СПОСОБНОСТЬ УПРАВЛЯТЬ АВТОМОБИЛЕМ ИЛИ МЕХАНИЗМАМИ*

От управления автомобилем или механизмами следует воздерживаться пациентам с нарушениями зрения, пациентам, отмечающим сонливость или другие нарушения со стороны центральной нервной системы.

#### *ФОРМА ВЫПУСКА*

Раствор для инъекций в ампулах из бесцветного стекла 1,5 мл. 3 ампулы в термопластиковом разделителе в картонной коробке вместе с листком-вкладышем.

#### *УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ*

Хранить при температуре не выше 25 °С в защищенном от света месте.

Хранить в недоступном для детей месте.

#### *СРОК ГОДНОСТИ*

3 года от даты производства.

Не применять по истечении срока годности.

#### *УСЛОВИЯ ОТПУСКА ИЗ АПТЕК*

Отпускается по рецепту.

#### *ПРОИЗВОДИТЕЛЬ*

Владелец торговой марки и сертификата регистрации является компания «УОРЛД МЕДИЦИН ЛИМИТЕД», ВЕЛИКОБРИТАНИЯ («WORLD MEDICINE LIMITED», GREAT BRITAIN).

#### *Произведено*

«Идол Илач Долум Сан. ве Тидж. А.Ш.», 34020 Топкапы – Стамбул, Турция («İdol İlaç Dolum San. ve Tic. A.Ş.», 34020 Topkapı- İstanbul / Turkey).

По лицензии «Билим Илач Санайи ве Тиджарет А.Ш.»,

Айзага Йолу 34398 Маслак – Стамбул, Турция

(«Bilim İlaç Sanayi ve Ticaret A.Ş.»),

Ayazaga Yolu, 34398 Maslak – İstanbul / Turkey).