

**ИНСТРУКЦИЯ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ
ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА
АСТРОКС**

Регистрационный номер:

Торговое наименование препарата: Астрокс

Международное непатентованное наименование: Этилметилгидроксипиридина
сукцинат

Лекарственная форма: раствор для внутривенного и внутримышечного введения

Состав:

Действующее вещество:

этилметилгидроксипиридина сукцинат - 50 мг.

Вспомогательные вещества:

натрия дисульфит (натрия пиросульфит) - 0,47 мг

вода для инъекций - до 1 мл.

Описание

Бесцветная или слегка окрашенная прозрачная жидкость.

Фармакотерапевтическая группа: другие средства для лечения заболеваний нервной системы.

Код АТХ: N07XX

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Этилметилгидроксипиридина сукцинат относится к классу 3-оксипиридинов. Оказывает антиоксидантное, антигипоксическое, мембраностабилизирующее, ноотропное, стресспротективное, противосудорожное, анксиолитическое действие. Тормозит процессы перекисного окисления липидов, повышает активность антиоксидантной системы ферментов, восстанавливает нарушенную структуру и функции мембран, оказывает моделирующее действие на ионные каналы, транспорт нейромедиаторов, улучшает синаптическую передачу.

Препарат повышает резистентность организма к воздействию различных повреждающих факторов (шок, гипоксия, ишемия, травма, нарушение мозгового кровообращения, интоксикация алкоголем и антипсихотическими средствами [нейролептиками]), активируя энергосинтезирующие функции митохондрий и улучшая энергетический обмен в клетке. Этилметилгидроксипиридина сукцинат обладает гиполипидемическим действием, уменьшает содержание общего холестерина и липопротеидов низкой плотности. Механизм

действия обусловлен способностью этилметилгидроксипиридина сукцината усиливать компенсаторную активацию аэробного гликолиза, снижать степень угнетения окислительных процессов в цикле Кребса в условиях гипоксии с увеличением содержания аденозинтрифосфата и креатин-фосфата со стабилизацией клеточных мембран.

Этилметилгидроксипиридина сукцинат является ингибитором свободно-радикальных процессов перекисного окисления липидов. Он активирует супероксидоксидазу, оказывает влияние на физико-химические свойства мембраны, повышает содержание полярных фракций липидов (фосфотидилсерина и фосфотидилинозина и др.) в мембране, уменьшает отношение холестерол/фосфолипиды, уменьшает вязкость липидного слоя и увеличивает текучесть мембраны, активирует энергосинтезирующие функции митохондрий и улучшает энергетический обмен в клетке и, таким образом, защищает аппарат клеток и структуру их мембран. Вызываемое этилметилгидроксипиридина сукцинатом изменение функциональной активности биологической мембраны приводит к конформационным изменениям белковых макромолекул синаптических мембран, вследствие чего он оказывает модулирующее влияние на активность мембраносвязанных ферментов, ионных каналов и рецепторных комплексов, в частности, бензодиазепиновый, ГАМК, ацетилхолиновый, усиливая их способность к связыванию с лигандами, повышая активность нейромедиаторов и активацию синаптических процессов.

Фармакокинетика

Всасывание

При однократном и курсовом внутримышечном применении препарата максимальная концентрация этилметилгидроксипиридина сукцината в плазме крови достигается через 0,58 ч. При внутримышечном введении в дозе 400–500 мг максимальная концентрация ($C_{\max}$) в плазме крови 3,5–4 мкг/мл

Распределение

Быстро распределяется в органах и тканях. Среднее время удерживания препарата (MRT) при внутримышечном введении 0,7–1,3 часа

Метаболизм

Метаболизируется в печени путем глюкуронирования. Идентифицировано 5 метаболитов: в печени образуется первый метаболит – 3-оксипиридина фосфат, который в крови под влиянием щелочной фосфатазы распадается на фосфорную кислоту и 3-оксипиридин; второй метаболит образуется в больших количествах и обнаруживается в моче в 1–2 сутки введения препарата, является фармакологически активным; третий метаболит также выводится в больших количествах почками; четвертый и пятый метаболиты представляют собой глюкуронконъюгаты.

Выведение

Выводится из плазмы крови быстро и практически не определяется через 4 часа в ней. Быстро выводится с мочой в основном в виде метаболитов (50 % за 12 часов) и в незначительном количестве – в неизменном виде (0,3 % за 12 часов). Показатели выведения с мочой неизмененного этилметилгидроксипиридина сукцината и метаболитов имеют индивидуальную вариабельность.

Показания к применению

Показан к применению у взрослых в возрасте от 18 лет, в составе комплексной терапии при:

- острые нарушения мозгового кровообращения;
- черепно-мозговая травма, последствия черепно-мозговых травм;
- дисциркуляторная энцефалопатия;
- синдром вегетативной дистонии;
- легкие когнитивные расстройства атеросклеротического генеза;
- тревожные расстройства при невротических и неврозоподобных состояниях;
- острый инфаркт миокарда (с первых суток) в составе комплексной терапии;
- первичная открытоугольная глаукома различных стадий, в составе комплексной терапии;
- купирование абстинентного синдрома при алкоголизме с преобладанием неврозоподобных и вегетативно-сосудистых расстройств;
- острая интоксикация антипсихотическими средствами;
- острые гнойно-воспалительные процессы брюшной полости (острый некротический панкреатит, перитонит) в составе комплексной терапии.

Противопоказания

- аллергия на этилметилгидроксипиридина сукцинат или любые другие компоненты препарата;
- острая печеночная недостаточность;
- острая почечная недостаточность;
- беременность, грудное вскармливание (в связи с недостаточной изученностью действия препарата);
- детский возраст до 18 лет (в связи с отсутствием данных по эффективности и безопасности).

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Препарат противопоказан при беременности и в период грудного вскармливания в связи с недостаточными данными по эффективности и безопасности препарата в данные периоды.

Способ применения и дозы

Внутримышечно или внутривенно (струйно или капельно).

Струйно препарат Астрокс вводят медленно в течение 5–7 мин, капельно – со скоростью 40–60 капель в минуту.

Доза препарата и схема его применения зависят от Вашего заболевания. Максимальная суточная доза не должна превышать 1200 мг.

В составе комплексной терапии

Острые нарушения мозгового кровообращения

Рекомендуемая доза в первые 10–14 дней по 200–500 мг 2–4 раза в сутки внутривенно капельно, затем внутримышечно по 200–250 мг 2–3 раза в сутки в течение 2 недель.

Черепно-мозговая травма и последствия черепно-мозговых травм

Рекомендуемая доза по 200–500 мг 2–4 раза в сутки внутривенно капельно в течение 10–15 дней.

Дисциркуляторная энцефалопатия в фазе декомпенсации

Рекомендуемая доза 200–500 мг 1–2 раза в сутки внутривенно струйно или капельно на 5 протяжении 14 дней. Затем внутримышечно по 100–250 мг в сутки на протяжении последующих 2 недель.

Курсовая профилактика дисциркуляторной энцефалопатии

Рекомендуемая доза 200–250 мг 2 раза в сутки внутримышечно на протяжении 10–14 дней.

Легкие когнитивные нарушения у пациентов пожилого возраста и при тревожных расстройствах

Рекомендуемая доза 100–300 мг 1 раз в сутки внутримышечно на протяжении 14–30 дней.

Острый инфаркт миокарда

Рекомендуется применять препарат внутривенно или внутримышечно в течение 14 суток, на фоне традиционной терапии инфаркта миокарда. В первые 5 суток, для достижения максимального эффекта, препарат рекомендуется вводить внутривенно, последующие 9 суток можно вводить внутримышечно.

Внутривенное введение препарата производят путем капельной инфузии, медленно, в 0,9 % растворе натрия хлорида или 5 % растворе декстрозы (глюкозы) в объеме 100–150 мл в течение 30–90 минут. При необходимости возможно медленное струйное введение продолжительностью не менее 5 минут.

Введение препарата (внутривенное или внутримышечное) осуществляют 3 раза в сутки, через каждые 8 часов. Суточная терапевтическая доза составляет 6–9 мг на кг массы тела, разовая доза – 2–3 мг на кг массы тела. Максимальная суточная доза не должна превышать 800 мг, разовая – 250 мг.

Открытоугольная глаукома различных стадий

Рекомендуемая доза по 100–300 мг в сутки внутримышечно, 1–3 раза в сутки в течение 14 дней.

Абстинентный алкогольный синдром

Рекомендуемая доза 200–500 мг внутривенно капельно или внутримышечно 2–3 раза в сутки в течение 5–7 дней.

Острая интоксикация антипсихотическими средствами

Рекомендуемая доза 200–500 мг в сутки внутривенно на протяжении 7–14 дней.

Острые гнойно-воспалительные процессы брюшной полости (острый некротический панкреатит, перитонит)

Препарат назначают в первые сутки как в предоперационном, так и в послеоперационном периоде. Вводимые дозы зависят от формы и тяжести заболевания, распространенности процесса, вариантов клинического течения. Отмена препарата должна производиться постепенно только после устойчивого положительного клинико-лабораторного эффекта.

Острый отечный (интерстициальный) панкреатит

Рекомендуемая доза по 200–500 мг 3 раза в день, внутривенно капельно (в 0,9 % растворе натрия хлорида) и внутримышечно.

Некротический панкреатит

При легкой степени тяжести рекомендуемая доза по 100–200 мг 3 раза в день внутривенно капельно (в 0,9 % растворе натрия хлорида) и внутримышечно.

При средней степени тяжести – по 200 мг 3 раза в день, внутривенно капельно (в 0,9 % растворе натрия хлорида).

При тяжелом течении рекомендуется применять в пульс-дозировке 800 мг в первые сутки, при двукратном режиме введения; далее по 200–500 мг 2 раза в день с постепенным снижением суточной дозы.

При крайне тяжелом течении рекомендуемая начальная дозировка 800 мг в сутки до стойкого купирования проявлений панкреатогенного шока, по стабилизации состояния по 300–500 мг 2 раза в день внутривенно капельно (в 0,9 % растворе натрия хлорида) с постепенным снижением суточной дозировки.

Особых мер предосторожности перед применением препарата или при обращении с ним не требуется.

Побочное действие

Во избежание возникновения нежелательных реакций рекомендуется соблюдать режим дозирования и скорость введения препарата.

Нежелательные реакции представлены в соответствии с поражением органов и систем органов в последовательности медицинского словаря для нормативно-правовой деятельности (MedDRA). Частота возникновения распределялась в соответствии со следующими категориями: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, но $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1\ 000$, но $< 1/100$), редко ($\geq 1/10\ 000$, но $< 1/1\ 000$), очень редко ($< 1/10\ 000$), частота неизвестна (на основании имеющихся данных оценить невозможно).

Нарушения со стороны иммунной системы: очень редко – анафилактический шок, ангионевротический отек, крапивница.

Психические нарушения: очень редко – сонливость.

Нарушения со стороны нервной системы: очень редко – головная боль, головокружение (может быть связано с чрезмерно высокой скоростью введения и носит кратковременный характер).

Нарушения со стороны сосудов: очень редко – понижение артериального давления, повышение артериального давления (может быть связано с чрезмерно высокой скоростью введения и носит кратковременный характер).

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: очень редко – сухой кашель, першение в горле, дискомфорт в грудной клетке, затруднение дыхания (может быть связано с чрезмерно высокой скоростью введения и носит кратковременный характер).

Желудочно-кишечные нарушения: очень редко – сухость во рту, тошнота, ощущение неприятного запаха, металлический привкус во рту.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: очень редко – зуд, сыпь, гиперемия.

Общие нарушения и реакции в месте введения: очень редко – ощущение тепла.

Передозировка

Симптомы

В связи с низкой токсичностью передозировка маловероятна. При случайной передозировке возможно возникновение сонливости и седации. При внутривенном введении возможно повышение артериального давления.

Лечение

Как правило, не требуется - симптомы исчезают самостоятельно в течение суток. В тяжелых случаях при бессоннице рекомендуется применение одного из снотворных и анксиолитических средств для приема внутрь (нитразепам 10 мг, оксазепам 10 мг или диазепам 5 мг). При чрезмерном повышении артериального давления применяют гипотензивные средства под контролем артериального давления.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

Усиливает действие бензодиазепиновых анксиолитиков, противоэпилептических (карбамазепин), противопаркинсонических (леводопа) лекарственных средств, нитратов. Уменьшает токсическое действие этанола.

Особые указания

В отдельных случаях, особенно у предрасположенных пациентов с бронхиальной астмой при повышенной чувствительности к сульфитам, возможно развитие тяжелых реакций гиперчувствительности.

Вспомогательные вещества

Препарат содержит натрия метабисульфит (натрия дисульфит, E223), который может изредка вызывать тяжелые реакции гиперчувствительности и бронхоспазм.

Данный препарат содержит менее 1 ммоль (23 мг) натрия на 1 мл, то есть, по сути, не содержит натрия.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Раствор для внутривенного и внутримышечного введения 50 мг/мл.

По 2 мл, 5 мл или 10 мл в ампулы нейтрального стекла.

По 10 ампул вместе с инструкцией по применению помещают в коробку картонную.

По 5 или 10 ампул помещают в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой или бумаги с полиэтиленовым покрытием или без фольги, или без бумаги.

1 или 2 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по применению помещают в пачку картонную.

Упаковка для стационаров.

По 6, 10, 12, 20, 50 контурных ячейковых упаковок по 5 ампул с равным количеством инструкций по применению помещают в коробку картонную.

Условия хранения

Хранить в защищенном от света месте при температуре от 2 до 25°C.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

5 лет.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Наименование юридического лица, на имя которого выдано регистрационное удостоверение

Общество с ограниченной ответственностью «Формула-ФР» (ООО «Формула-ФР»),
109443, Россия, г. Москва, Волгоградский проспект, д.139, оф. 10

Телефон: 8 (495) 740-87-38

Производитель/Организация, принимающая претензии

АО «Новосибхимфарм»

630028, Россия, Новосибирская обл., г. Новосибирск,

ул. Декабристов, 275

тел. 8 (383) 363-32-44;

факс 8 (383) 363-32-55.