

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**

Астрокс, 50 мг/мл, раствор для внутривенного и внутримышечного введения.

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: этилметилгидроксипиридина сукцинат.

Каждый мл раствора содержит 50 мг этилметилгидроксипиридина сукцината.

Ампула 2 мл содержит 100 мг этилметилгидроксипиридина сукцината.

Ампула 5 мл содержит 250 мг этилметилгидроксипиридина сукцината.

Ампула 10 мл содержит 500 мг этилметилгидроксипиридина сукцината.

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: натрия дисульфит (натрия пиросульфит) (см. раздел 4.4.).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Раствор для внутривенного и внутримышечного введения

Бесцветная или слегка окрашенная прозрачная жидкость.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ**4.1. 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.

4.2. Режим дозирования и способ применения**Режим дозирования**

Максимальная суточная доза не должна превышать 1200 мг.

В составе комплексной терапии

Острые нарушения мозгового кровообращения

Препарат применяют 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.

Черепно-мозговая травма и последствия 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

Следует назначать внутривенно струйно или капельно в дозе 200–500 мг 1–2 раза в сутки на протяжении 14 дней. Затем внутримышечно по 100–250 мг/сут на протяжении последующих 2 недель.

Курсовая профилактика дисциркуляторной энцефалопатии

Препарат вводят внутримышечно в дозе 200–250 мг 2 раза в сутки на протяжении 10–14 дней.

Легкие когнитивные нарушения у пациентов пожилого возраста и при тревожных расстройствах

Препарат применяют внутримышечно в суточной дозе 100–300 мг/сут на протяжении 14–30 дней.

Острый инфаркт миокарда

Препарат вводят внутривенно или внутримышечно в течение 14 суток, на фоне традиционной 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 желательно вводить внутривенно, в последующие 9 суток препарат 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 течение 30–90 мин в объеме 100–150 мл. 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.

Открытоугольная глаукома различных стадий

Препарат вводят внутримышечно по 100–300 мг/сутки, 1–3 раза в сутки в течение 14 дней.

Абстинентный алкогольный синдром

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

Острая интоксикация антипсихотическими средствами

Препарат вводят внутривенно в дозе 200–500 мг/сут 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

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

Некротический панкреатит

При легкой степени тяжести – 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 – 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: в начальной дозировке 800 мг/сут 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.

Особые группы пациентов

Пациенты пожилого возраста

Корректировка дозы для пожилых пациентов не требуется.

Пациенты с нарушением функции почек

У пациентов с острым нарушением функции почек применение препарата противопоказано.

Пациенты с нарушением функции печени

У пациентов с острым нарушением функции печени применение препарата противопоказано.

Дети

Безопасность и эффективность препарата у детей в возрасте от 0 до 18 лет на данный момент не установлены. Данные отсутствуют.

Способ применения

Внутримышечно или внутривенно (струйно или капельно).

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

Инструкция по приготовлению лекарственного препарата перед применением см. в разделе 6.6.

4.3. Противопоказания

- Гиперчувствительность к этилметилгидроксипиридина сукцинату или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1.;
- острая почечная недостаточность;
- острая печеночная недостаточность;
- беременность, грудное вскармливание (см. раздел 4.6);
- детский возраст до 18 лет (в связи с отсутствием данных по эффективности и безопасности).

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

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.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие формы взаимодействия

Препарат усиливает действие бензодиазепиновых анксиолитиков, противосудорожных средств (карбамазепина) и противопаркинсонических средств (леводопа). Уменьшает токсические эффекты этилового спирта.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

В экспериментальных исследованиях не выявлено тератогенного, мутагенного эмбриотоксического действия. Адекватных и строго контролируемых клинических исследований при беременности не проводилось.

Препарат противопоказан в период беременности в связи с недостаточностью данных по эффективности и безопасности препарата.

Лактация

Адекватных и строго контролируемых клинических исследований в период грудного вскармливания не проводилось.

Препарат противопоказан в период грудного вскармливания в связи с недостаточностью данных по эффективности и безопасности препарата.

Препарат противопоказан при беременности.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

В период применения препарата необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятиями другими потенциально опасными видами деятельности, требующими концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме профиля безопасности

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

Резюме нежелательных реакций

Нежелательные реакции сгруппированы по системно-органным классам с указанием частоты их возникновения согласно классификации Всемирной организации здравоохранения (ВОЗ): 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). Нежелательные реакции внутри каждого системно-органного класса расположены в порядке убывания их серьезности с указанием частоты их возникновения (в рамках одной градации частоты).

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.

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации лекарственного препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза – риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств – членов Евразийского экономического союза.

Российская Федерация

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения (Росздравнадзор)

Адрес: 109012, Москва, Славянская площадь, д. 4, стр. 1

Телефон: +7 (800) 550-99-03

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»:

<https://www.roszdravnadzor.gov.ru/>

4.9. 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.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: другие средства для лечения заболеваний нервной системы.

Код АТХ: N07XX

Механизм действия, фармакодинамические эффекты

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.

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

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. В то же время препарат быстро выводится из плазмы крови и через 4 часа практически не определяется в ней. Фармакокинетические профили достоверно не отличаются как при однократном, так и при постоянном введении.

Биотрансформация

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.

Элиминация

Выводится почками, как в неизменном виде, так и в виде глюкуронконъюгатов.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Натрия дисульфит (натрия пиросульфит)

Вода для инъекций

6.2. Несовместимость

В связи с отсутствием исследований совместимости, данный лекарственный препарат не следует смешивать с другими лекарственными препаратами, за исключением упомянутых в разделе 6.

6.3. Срок годности (срок хранения)

5 лет.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

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

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

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.

6.6. Особые меры предосторожности при уничтожении использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата, и другие манипуляции с препаратом

Нет особых требований к утилизации.

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

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация

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

7.1 Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

АО «Новосибхимфарм»

630028, Новосибирская обл., г. Новосибирск, ул. Декабристов, 275

тел. 8 (383) 363-32-44

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

**9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ,
ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)**

Дата первой регистрации:

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-коммуникационной сети «Интернет» <http://eec.eaeunion.org>