

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Метостабил

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Метостабил

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.

Вспомогательное вещество: вода для инъекций – до 1,0 мл.

Описание: бесцветная или слегка желтоватая прозрачная жидкость.

Фармакотерапевтическая группа: другие средства для лечения заболеваний нервной системы.

Код АТХ: N07XX

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Механизм действия этилметилгидроксипиридина сукцината обусловлен его антигипоксантным, антиоксидантным и мембранопротекторным действием. Он ингибирует процессы перекисного окисления липидов, повышает активность супероксиддисмутазы, повышает соотношение липид-белок, уменьшает вязкость мембраны, увеличивает ее текучесть. Модулирует активность мембраносвязанных ферментов (кальций-независимая фосфодиэстераза, аденилатциклаза, ацетилхолинэстераза), рецепторных комплексов (бензодиазепиновый, гамма-аминомасляной кислоты (ГАМК), ацетилхолиновый), что усиливает их способность связывания с лигандами, помогает сохранению структурно-функциональной организации биомембран, транспорта нейромедиаторов и улучшению синаптической передачи. Этилметилгидроксипиридина сукцинат повышает содержание дофамина в головном мозге. Вызывает усиление компенсаторной активности аэробного гликолиза и снижение

степени угнетения окислительных процессов в цикле Кребса в условиях гипоксии с увеличением содержания аденозинтрифосфата (АТФ), креатинфосфата и активацией энергосинтезирующих функций митохондрий, стабилизацию клеточных мембран.

Этилметилгидроксипиридина сукцинат оказывает антигипоксическое, мембранопротекторное, ноотропное, противосудорожное, анксиолитическое действие, повышает устойчивость организма к стрессу. Препарат повышает резистентность организма к воздействию основных повреждающих факторов, к кислородзависимым патологическим состояниям (шок, гипоксия и ишемия, нарушение мозгового кровообращения, интоксикация алкоголем и антипсихотическими препаратами (нейролептиками)). Стабилизирует мембранные структуры клеток крови (эритроциты и тромбоциты) при гемолизе.

Этилметилгидроксипиридина сукцинат улучшает мозговой метаболизм и кровоснабжение головного мозга, улучшает микроциркуляцию и реологические свойства крови, уменьшает агрегацию тромбоцитов. Оказывает гиполипидемическое действие, уменьшает уровень общего холестерина и липопротеинов низкой плотности (ЛПНП).

Этилметилгидроксипиридина сукцинат нормализует метаболические процессы в ишемизированном миокарде, уменьшает зону некроза, восстанавливает и улучшает электрическую активность и сократимость миокарда, а также увеличивает коронарный кровоток в зоне ишемии, уменьшает последствия реперфузионного синдрома при острой коронарной недостаточности. Повышает антиангинальную активность нитропрепаратов.

Этилметилгидроксипиридина сукцинат 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.

Фармакокинетика

Абсорбция

При внутримышечном введении определяется в плазме крови на протяжении 4 ч после введения. Время достижения максимальной концентрации (T_{max}) – 0,45–0,5 ч. Максимальная концентрация (C_{max}) при введении дозы 400–500 мг составляет 3,5–4,0 мкг/мл.

Распределение

Быстро переходит из кровяного русла в органы и ткани и быстро элиминирует из организма.

Время удержания препарата (MRT) составляет 0,7–1,3 ч.

Биотрансформация

Метаболизируется в печени путем глюкуронконъюгирования. Идентифицировано 5 метаболитов: 3-оксипиридина фосфат – образуется в печени, 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 сутки после введения; 3-й – выводится в больших количествах с мочой; 4-й и 5-й – глюкуронконъюгаты.

Элиминация

Препарат выводится в основном с мочой, в основном в глюкуронконъюгированной форме и в незначительных количествах в неизменном виде.

Данные доклинической безопасности

В доклинических данных, полученных по результатам стандартных исследований фармакологической безопасности, токсичности при многократном введении, генотоксичности, канцерогенного потенциала, репродуктивной и онтогенетической токсичности, особый вред для человека не выявлен.

Показания к применению

Препарат Метостабил показан к применению у взрослых в возрасте от 18 лет в составе комплексной терапии по показаниям:

- острые нарушения мозгового кровообращения;
- черепно-мозговая травма, последствия черепно-мозговых травм;
- дисциркуляторная энцефалопатия;
- хроническая ишемия мозга;
- синдром вегетативной дистонии;
- легкие (умеренные) когнитивные расстройства;
- 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

- гиперчувствительность к этилметилгидроксипиридина сукцинату;
- острая почечная недостаточность;
- острая печеночная недостаточность;
- беременность, грудное вскармливание (в связи недостаточной изученностью действия препарата);
- дети в возрасте до 18 лет.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Беременность

Препарат Метостабил противопоказан при беременности.

Лактация

Препарат Метостабил противопоказан в период грудного вскармливания.

Способ применения и дозы

Внутримышечно (в/м) или внутривенно (в/в) (струйно или капельно).

При инфузионном способе введения препарат следует разводить в 100–150 мл 0,9 % раствора натрия хлорида или 5 % раствора декстрозы (глюкозы).

Струйно препарат Метостабил 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 препарат Метостабил 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, после чего рекомендован переход на прием пероральных лекарственных форм.

При черепно-мозговой травме и последствиях черепно-мозговых травм препарат Метостабил применяют в течение 10–15 дней в/в капельно по 200–500 мг 2–4 раза в сутки, после чего рекомендован переход на прием пероральных лекарственных форм.

При дисциркуляторной энцефалопатии в фазе декомпенсации препарат Метостабил 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 в сутки на протяжении последующих 2 недель, после чего рекомендован переход на прием пероральных лекарственных форм.

Для курсовой профилактики дисциркуляторной энцефалопатии препарат Метостабил вводят в/м в дозе 200–250 мг 2 раза в сутки на протяжении 10–14 дней, после чего рекомендован переход на прием пероральных лекарственных форм.

При хронической ишемии мозга препарат Метостабил следует назначать по 10 мл (500 мг) 1 раз в сутки в/в капельно или в/в струйно медленно на протяжении 14 дней, после чего рекомендован переход на прием пероральных лекарственных форм.

При легких (умеренных) когнитивных расстройствах препарат Метостабил следует назначать по 10 мл (500 мг) 1 раз в сутки в/в капельно или в/в струйно медленно на протяжении 14 дней, после чего рекомендован переход на прием пероральных лекарственных форм.

При тревожных расстройствах препарат Метостабил применяют в/м в суточной дозе 100–300 мг в сутки на протяжении 14–30 дней, после чего рекомендован переход на прием пероральных лекарственных форм.

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

В первые 5 суток для достижения максимального эффекта препарат желательно вводить в/в, в последующие 9 суток препарат Метостабил может вводиться в/м.

Внутривенное введение препарата производят 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 минут. 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 часов. 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 препарат Метостабил вводят в/м по 100–300 мг в сутки, 1–3 раза в сутки в течение 14 дней.

При абстинентном алкогольном синдроме препарат Метостабил вводят в дозе 200–500 мг в/в капельно или в/м 2–3 раза в сутки в течение 5–7 дней.

При острой интоксикации антипсихотическими средствами препарат Метостабил вводят в/в в дозе 200–500 мг в сутки на протяжении 7–14 дней.

При острых гнойно-воспалительных процессах брюшной полости (острый некротический панкреатит, перитонит) препарат Метостабил 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 Метостабил 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 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.

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 в/в капельно (в 0,9 % растворе натрия хлорида) с постепенным снижением суточной дозировки.

Побочное действие

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

Частота нежелательных реакций определялась 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* (не может быть оценена на основе имеющихся данных).

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

Сонливость, бессонница.

Лечение

В связи с низкой токсичностью передозировка маловероятна. Лечение, как правило, не требуется, симптомы исчезают самостоятельно в течение суток. При выраженных проявлениях проводится поддерживающее и симптоматическое лечение.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Усиливает действие бензодиазепиновых анксиолитиков, противосудорожных средств (карбамазепин) и 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 и бронхоспазма.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

В период приема препарата следует соблюдать осторожность при работе, требующей быстроты психофизических реакций (управление транспортными средствами, механизмами и т.п.).

Форма выпуска

Раствор для внутривенного и внутримышечного введения 50 мг/мл.

По 2 мл или 5 мл препарата в ампулы светозащитного нейтрального стекла первого гидролитического класса с цветной точкой и насечкой или с цветным кольцом излома. На ампулы дополнительно может наноситься одно цветное кольцо.

По 5 ампул помещают в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной. 1 или 2 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по медицинскому применению помещают в картонную упаковку (пачку).

Условия хранения

При температуре не выше 25 °С в оригинальной упаковке (пачке). Не замораживать. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Держатель регистрационного удостоверения

ООО «Атолл»

Россия, 445351, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.

Производитель

ООО «Озон»

Россия, Самарская обл., г.о. Жигулевск, г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.

Организация, принимающая претензии потребителей

ООО «Озон»

Россия, 445351, Самарская обл., г.о. Жигулевск, г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.

Тел.: +79874599991, +79874599992

E-mail: ozon@ozon-pharm.ru