МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

МИНЗДРАВ РОССИИ
ЛП - 004691 - 120218

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению лекарственного препарата

Ауранекс

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Ауранекс

Международное непатентованное наименование: мемантин

Лекарственная форма: раствор для приема внутрь

Состав на 1 мл:

Действующее вещество: мемантина гидрохлорид – 10,0 мг.

Вспомогательные вещества: сорбитол, калия сорбат, вода очищенная.

Описание: бесцветный или слегка желтоватый прозрачный раствор.

Фармакотерапевтическая группа:

Деменции средство лечения.

Код АТХ: N06DX01

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Производное адамантана. Являясь неконкурентным антагонистом, N-метил-D-аспартат (NMDA)-рецепторов, оказывает модулирующее действие на глутаматергическую систему. Регулирует ионный транспорт, блокирует кальциевые каналы, нормализует мембранный потенциал, улучшает процесс передачи нервного импульса, улучшает когнитивные процессы, память и способность к обучению, повышает повседневную активность.

Фармакокинетика

После приема внутрь быстро и полностью всасывается. Максимальная концентрация достигается в течение 3-8 часов. При нормальной функции почек кумуляции мемантина не отмечено.

Распределение: ежедневные дозы в 20 мг в сутки ведут к стабильной концентрации мемантина в плазме 70-150 нг/мл.

Метаболизм: около 80% мемантина выводится в неизмененном виде. При экспериментах

in vitro метаболизма, осуществляемого цитохромом Р450, выявлено не было. Метаболиты не обладают собственной фармакологической активностью.

Выводится из организма моноэкспоненциально, с периодом полувыведения терминальной фазы 60-100 часов. Выводится с мочой. При щелочной реакции мочи выведение замедляется.

Показания к применению

Деменция альцгеймеровского типа умеренной и тяжелой степени.

Противопоказания

Гиперчувствительность к препарату, тяжелая печеночная недостаточность (класс С по шкале Чайлд-Пью), беременность, грудное вскармливание, дети до 18 лет (в связи с недостаточностью данных).

С осторожностью

С осторожностью назначают больным тиреотоксикозом, эпилепсией; предрасположенностью к развитию судорог, одновременное применение антагонистов NMDA-рецепторов (амантадин, кетамин, декстрометорфан), наличие факторов, повышающих pH мочи (резкая смена диеты, например, переход на вегетарианство, обильный прием щелочных буферных растворов), тяжелые инфекции мочевыводящих путей (вызванные *Proteus bacteria*), инфаркт миокарда (в анамнезе), сердечная недостаточность III-IV класс (по классификации NYHA), неконтролируемая артериальная гипертензия, почечная недостаточность, печеночная недостаточность.

Способ применения и дозы

Препарат следует принимать внутрь один раз в день и всегда в одно и тоже время.

Можно принимать независимо от приема пищи.

Режим дозирования устанавливается индивидуально. Начинать лечение рекомендуют с назначения минимально эффективных доз.

Терапия должна проводиться под контролем врача, имеющего опыт в вопросах диагностики и лечения болезни Альцгеймера. Терапию следует начинать только в том случае, если лицо, оказывающее регулярный уход за пациентом, будет следить за приемом лекарственного препарата пациентом. Диагноз должен быть поставлен в соответствии с действующими рекомендациями. Переносимость и дозу препарата следует регулярно оценивать, преимущественно в течение трех месяцев после начала лечения. Затем следует регулярно

оценивать клиническую эффективность лекарственного препарата и переносимость терапии в соответствии с действующими клиническими рекомендациями.

Для удобства дозирования необходимо использовать механический дозатор. Одно нажатие соответствует 0,5 мл раствора (содержит 5 мг мемантина гидрохлорида). Раствор нельзя наливать из флакона непосредственно в полость рта, а следует отмерить в стакан с водой.

Максимальная суточная доза мемантина составляет 20 мг.

Взрослым назначают препарат:

в течение 1-й недели терапии (дни 1-7) в дозе 5 мг/сут (0,5 мл раствора – одно нажатие),

в течение 2-й недели (дни 8-14) – в дозе 10 мг/сут (1,0 мл раствора – два нажатия),

в течение 3-й недели (дни 15-21) – по 15 мг/сут (1,5 мл раствора – три нажатия),

Начиная с 4-й недели – по 20 мг/сут (2,0 мл раствора –четыре нажатия).

Ориентировочное значение поддерживающей дозы –20 мг/сут (2,0 мл раствора – четыре нажатия).

Пациенты пожилого возраста (старше 65 лет)

Коррекции дозы не требуется.

Нарушение функции почек

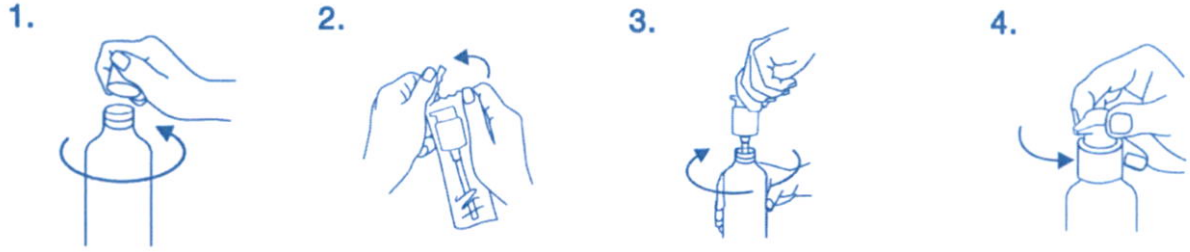
У пациентов с клиренсом креатинина (КК 50-80 мл/мин) рекомендуется 10 мг/сут по стандартной схеме. У пациентов с тяжелой почечной недостаточностью (КК 5-29 мл/мин) суточная доза не должна превышать 10 мг/сут.

Нарушение функции печени

У пациентов с легким и умеренным нарушением функции печени (класс А и В по шкале Чайлд-Пью) коррекции дозы не требуется. Пациентам с тяжелой печеночной недостаточностью (класс С по шкале Чайлд-Пью) препарат противопоказан.

Инструкция по использованию механического дозатора:

Перед первым применением препарата необходимо установить механический дозатор на флакон.



1. Открутите крышку флакона, повернув ее против часовой стрелки.
2. Вскройте упаковку с механическим дозатором и аккуратно извлеките его.

3. Опустите механический дозатор во флакон трубкой вниз и закрутите на флаконе, поворачивая по часовой стрелке вокруг горлышка. Для надлежащего применения не следует откручивать дозатор после установки.
4. Чтобы перевести механический дозатор в рабочее положение, необходимо повернуть дозирующую головку против часовой стрелки.



5. Перед первым использованием механического дозатора, необходимо нажать на дозирующую головку 5 раз подряд для заполнения трубки дозатора раствором и правильного дозирования препарата впоследствии.
6. Одно нажатие на дозирующую головку соответствует одной дозе препарата – 0,5 мл раствора (содержит 5 мг мемантина гидрохлорида).

7-8. Для правильного использования механического дозатора, флакон должен находиться в вертикальном положении, а нажатие на дозирующую головку должно быть плавным (не слишком медленным).

Побочное действие

Побочные реакции классифицированы по клиническим проявлениям (в соответствии с поражением определенных систем органов) и по частоте встречаемости: очень часто (> 1/10), часто (>1/100 до < 1/10), не часто (> 1/1,000 до < 1/100), редко (>1/10,000 до < 1/1,000), очень редко (< 1/10,000), частота не установлена (в настоящее время данные о распространенности побочных реакций отсутствуют).

Со стороны организма в целом – общие побочные реакции	Часто Нечасто	Головная боль Утомляемость
Нарушения со стороны иммунной системы	Часто	Гиперчувствительность к компонентам препарата
Инфекции	Нечасто	Грибковые инфекции
Психические нарушения	Часто	Сонливость

	Нечасто Нечасто Частота не установлена	Спутанность сознания Галлюцинации[1] Психотические реакции
Нарушения со стороны сердечно-сосудистой системы	Часто Нечасто Нечасто	Повышение артериального давления Венозный тромбоз/ тромбоэмболия Сердечная недостаточность
Нарушения со стороны дыхательной системы	Часто	Одышка
Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта	Часто Нечасто Частота не установлена	Запор Тошнота, рвота Панкреатит
Нарушения со стороны центральной и периферической нервной системы	Часто Часто Нечасто Очень редко	Головокружение Нарушение равновесия Нарушение походки Судороги
Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей	Часто Частота не установлена	Повышение биохимических показателей функции печени Гепатит

[1] Галлюцинации наблюдались, главным образом, у пациентов с болезнью Альцгеймера на стадии тяжелой деменции. Имеются отдельные сообщения о возникновении этих побочных реакций при применении препарата в клинической практике (данные, полученные после появления препарата в продаже): агранулоцитоз, лейкопения (включая нейтропению), панцитопения, тромбоцитопения, тромбоцитопеническая пурпура, острая почечная недостаточность, синдром Стивенса-Джонсона, головокружение, сонливость, повышенная возбудимость, повышенная утомляемость, беспокойство, повышение внутричерепного давления, тошнота, галлюцинации, головная боль, нарушение сознания, мышечный гипертонус, нарушения походки, депрессия, судороги, психотические реакции, суицидальные мысли, запор, тошнота, панкреатит, кандидоз, повышение артериального давления, рвота, цистит, повышение либидо, венозный тромбоз, тромбоэмболия, аллергические реакции.

Передозировка

По результатам клинических исследований и пострегистрационного наблюдения получены лишь ограниченные данные по передозировке.

Симптомы

Относительно большая передозировка (200 мг и 105 мг/день в течение 3 дней соответственно) проявлялась только утомляемостью, слабостью и (или) диареей, либо симптомы отсутствовали. У пациентов с передозировкой <140 мг либо с неизвестной дозой наблюдались симптомы со стороны центральной нервной системы (спутанность сознания, гиперсомния, сонливость, вестибулярное головокружение, ажитация, агрессия, галлюцинации, нарушение походки) и (или) желудочно-кишечного тракта (рвота и диарея).

В наиболее тяжелом случае при приеме 2000 мг мемантина пациент выжил, однако наблюдались нарушения со стороны центральной нервной системы: кома в течение 10 дней с последующей диплопией и ажитацией. Пациенту были назначены симптоматическое лечение и плазмаферез. Наступило выздоровление без необратимых последствий.

В другом зарегистрированном случае пациент также выжил и выздоровел. После приема 400 мг мемантина внутрь у него отмечались следующие нарушения со стороны центральной нервной системы: беспокойство, психоз, зрительные галлюцинации, склонность к судорожным реакциям, сонливость, ступор и потеря сознания.

Лечение

В случае передозировки проводят симптоматическое лечение. Специфического антидота от интоксикации или передозировки нет. Следует воспользоваться стандартными терапевтическими мероприятиями для удаления действующего вещества, например, промывание желудка, прием активированного угля (для предотвращения потенциальной рециркуляции в кишечнике и печени), симптоматическая терапия. Устранению передозировки мемантином может способствовать подкисление мочи, форсированный диурез.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

При одновременном применении с препаратами леводопы, антагонистами дофаминовых рецепторов, м-холиноблокаторами действие последних может усиливаться.

При одновременном применении с барбитуратами, нейролептиками действие последних может уменьшаться.

При совместном применении может изменить (усилить или уменьшить) действие дантролена или баклофена, поэтому дозы препаратов следует подбирать индивидуально.

Следует избегать одновременного назначения с амантадином, кетамином, фенитоином

и декстрометорфаном из-за повышения риска развития психоза.

Возможно повышение в плазме уровней циметидина, ранитидина, прокаинамида, хинидина, хинина и никотина при одновременном приеме с мемантином.

Возможно снижение концентрации гидрохлоротиазида при одновременном приеме с мемантином.

Возможно снижение МНО (международное нормализованное отношение) у пациентов, принимающих пероральные антикоагулянты (варфарин).

Мемантин может увеличивать экскрецию гидрохлоротиазида.

Одновременное применение с антидепрессантами, селективными ингибиторами обратного захвата серотонина и ингибиторами моноаминоксидазы требует тщательного наблюдения за пациентами.

Особые указания

Наличие у пациента факторов, влияющих на повышение pH мочи (резкие изменения в питании, например, переход с рациона, включающего продукты животного происхождения, к вегетарианской диете, или интенсивное употребление щелочных желудочных буферов), а также почечный канальцевый ацидоз или тяжелые инфекции мочевыводящих путей, вызванные *Proteus spp.*, требуют тщательного наблюдения за состоянием пациента.

Из большинства клинических исследований пациенты с инфарктом миокарда в анамнезе, декомпенсированной хронической сердечной недостаточностью (III-IV функциональный класс по классификации NYHA), или неконтролируемой артериальной гипертензией были исключены. Поэтому данные о применении мемантина у таких пациентов ограничены, прием препарата должен осуществляться под тщательным наблюдением врача.

У пациентов с болезнью Альцгеймера на стадии умеренной и тяжелой деменции обычно нарушена способность к вождению автотранспорта и управлению сложными механизмами. Кроме того, мемантин может вызывать изменение скорости реакции, поэтому у пациентов, получающих лечение в амбулаторных условиях, следует соблюдать особую осторожность при вождении автотранспорта или управлении механизмами.

Форма выпуска

Раствор для приема внутрь, 10 мг/мл.

По 50 мл или 100 мл во флаконы темного стекла с навинчивающейся полиэтиленовой крышкой с защитным кольцом «первого вскрытия».

Каждый флакон в комплекте с механическим дозатором помещен в картонную пачку с

инструкцией по применению.

Условия хранения

При температуре не выше 25°С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Вскрытый флакон необходимо использовать в течение 3 месяцев.

Не применять препарат после истечения срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Производитель

Медана Фарма Акционерное Общество, Польша.

98-200 Серадз, ул. Польской Организации Войсковой 57.

Юридическое лицо, на имя которого выдано регистрационное удостоверение

Фармацевтический завод «ПОЛЬФАРМА» АО, Польша.

83-200 Старогард Гданьски, ул. Пельплиньска 19.

Организация, принимающая претензии потребителей

Акционерное общество «Химико-фармацевтический комбинат «АКРИХИН» (АО «АКРИХИН»), Россия

142450, Московская область, Ногинский район, г. Старая Купавна, ул. Кирова, д. 29

Телефон/факс: +7 (495) 702-95-03.

Представитель компании В.В. Вербилович