

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ
ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению лекарственного препарата
АСТРОКС

Регистрационный номер: ЛП-001701

Торговое наименование: АСТРОКС

Международное непатентованное или группировочное наименование:
этилметилгидроксипиридина сукцинат

Лекарственная форма: раствор для внутривенного и внутримышечного введения

Состав:

действующее вещество - этилметилгидроксипиридина сукцинат - 50 мг,
вспомогательное вещество - вода для инъекций - до 1 мл.

Описание: прозрачная бесцветная или слегка окрашенная жидкость красноватого, коричневатого-желтоватого или желтоватого оттенка цвета

Фармакотерапевтическая группа: антиоксидантное средство

Код АТХ: N07XX

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Этилметилгидроксипиридина сукцинат относится к классу 3-оксипиридинов и оказывает антиоксидантное, антигипоксическое, мембранопротекторное, ноотропное, противосудорожное, анксиолитическое действие, повышает устойчивость организма к стрессу. Этилметилгидроксипиридина сукцинат 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)). Этилметилгидроксипиридина сукцинат улучшает мозговой метаболизм и кровоснабжение головного мозга, улучшает микроциркуляцию и реологические свойства крови, уменьшает агрегацию тромбоцитов. Стабилизирует мембранные структуры клеток крови (эритроциты и тромбоциты) при гемолизе. Оказывает гиполипидемическое действие, уменьшает уровень общего холестерина и липопротеидов низкой плотности. Уменьшает ферментативную токсемию и эндогенную интоксикацию при остром панкреатите.

Механизм действия этилметилгидроксипиридина сукцината обусловлен его антигипоксантным, антиоксидантным и мембранопротекторным действием. Он ингибирует процессы перекисного окисления липидов, повышает активность супероксиддисмутаза, повышает соотношение липид-белок, уменьшает вязкость мембраны, увеличивает ее текучесть. Модулирует активность мембраносвязанных ферментов (кальцийнезависимая фосфодиэстераза, аденилатциклаза, ацетилхолинэстераза), рецепторных комплексов (бензодиазепиновый, 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 АТФ, креатинфосфата и активацией энергосинтезирующих функций митохондрий, стабилизацию клеточных мембран. 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.

Фармакокинетика

При однократном и курсовом применении АСТРОКСА максимальная концентрация 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. Быстро распределяется в органах и тканях. Время удерживания препарата (MRT) - 0,7-1,3 часа. В то же время АСТРОКС быстро выводится из плазмы крови и через 4 ч. практически не определяется в ней. Фармакокинетические профили достоверно не отличаются как при однократном, так и при постоянном введении. Метаболизируется в печени путем глюкуронирования. Идентифицировано 5 метаболитов: в печени образуется 1-й метаболит - фосфат 3-оксипиридина — который в крови под влиянием щелочной фосфатазы распадается на фосфорную кислоту и 3-оксипиридин; 2-й метаболит образуется в больших количествах и обнаруживается в моче в 1-2 сутки введения препарата, является фармакологически активным; 3-й метаболит также выводится в больших количествах с мочой; 4-й и 5-й метаболиты представляют собой глюкуронконъюгаты. Выводится с мочой, как в неизменном виде, так и в виде глюкуронконъюгатов.

Показания для применения

В составе комплексной терапии:

- острое нарушение мозгового кровообращения,
- черепно-мозговая травма, последствия черепно-мозговых травм,
- дисциркуляторная энцефалопатия (в т.ч. атеросклеротического генеза),
- синдром вегетативной (нейроциркуляторной) дистонии,
- интеллектуально-мнестические нарушения различного генеза (в т.ч. нарушения памяти у лиц пожилого возраста),

- тревожные расстройства при невротических и неврозоподобных состояниях,
- острый инфаркт миокарда (с первых суток),
- первичная открытоугольная глаукома различных стадий,
- купирование абстинентного синдрома при алкоголизме с преобладанием в клинической картине неврозоподобных и вегетативно-сосудистых расстройств,
- острая интоксикация антипсихотическими средствами.

Противопоказания для применения

Повышенная чувствительность к этилметилгидроксипиридина сукцинату и вспомогательному веществу препарата, острые нарушения функции печени и почек, детский возраст, беременность, грудное вскармливание – в связи с недостаточной изученностью действия препарата у данных категорий пациентов.

С осторожностью

Аллергические заболевания в анамнезе.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

В экспериментальных исследованиях не было выявлено тератогенного, мутагенного, эмбриотоксического действия. Адекватных и строго контролируемых клинических исследований безопасности и эффективности применения этилметилгидроксипиридина сукцината при беременности и в период грудного вскармливания не проводилось, поэтому применение препарата в указанные периоды противопоказано.

Способ применения и дозы

АСТРОКС применяют внутримышечно или внутривенно (струйно или капельно). Максимальная суточная доза не должна превышать 800-1200 мг (в зависимости от показаний).

Для инфузионного введения препарат разводят в 0,9 % растворе натрия хлорида. Струйно АСТРОКС вводят медленно в течение 5-7 минут, капельно - со скоростью 40-60 капель в минуту.

Для лечения *острого нарушения мозгового кровообращения* применяют в первые 10-14 дней внутривенно капельно по 200-500 мг 2-4 раза в сутки. В дальнейшем рекомендуется введение внутримышечно по 200-250 мг 2-3 раза в сутки в течение 14 дней.

Для лечения *черепно-мозговой травмы и последствий черепно-мозговых травм* АСТРОКС применяют в течении 10-15 дней внутривенно капельно по 200-500 мг 2-4 раза в сутки.

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

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

При *синдроме вегетативной (нейроциркуляторной) дистонии, невротических и неврозоподобных состояниях* препарат назначают внутримышечно в дозе 50-400 мг в сутки в течение 14 дней.

При *интеллектуально-мнестических (когнитивных) нарушениях различного генеза (в т.ч. нарушениях памяти у лиц пожилого возраста) и при тревожных расстройствах* препарат применяют внутримышечно по 100-300 мг в сутки в течение 14 -30 дней

Для лечения *острого инфаркта миокарда* АСТРОКС вводят внутривенно или внутримышечно в течение 14 суток, на фоне стандартной терапии инфаркта миокарда, включающей нитраты, бета-адреноблокаторы, ингибиторы ангиотензинпревращающего фермента, тромболитики, антикоагулянты и антиагрегантные средства, а также симптоматические средства по показаниям. В первые 5 суток, для достижения максимального эффекта, препарат желателно вводить внутривенно, в последующие 9 суток АСТРОКС может вводиться внутримышечно. 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 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* АСТРОКС вводят внутримышечно по 100-300 мг в сутки, 1-3 раза в сутки в течение 14 дней.

При *абстинентном алкогольном синдроме* применяют по 200-500 мг 2-3 раза в сутки внутримышечно или внутривенно капельно, в течение 5-7 дней.

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

Побочное действие

Со стороны желудочно-кишечного тракта: возможно появление тошноты, сухости слизистой оболочки полости рта, диареи.

Со стороны нервной системы: сонливость.

Со стороны иммунной системы: аллергические реакции.

Передозировка

В связи с низкой токсичностью передозировка маловероятна и до настоящего времени о таких случаях не сообщалось. При случайной передозировке возможно возникновение сонливости и седации. При внутривенном введении незначительное и кратковременное (до 1,5-2 ч) повышение АД. Лечение, как правило, не требуется - симптомы исчезают самостоятельно в течение суток. При чрезмерном повышении АД - гипотензивные препараты под контролем АД. В тяжелых случаях при бессоннице - нитразепам 10 мг, оксазепам 10 мг или диазепам 5 мг.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

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

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 препаратом необходимо воздерживаться от вождения транспортных средств и занятий 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 в ампулы с кольцом или точкой надлома из светозащитного стекла. 5 ампул помещают в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой. Допускается упаковка препарата в контурную ячейковую упаковку без фольги (поддон). 2 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона для потребительской тары.

По 20, 50 или 100 контурных ячейковых упаковок из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой вместе с 10, 25 или 50 инструкциями по применению препарата соответственно, в коробку из картона (для стационара).

Условия хранения

В защищенном от света месте, при температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года. Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Наименование юридического лица, на имя которого выдано регистрационное удостоверение

Общество с ограниченной ответственностью «ХОМЕКСФАРМ» (ООО «ХОМЕКСФАРМ»), Россия 109044, г. Москва, Крутицкий вал, д.14, офис 404
Тел./факс: (495) 748-56-26.

Производитель/организация, принимающая претензии

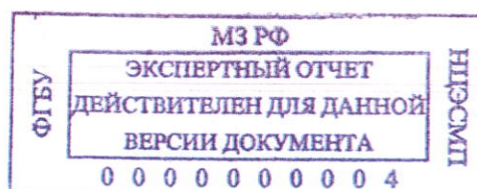
Федеральное государственное унитарное предприятие «Государственный завод медицинских препаратов» (ФГУП «ГосЗМП») 111024, г. Москва, Шоссе Энтузиастов, д. 23 тел. (495) 673-06-77 факс (495) 673-75-17.

Генеральный директор

ООО «ХОМЕКСФАРМ»



А.Д. Мартынов



105045