МИНЗДРАВ РОССИИ
ЛП-006793-180221
СОГЛАСОВАНО

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

МЕКСИДОНИУМ

Регистрационный номер:

Торговое наименование препарата: МЕКСИДОНИУМ

Международное непатентованное или группировочное наименование: этилметилгидроксипиридина сукцинат

Лекарственная форма: раствор для внутривенного и внутримышечного введения

Состав

1 мл содержит:

Действующее вещество: этилметилгидроксипиридина сукцинат – 50,0 мг.

Вспомогательные вещества: натрия дисульфит, вода для инъекций.

Описание: прозрачный, бесцветный или слегка желтоватый раствор.

Фармакотерапевтическая группа: антиоксидантное средство.

Код АТХ: N07XX

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Этилметилгидроксипиридина сукцинат относится к классу 3-оксипиридинов, является ингибитором свободнорадикальных процессов, мембранопротектором. Обладает также антигипоксическим действием, повышает устойчивость организма к стрессу.

Механизм действия этилметилгидроксипиридина сукцината обусловлен его антиоксидантным и мембранопротекторным действием. Препарат ингибирует перекисное окисление липидов, повышает активность супероксидоксидазы, повышает соотношение липид-белок, улучшает структуру и функцию мембраны клеток.

Этилметилгидроксипиридина сукцинат моделирует активность мембраносвязанных ферментов (кальций-независимой фосфодиэстеразы, аденилатциклазы, ацетилхолинэстеразы), рецепторных комплексов (бензодиазепинового, гамма-аминомасляная кислота (ГАМК), ацетилхолинового), что усиливает их способность связывания с лигандами, способствует сохранению структурно-функциональной организации биомембран, транспорта нейромедиаторов и улучшению синаптической передачи. Этилметилгидроксипиридина сукцинат повышает содержание в головном мозге дофамина. Вызывает усиление компенсаторной

активации аэробного гликолиза и снижение степени угнетения окислительных процессов в цикле Кребса в условиях гипоксии с увеличением содержания аденозинтрифосфорной кислоты (АТФ) и креатинфосфата, активацию энергосинтезирующих функций митохондрий.

Повышает резистентность организма к воздействию различных повреждающих факторов при патологических состояниях (гипоксия и ишемия, нарушение мозгового кровообращения, интоксикация этанолом и антипсихотическими лекарственными средствами).

В условиях критического снижения коронарного кровотока способствует сохранению структурно-функциональной организации мембран кардиомиоцитов, стимулирует активность мембранных ферментов - фосфодиэстеразы, аденилатциклазы, ацетилхолинэстеразы. Поддерживает развивающуюся при острой ишемии активацию ацетилхолинэстеразы. Поддерживает развивающуюся при острой ишемии активацию аэробного гликолиза и способствует в условиях гипоксии восстановлению митохондриальных окислительно-восстановительных процессов, увеличивает синтез АТФ и креатинфосфата. Обеспечивает целостность морфологических структур и физиологических функций ишемизированного миокарда. Улучшает клиническое течение инфаркта миокарда, повышает эффективность проводимой терапии, снижает частоту возникновения аритмии и нарушений внутрисердечной проводимости.

Нормализует метаболические процессы в ишемизированном миокарде, повышает антиангинальную активность нитратов, улучшает реологические свойства крови, уменьшает последствия реперфузионного синдрома при острой коронарной недостаточности.

Способствует сохранению ганглиозных клеток сетчатки и волокон зрительного нерва при прогрессирующей нейропатии, причинами которой являются хроническая ишемия и гипоксия. Улучшает функциональную активность сетчатки и зрительного нерва, увеличивая остроту зрения.

Уменьшает ферментативную токсемию и эндогенную интоксикацию при остром панкреатите.

Улучшает метаболизм и кровоснабжение головного мозга, микроциркуляцию и реологические свойства крови, уменьшает агрегацию тромбоцитов. Стабилизирует мембраны клеток крови (эритроцитов и тромбоцитов), снижая вероятность развития гемолиза. Обладает гиполипидемическим действием, за счет уменьшения содержания общего холестерина и липопротеидов низкой плотности.

Фармакокинетика

Всасывание

При однократном и курсовом приеме максимальная концентрация (C_{max}) в плазме крови достигается через 0,58 ч. При введении в дозе 400-500 мг (C_{max}) в плазме крови – 3,5-4 мкг/мл.

Распределение

Быстро распределяется в органах и тканях. Среднее время удерживания этилметилгидроксипиридина сукцината в организме – 0,7-1,3 ч.

Метаболизм

Метаболизируется в печени путем глюкуронирования. Идентифицировано 5 метаболитов: 3-оксипиридина фосфат – образуется в печени и при участии щелочной фосфатазы распадается на фосфорную кислоту и 3-оксипиридин; 2-й метаболит – фармакологически активный, образуется в больших количествах и обнаруживается в моче на 1-2 сут после введения; 3-й – выводится в больших количествах с мочой; 4-й и 5-й – 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 ч) и в незначительном количестве – в неизмененном виде (0,3 % за 12 ч). Показатели выведения с мочой неизмененного этилметилгидроксипиридина сукцината и метаболитов имеют индивидуальную вариабельность.

Показания к применению

В составе комплексной терапии:

- острые нарушения мозгового кровообращения;
- черепно-мозговая травма, последствия черепно-мозговых травм;
- дисциркуляторная энцефалопатия;
- синдром вегетативной (нейроциркуляторной) 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 лекарственными средствами;
- острые гнойно-воспалительные процессы брюшной полости (острый некротический панкреатит, перитонит) в составе комплексной терапии.

Противопоказания

- повышенная индивидуальная чувствительность к препарату;

- острая печеночная и/или почечная недостаточность;

- детский возраст;

- беременность;

- период грудного вскармливания – в связи с отсутствием данных по эффективности и безопасности.

С осторожностью

Аллергические заболевания и реакции в анамнезе, в том числе повышенная чувствительность к сульфитам.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

В экспериментальных исследованиях не выявлено тератогенного, мутагенного эмбриотоксического действия. Адекватных и строго контролируемых клинических исследований при беременности и в период грудного вскармливания не проводилось. Препарат противопоказан при беременности и в период грудного вскармливания в связи с недостаточностью данных по эффективности и безопасности препарата в данные периоды.

Способ применения и дозы

Внутримышечно или внутривенно (струйно или капельно). При инфузионном способе введения препарат следует разводить в 0,9 % растворе натрия хлорида.

Дозы подбирают индивидуально.

Струйно вводят медленно в течение 5-7 минут, капельно со скоростью 40-60 капель в минуту. Максимальная суточная доза не должна превышать 1200 мг.

При острых нарушениях мозгового кровообращения применяют в комплексной терапии в первые 10-14 дней – внутривенно капельно по 200-500 мг 2-4 раза в сутки, затем внутримышечно по 200-250 мг 2-3 раза в сутки в течение 2 недель.

При черепно-мозговой травме и последствиях черепно-мозговых травм препарат применяют в течение 10-15 дней внутривенно капельно по 200-500 мг 2-4 раза в сутки.

При дисциркуляторной энцефалопатии в фазе декомпенсации препарат применяют внутривенно струйно или капельно в дозе 200-500 мг 1-2 раза в сутки на протяжении 14 дней. Затем внутримышечно по 100-250 мг в сутки в течение последующих двух недель.

Для курсовой профилактики дисциркуляторной энцефалопатии вводят внутримышечно в дозе 200-250 мг 2 раза в сутки в течение 10-14 дней.

При нейроциркуляторной дистонии, невротических и неврозоподобных состояниях препарат вводят внутримышечно по 50-400 мг в сутки в течение 14 дней.

При легких когнитивных нарушениях у пациентов пожилого возраста и при тревожных расстройствах препарат применяют внутримышечно в дозе 100-300 мг в сутки в течение 14-30 дней.

При остром инфаркте миокарда в составе комплексной терапии препарат вводят внутривенно или внутримышечно в течение 14 суток, на фоне стандартной терапии инфаркта миокарда (включающей нитраты, бета-адреноблокаторы, ингибиторы ангиотензинпревращающего фермента (АПФ), тромболитики, антикоагулянтные и антиагрегантные средства, а также симптоматические средства по показаниям).

В первые 5 суток для достижения максимального эффекта препарат вводят внутривенно, в последующие 9 суток препарат может вводиться внутримышечно.

Внутривенное введение препарата проводят путем капельной инфузии, медленно (во избежание побочных эффектов) в течение 30-90 минут (в 100-150 мл 0,9 % раствора натрия хлорида или 5 % раствора декстрозы (глюкозы)), при необходимости возможно медленное струйное внутривенное введение препарата, продолжительностью не менее 5 минут.

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

При открытоугольной глаукоме различных стадий, в составе комплексной терапии вводят внутримышечно по 100-300 мг в сутки, 1-3 раза в сутки в течение 14 дней.

При абстинентном алкогольном синдроме препарат вводят внутримышечно или внутривенно капельно в дозе 200-500 мг 2-3 раза в сутки в течение 5-7 дней.

При острой интоксикации антипсихотическими лекарственными средствами препарат вводят внутривенно в дозе 200-500 мг в сутки в течение 7-14 дней.

При острых гнойно-воспалительных процессах 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.

При остром отечном (интерстициальном) панкреатите препарат назначают по 200-500 мг 3 раза в день, внутривенно капельно (в 0,9 % растворе натрия хлорида) и внутримышечно.

Легкая степень тяжести некротического панкреатита – по 100-200 мг 3 раза в день, внутривенно капельно (в 0,9 % растворе натрия хлорида) и внутримышечно. *Средняя степень тяжести* – по 200 мг 3 раза в день, внутривенно капельно (в 0,9 % растворе натрия хлорида). *Тяжелое течение* – в дозировке 800 мг в первые сутки, при двукратном режиме введения; далее по 200-500 мг 2 раза в день с постепенным снижением суточной дозы.

Крайне тяжелое течение – в начальной дозировке 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.

Побочное действие

Во избежание возникновения побочных эффектов рекомендуется соблюдать режим дозирования и скорость введения препарата. Частота побочных эффектов была определена в соответствии с классификацией Всемирной Организации Здравоохранения (ВОЗ): очень часто (≥10 %), часто (≥1 %, <10 %), нечасто (≥0,1 %, <1 %); редко (≥0,01 %, <0,1 %) и очень редко, включая отдельные сообщения (<0,01%) частота неизвестна (по имеющимся данным, частоту определить не представляется возможным).

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 (АД), повышение АД (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 нарушение сна (бессонница), в некоторых случаях сонливость и седация. При внутривенном введении возможно повышение артериального давления.

Лечение

Как правило, не требуется – симптомы исчезают самостоятельно в течение суток. В особо 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 средствами

Усиливает действие бензодиазепиновых анксиолитиков, противоэпилептических (карбамазепин), противопаркинсонических (леводопа) лекарственных средств.

Уменьшает токсическое действие этанола.

Особые указания

Препарат не назначают детям до 18 лет в связи с недостаточной изученностью действия препарата.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, 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 препарата в ампулы нейтрального бесцветного или светозащитного стекла. На ампулы дополнительно может быть нанесено одно, два или три цветных кольца.

5 ампул помещают в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и пленки полимерной, или без пленки полимерной.

1, 2 контурные ячейковые упаковки помещают в пачку из картона.

В каждую пачку вкладывают инструкцию по применению и скарификатор ампульный. Скарификатор ампульный не вкладывают при использовании ампул с кольцом излома или с надрезом и точкой.

Условия хранения

При температуре не выше 25 °С, в оригинальной упаковке (в пачке картонной).

Хранить в местах, недоступных для детей.

Срок годности

2 года.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Юридическое лицо, на имя которого выдано регистрационное удостоверение

Общество с ограниченной ответственностью «Брайт Вэй» (ООО «Брайт Вэй»), Россия 125239, г. Москва, ул. Коптевская, 83/1, офис 16

Производитель/Организация, принимающая претензии

Общество с ограниченной ответственностью «Велфарм» (ООО «Велфарм»), Россия

Курганская обл., г. Курган, проспект Конституции, д. 11

Тел.: (3522) 48-60-00

e-mail: fsk@velpharm.ru

Сообщить о нежелательных реакциях препарата можно по телефону (3522) 55-51-80 или на сайте: www.brightway.ru, в разделе «VELPHARM» – «Фармаконадзор».

Представитель фирмы М.А. Пишке