МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

ЭТИЛМЕТИЛГИДРОКСИПИРИДИНА СУКЦИНАТ

МИНЗДРАВ РОССИИ
ЛП-005367-221019
СОГЛАСОВАНО

Регистрационный номер

Торговое наименование

Этилметилгидроксипиридина сукцинат

Международное непатентованное или группировочное наименование

Этилметилгидроксипиридина сукцинат

Лекарственная форма

Раствор для внутривенного и внутримышечного введения

Состав

на 1 мл раствора:

Действующее вещество: этилметилгидроксипиридина сукцинат 50 мг.

Вспомогательное вещество: вода для инъекций.

Описание

Бесцветная или слегка окрашенная прозрачная жидкость.

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,

118665

ацетилхолинэстеразы), рецепторных комплексов (бензодиазепинового, 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 и аэробного гликолиза, 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.

118665

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 неизменном 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);
- первичная открытоугольная глаукома различных стадий;

МИНЗДРАВ РОССИИ
ЛП-003057-221019
СОГЛАСОВАНО

- 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).

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. Строго контролируемых клинических исследований безопасности применения препарата этилметилгидроксипиридина сукцината при беременности и кормлении грудью 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 (в/м) или внутривенно (в/в) (струйно или капельно). При инфузионном способе введения препарат следует разводить в 0,9 % растворе натрия хлорида.

Дозы подбирают индивидуально.

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

При острых нарушениях мозгового кровообращения Этилметилгидроксипиридина сукцинат применяют в первые 10-14 дней – в/в капельно по 200-500 мг 2-4 раза в сутки, затем в/м по 200-250 мг 2-3 раза в сутки в течение 2 недель.

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

118665

При дисциркуляторной энцефалопатии в фазе декомпенсации Этилметилгидроксипиридина сукцинат следует назначать в/в струйно или капельно в дозе 200-500 мг 1-2 раза в сутки на протяжении 14 дней. Затем в/м по 100-250 мг/сут в течение последующих 2 недель.

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

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

При легких когнитивных нарушениях у больных пожилого возраста и при тревожных расстройствах препарат применяют в/м в суточной дозе 100-300 мг/сут в течение 14-30 дней.

При остром инфаркте миокарда в составе комплексной терапии Этилметилгидроксипиридина сукцинат 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 Этилметилгидроксипиридина сукцинат может вводиться внутримышечно. Внутривенное введение препарата проводят путем капельной инфузии, медленно (во избежание побочных эффектов), на 0,9 % растворе натрия хлорида или 5 % растворе декстрозы (глюкозы) в объеме 100-150 мл в течение 30-90 мин. При необходимости возможно медленное струйное введение препарата продолжительностью не менее 5 минут.

Введение препарата (внутривенное или внутримышечное) осуществляют 3 раза в сутки, через каждые 8 ч. Суточная терапевтическая доза составляет 6-9 мг/кг массы тела в сутки, 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 Этилметилгидроксипиридина сукцинат вводят внутримышечно по 100-300 мг/сутки 1-3 раза в сутки в течение 14 дней.

При абстинентном алкогольном синдроме Этилметилгидроксипиридина сукцинат вводят в дозе 200-500 мг в/в капельно или в/м 2-3 раза в сутки в течение 5-7 дней.

118665

При острой интоксикации антипсихотическими средствами препарат вводят в/в в дозе 200-500 мг/сут на протяжении 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 Этилметилгидроксипиридина сукцинат назначают по 200-500 мг 3 раза в день, в/в капельно (в 0,9 % растворе натрия хлорида) и в/м.

Легкая степень тяжести некротического панкреатита – по 100-200 мг 3 раза в день в/в капельно (в 0,9 % растворе натрия хлорида) и в/м.

Средняя степень тяжести – по 200 мг 3 раза в день, в/в 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/сут до стойкого купирования проявлений панкреатогенного шока, по стабилизации состояния по 300-500 мг 2 раза в день в/в капельно (в 0,9 % растворе натрия хлорида) с постепенным снижением суточной дозировки.

Побочное действие

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, сухость слизистой оболочки полости рта или металлический привкус во рту, метеоризм, диарея.

Со стороны нервной системы: сонливость, нарушение засыпания.

Со стороны дыхательной системы: першение в горле, дискомфорт в грудной клетке, ощущение нехватки воздуха (как правило, связано с чрезмерно высокой скоростью введения и носит кратковременный характер).

Со стороны сердечно-сосудистой системы: кратковременное повышение артериального давления.

Прочие: аллергические реакции, ощущение «разливающегося» тепла во всем теле, неприятный запах.

Передозировка

В связи с низкой токсичностью передозировка маловероятна.

Симптомы: нарушения сна (бессонница, в некоторых случаях – сонливость); при внутривенном введении – незначительное и кратковременное (до 1,5-2 ч) повышение артериального давления.

Лечение: как правило, не требуется – симптомы исчезают самостоятельно в течение суток. В тяжелых случаях при бессоннице – нитразепам 10 мг, оксазепам 10 мг или диазепам 5 мг. При чрезмерном повышении артериального давления – гипотензивные лекарственные средства под контролем артериального давления.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Усиливает действие бензодиазепиновых анксиолитиков, противоэпилептических средств (карбамазепина), противопаркинсонических средств (леводопа). Уменьшает токсические эффекты этилового спирта.

Особые указания

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

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 занятиях 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, 5 или 10 мл в ампулы стеклянные шприцевого наполнения с пережимом типа «В», номинальной вместимостью 2, 5 или 10 мл, соответственно, из бесцветного стекла 1-го гидролитического класса, с надрезом и белой точкой.

На каждую ампулу наклеивают самоклеящуюся этикетку.

По 5 ампул помещают в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной.

По 1 или 2 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по медицинскому применению помещают в пачку из картона для потребительской тары.

По 4, 10 или 20 контурных ячейковых упаковок из плёнки поливинилхлоридной вместе с равным количеством инструкций по медицинскому применению помещают в ящик из гофрированного картона (для стационаров).

Условия хранения

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

ЛП-005007-221019
СОГЛАСОВАНО
118665

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

6 месяцев.

Не применять препарат по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Производитель/организация, принимающая претензии

АО «Биннофарм», Россия

124460, г. Москва, г. Зеленоград, ул. Конструктора Гуськова, д. 3, стр. 1.

Тел.: (495) 646-28-68, (495) 510-32-88.

www.binnopharm.ru

Директор по регуляторике и исследованиям **Сетдекова Г.У.**

АКЦИОНЕРНОЕ ОБЩЕСТВО "Биннофарм" Для документов МОСКВА ОГРН 1067746287827

МЗ РФ ФГБУ НЦЭСМП ЭКСПЕРТНЫЙ ОТЧЕТ ДЕЙСТВИТЕЛЕН ДЛЯ ДАННОЙ ВЕРСИИ ДОКУМЕНТА 0 0 0 0 0 0 0 0 0 1 4

МИНЗДРАВ РОССИИ ЛП-005807-221019 СОГЛАСОВАНО

118665