

ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

МЕЛЬДОНИЙ-ДЕКО

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Мельдоний-ДЕКО

Международное непатентованное наименование: мельдоний

Лекарственная форма: раствор для инъекций

Состав:

действующее вещество: мельдония дигидрат (триметилгидразиния пропионата дигидрат)
в пересчете на мельдония дигидрат без адсорбированной влаги – 100,0 мг;

вспомогательное вещество: вода для инъекций – до 1,0 мл

Описание: бесцветная прозрачная жидкость

Фармакотерапевтическая группа: средства для лечения заболеваний сердца; другие препараты для лечения заболеваний сердца.

Код АТХ: C01EB22.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Мельдоний – структурный аналог гамма-бутиробетаина – вещества, которое находится в каждой клетке организма человека.

В условиях повышенной нагрузки мельдоний восстанавливает равновесие между доставкой и потребностью клеток в кислороде, устраняет накопление токсических продуктов обмена в клетках, защищая их от повреждения; оказывает также тонизирующее влияние. В результате его применения организм приобретает способность выдерживать нагрузку и быстро восстанавливать энергетические резервы. Благодаря этим свойствам мельдоний используют для лечения различных нарушений деятельности сердечно-сосудистой системы, кровоснабжения головного мозга, а также для повышения физической и умственной работоспособности. В результате снижения концентрации карнитина усиленно синтезируется гамма-бутиробетаин, обладающий вазодилатирующими свойствами. В случае острого ишемического повреждения миокарда мельдоний замедляет образование некротической зоны, укорачивает реабилитационный период. При сердечной недостаточности повышает сократимость миокарда, увеличивает толерантность к физической нагрузке, снижает частоту приступов стенокардии. При острых и хронических ишемических нарушениях мозгового кровообращения мельдоний

улучшает циркуляцию крови в очаге ишемии, способствует перераспределению крови в пользу ишемизированного участка. Препарат устраняет функциональные нарушения нервной системы у больных хроническим алкоголизмом при синдроме абстиненции.

Фармакокинетика

Абсорбция

После внутривенного введения многократных доз мельдония максимальная концентрация ($C_{\max}$) достигла $25,50 \pm 3,63$ мкг/мл.

У пациентов с циррозом печени и у пациентов с тяжелой почечной недостаточностью биодоступность была увеличена с увеличением $C_{\max}$, площади под фармакокинетической кривой «концентрация-время» (AUC) и периодом полувыведения ($T_{1/2}$). При внутривенном применении AUC после разового и повторного введения доз мельдония отличается. Эти результаты свидетельствуют о возможном накоплении мельдония в плазме крови.

Распределение

Мельдоний из кровотока быстро распространяется в тканях; обладает высокой аффинностью к тканям сердца. Связь с белками плазмы увеличивается в зависимости от времени после применения дозы. Мельдоний и его метаболиты частично преодолевают плацентарный барьер. Исследования выделения мельдония в материнское молоко человека не проводились.

Биотрансформация

Мельдоний главным образом метаболизируется в печени.

Элиминация

В выведении мельдония и его метаболитов значительную роль играет почечная экскреция. После разового внутривенного применения 250 мг, 500 мг и 1000 мг доз мельдония $T_{1/2}$ раннего выведения мельдония составляет 5,56–6,55 часов, $T_{1/2}$ конечного выведения – 15,34 часов.

Особые группы пациентов

Почечная недостаточность

Пациентам с ослабленной деятельностью почек, у которых повышена биодоступность, следует уменьшать дозу. Существует взаимодействие почечной реабсорбции мельдония или его метаболитов (например, 3-гидроксимельдония) и карнитина, в результате которого увеличивается почечный клиренс карнитина. Отсутствует прямое влияние

мельдония, гамма бутиробетаина (ГББ) и комбинации мельдония/ГББ на ренин-ангиотензин-альдостероновую систему.

Печеночная недостаточность

Пациентам с нарушениями функций печени, у которых повышена биодоступность, следует уменьшать дозу мельдония. Изменений показателей деятельности печени у людей после применения доз, составляющих 400–800 мг, не наблюдалось.

Лица пожилого возраста

Дозу мельдония следует уменьшить пожилым пациентам с нарушениями деятельности печени или почек, у которых повышена биодоступность.

Показания к применению

- в составе комплексной терапии: ишемическая болезнь сердца (стенокардия, инфаркт миокарда), хроническая сердечная недостаточность и кардиомиопатия на фоне дисгормональных нарушений; острые и хронические нарушения кровоснабжения головного мозга (инсульт, цереброваскулярная недостаточность);
- гемофтальм и кровоизлияния в сетчатку различной этиологии, тромбоз центральной вены сетчатки и её ветвей, ретинопатия различной этиологии (в т.ч. диабетическая и гипертоническая);
- сниженная работоспособность, умственные и физические перегрузки (в т.ч. у спортсменов). Препарат может давать положительный результат при проведении допинг контроля (см. раздел «Особые указания»);
- синдром абстиненции при хроническом алкоголизме (в комбинации со специфической терапией алкоголизма).

Противопоказания

- Гиперчувствительность к действующему веществу или к любому из вспомогательных веществ;
- беременность и период грудного вскармливания;
- повышение внутричерепного давления (при нарушении венозного оттока, внутричерепных опухолях);
- возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).

С осторожностью

При заболеваниях печени и/или почек.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Безопасность применения препарата у беременных женщин не изучена, поэтому во

избежание возможного неблагоприятного воздействия на плод, его применение противопоказано.

Выделение препарата мельдоний с молоком и его влияние на состояние здоровья новорожденного не изучены. При необходимости применения препарата следует прекратить грудное вскармливание.

Способ применения и дозы

Ввиду возможного развития возбуждающего эффекта, рекомендуется применять препарат в первой половине дня.

Мельдоний вводится внутривенно, внутримышечно, парабульбарно. Способ введения, дозы и продолжительность курса лечения устанавливают индивидуально, в зависимости от показаний, тяжести состояния и др.

Сердечно-сосудистые заболевания

В составе комплексной терапии:

- ишемическая болезнь сердца (инфаркт миокарда) – внутривенно струйно по 0,5-1 г в день (5-10 мл препарата);
- ишемическая болезнь сердца (стабильная стенокардия); хроническая сердечная недостаточность и кардиомиопатия на фоне дисгормональных нарушений – внутривенно струйно по 0,5-1 г в день (5-10 мл препарата) или внутримышечно по 0,5 г 1-2 раза в сутки. Курс лечения 10-14 дней с последующим переходом на прием препарата внутрь.

Общий курс лечения 4-6 недель.

Нарушение мозгового кровообращения

В составе комплексной терапии в острой фазе по 0,5 г (5 мл препарата) 1 раз в день внутривенно в течение 10 дней с последующим переходом на прием препарата внутрь по 0,5-1 г. Общий курс лечения 4-6 недель.

При хронической недостаточности мозгового кровообращения (дисциркуляторной энцефалопатии) по 0,5 г (5 мл препарата) внутримышечно или внутривенно 1 раз в день в течение 10 дней с последующим переходом на прием препарата внутрь по 0,5 г. Общий курс лечения 4-6 недель.

Повторные курсы (обычно 2-3 раза в год) возможны после консультации с врачом.

Офтальмология (гемофтальм и кровоизлияния в сетчатку различной этиологии, тромбоз центральной вены сетчатки и её ветвей, ретинопатия различной этиологии (диабетическая и гипертоническая)).

По 0,05 г (0,5 мл препарата) парабульбарно в течение 10 дней. В том числе применяется в составе комбинированной терапии.

Умственные и физические перегрузки

По 0,5 г (5 мл препарата) внутримышечно или внутривенно 1 раз в день. Курс лечения 10-14 дней. При необходимости лечение повторяют через 2-3 недели.

Хронический алкоголизм

По 0,5 г (5 мл препарата) внутримышечно или внутривенно 2 раза в день. Курс лечения 7-10 дней.

Побочное действие

В зависимости от частоты возникновения выделяют следующие группы нежелательных реакций в соответствии с классификацией Всемирной организации здравоохранения (ВОЗ): очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, но $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$, но $< 1/100$), редко ($\geq 1/10000$, но $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$), частота неизвестна (на основании имеющихся данных оценить невозможно).

Нарушения со стороны иммунной системы

Часто: аллергические реакции*.

Редко: повышенная чувствительность, аллергический дерматит, крапивница ангионевротический отек, анафилактическая реакция.

Психические нарушения

Редко: возбуждение, чувство страха, навязчивые мысли, нарушения сна.

Нарушения со стороны нервной системы

Часто: головные боли*.

Редко: парестезия, тремор, гипестезия, шум в ушах, вертиго, головокружение, нарушения походки, предобморочное состояние, потеря сознания.

Нарушения со стороны сердца

Редко: аритмия, сердцебиение, тахикардия/синусовая тахикардия, фибрилляция предсердий, ощущение дискомфорта в груди/боли в груди.

Нарушения со стороны сосудов

Редко: понижение или повышение артериального давления, гипертонический криз, гиперемия, бледность кожных покровов.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения

Редко: воспаление в горле, кашель, диспноэ, апноэ.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта

Часто: диспепсия*.

Редко: дисгевзия (металлический вкус во рту), потеря аппетита, рвотные позывы, тошнота, рвота, накопление газов, диарея, боли в животе.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей

Редко: высыпания, общие/макулезные/папулезные высыпания, зуд.

Нарушения со стороны мышечной, костной и соединительной ткани

Редко: боли в спине, мышечная слабость, мышечные спазмы.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей

Редко: поллакиурия.

Общие нарушения и реакции в месте введения

Редко: общая слабость, дрожь, астения, отек, отек лица, отек ног, ощущение жара, ощущение холода, холодный пот.

Лабораторные и инструментальные данные

Редко: отклонения в электрокардиограмме (ЭКГ), ускорение работы сердца, эозинофилия*.

*Нежелательные реакции, которые наблюдались в ранее проведенных неконтролируемых клинических исследованиях.

В связи с применением мельдония сообщалось также о болях в верхней части живота и мигрени.

Передозировка

Симптомы

Снижение артериального давления, сопровождающееся головной болью, тахикардией, головокружением, общей слабостью.

Лечение

Симптоматическое. В случае тяжелой передозировки необходимо контролировать функции печени и почек.

В связи с выраженным связыванием препарата с белками гемодиализ не имеет существенного значения.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Мельдоний можно применять вместе с нитратами пролонгированного действия другими антиангинальными средствами для лечения стабильной стенокардии напряжения, сердечными гликозидами и диуретическими препаратами для лечения сердечной недостаточности.

Мельдоний можно комбинировать с антикоагулянтами, антиагрегантами,

антиаритмическими средствами и препаратами, улучшающими микроциркуляцию.

Мельдоний может усиливать действие препаратов, содержащих глицерилтринитрат, нифедипина, бета-адреноблокаторов, других гипотензивных средств и периферических вазодилататоров.

У пациентов с хронической сердечной недостаточностью, принимающих одновременно для уменьшения симптомов мельдоний и лизиноприл, выявлено позитивное действие комбинированной терапии (вазодилатация главных артерий, улучшение периферического кровообращения и качества жизни, уменьшение психологического и физического стресса). Сочетание оротовой кислоты и мельдония обладает аддитивным фармакологическим эффектом на восстановление реперфузии после ишемии.

В результате одновременного приема Сорбифер Дурулес (препарата, содержащего железа сульфат и аскорбиновую кислоту) и мельдония у пациентов с анемией, вызванной дефицитом железа, улучшался состав жирных кислот в красных кровяных клетках.

Мельдоний помогает устранить патологические изменения сердца, вызванные азидотимидином (АЗТ), и опосредованно воздействует на реакции окислительного стресса, вызванные АЗТ, приводящих к дисфункции митохондрий.

Применение мельдония в комбинации с АЗТ или другими препаратами для лечения синдрома приобретенного иммунодефицита (СПИД) положительно влияет на терапию СПИДа.

При взаимодействии с этанолом мельдоний уменьшает продолжительность сна. Мельдоний оказывает выраженное противосудорожное действие после применения пентилентетразола.

Во время судорог, вызванных пентилентетразолом, установлено выраженное противосудорожное действие мельдония. В свою очередь, при применении перед терапией мельдонием альфа₂-адреноблокатора йохимбина в дозе 2 мг/кг и ингибитора синтазы оксида азота (СОА) N-(G)-нитро-L-аргинина в дозе 10 мг/кг, полностью блокируется противосудорожное действие мельдония.

Прием высоких доз мельдония может усилить кардиотоксичность, вызванную циклофосфамидом.

Дефицит карнитина, образующийся при приеме D-карнитина (фармакологически неактивный изомер мельдония), может усилить кардиотоксичность, вызванную ифосфамидом.

Мельдоний оказывает защитное действие в случае кардиотоксичности, вызванной

индинавиром, и нейротоксичности, вызванной эфавирензом.

Не рекомендуется принимать вместе с другими препаратами, содержащими мельдоний, так как может увеличиться риск появления нежелательных реакций.

Особые указания

Многолетний опыт лечения острого инфаркта миокарда и нестабильной стенокардии в кардиологических отделениях показывает, что мельдоний не является препаратом I ряда при остром коронарном синдроме и его применение не является строго необходимым.

С 1 января 2016 года мельдоний включен в список запрещенных веществ Всемирного антидопингового агентства.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и механизмами

Нет данных о неблагоприятном воздействии препарата на скорость психомоторных реакций.

Форма выпуска

По 5 мл в ампулы нейтрального стекла марки НС-3 или 1-го гидролитического класса.

На каждую ампулу наклеивают этикетку из бумаги этикеточной или писчей, или самоклеящуюся этикетку, или текст наносят непосредственно на ампулу методом глубокой или струйной печати.

5 ампул помещают в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной.

1 или 2 контурные ячейковые упаковки по 5 ампул с инструкцией по применению помещают в пачку из картона. В пачку вкладывают скарификатор ампульный.

При упаковке ампул с кольцом излома или надрезом и точкой скарификатор ампульный не вкладывают.

Условия хранения

В защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С. Не замораживать!

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

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

Условия отпуска

По рецепту

Производитель

ООО «КОМПАНИЯ «ДЕКО», Россия

Юридический адрес:

129344, г. Москва, ул. Енисейская, д. 3, к. 4

Адрес производства:

171130, Тверская обл., г.о. Вышневолоцкий, п. Зеленогорский, ул. Советская, д. 6а

Организация, принимающая претензии

ООО «КОМПАНИЯ «ДЕКО», Россия

129344, г. Москва, ул. Енисейская, д. 3, к. 4

тел/факс (499) 189-63-25