

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

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

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: этилметилгидроксипиридина сукцинат.

Каждый 1 мл раствора содержит 50 мг этилметилгидроксипиридина сукцината.

Ампула 2 мл содержит 100 мг этилметилгидроксипиридина сукцината.

Ампула 5 мл содержит 250 мг этилметилгидроксипиридина сукцината.

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Раствор для внутривенного и внутримышечного введения.

Бесцветная или слегка желтоватая прозрачная жидкость.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ**4.1. Показания к применению**

- 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.

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

Взрослые: максимальная суточная доза не должна превышать 1200 мг.

При острых нарушениях мозгового кровообращения Мексиприм применяют в первые 10–14 дней внутривенно (в/в) капельно по 200–500 мг 2–4 раза в сутки, затем внутримышечно (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, последствиях черепно-мозговых травм Мексиприм 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 Мексиприм 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 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 Мексиприм 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 Мексиприм 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 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 Мексиприм 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 антиагреганты средства, а также симптоматические средства по показаниям.

В первые 5 суток для достижения максимального эффекта препарат желательно вводить в/в, в последующие 9 суток Мексиприм 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 мин.

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

При абстинентном алкогольном синдроме Мексиприм 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 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 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 клинко-лабораторного эффекта.

При остром отечном (интерстициальном) панкреатите Мексиприм 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.

Способ применения

В/м или в/в (струйно или капельно).

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

Инструкции 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 (в связи недостаточной изученностью действия препарата);
- детский возраст (в связи недостаточной изученностью действия препарата).

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

Отсутствуют.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

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

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Препарат Мексиприм противопоказан при беременности и в период грудного вскармливания.

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

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

4.8. Нежелательные реакции

Резюме профиля безопасности

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

Резюме нежелательных реакций

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 (на основании имеющихся данных оценить невозможно).

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.

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, г. Москва, Славянская площадь, д. 4, стр. 1

Телефон: +7 800 550 99 03

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

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

Республика Армения

«Научный центр экспертизы лекарств и медицинских технологий им. академика Э. Габриеляна» АОЗТ

Адрес: 0051, г. Ереван, пр. Комитаса 49/5

Телефоны: (+374 10) 20-05-05, (+374 96) 22-05-05

Электронная почта: vigilance@pharm.am

Сайт: <http://pharm.am/>

4.9. 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.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: другие средства для лечения заболеваний нервной системы.

Код АТХ: N07XX

Механизм действия, фармакодинамические эффекты

Антиоксидантный препарат, производное 3-оксипиридина; оказывает антигипоксическое, мембранопротекторное, ноотропное, противосудорожное, стресс-протективное, анксиолитическое действие. Препарат повышает резистентность организма к воздействию основных повреждающих факторов, к кислородозависимым патологическим состояниям (шок, гипоксия и ишемия, нарушение мозгового кровообращения, интоксикация алкоголем и антипсихотическими препаратами (нейролептиками)).

Механизм действия этилметилгидроксипиридина сукцината обусловлен антиоксидантным, антигипоксическим и мембранопротекторным действием. Препарат уменьшает проявления окислительного стресса, ингибирует перекисное окисление липидов, повышает активность

супероксиддисмутазы, повышает соотношение липид-белок, улучшает структуру и функцию мембраны клеток. Препарат модулирует активность мембраносвязанных ферментов (кальцийнезависимой фосфодиэстеразы, аденилатциклазы, ацетилхолинэстеразы), рецепторных комплексов (бензодиазепинового, гамма-аминомасляной кислоты (ГАМК), ацетилхолинового), что усиливает их способность связывания с лигандами, способствует сохранению структурно-функциональной организации биомембран, транспорта нейромедиаторов и улучшению синаптической передачи. Препарат 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 аденозинтрифосфата (АТФ) и креатинфосфата, активацию энергосинтезирующих функций митохондрий, стабилизацию клеточных мембран.

Этилметилгидроксипиридина сукцинат нормализует метаболические процессы в ишемизированном миокарде и улучшает его функциональное состояние, 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. В условиях коронарной недостаточности увеличивает коллатеральное кровоснабжение ишемизированного миокарда, способствует сохранению целостности кардиомиоцитов и поддержанию их функциональной активности. Эффективно восстанавливает сократимость миокарда при обратимой сердечной дисфункции. Повышает антиангинальную активность нитропрепаратов.

Улучшает метаболизм и кровоснабжение тканей головного мозга, улучшает микроциркуляцию и реологические свойства крови, уменьшает агрегацию тромбоцитов. Стабилизирует мембранные структуры клеток крови (эритроцитов и тромбоцитов). Обладает гиполипидемическим действием, уменьшает содержание общего холестерина и липопротеидов низкой плотности.

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.

Препарат уменьшает ферментативную токсемию и эндогенную интоксикацию при остром панкреатите.

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

При введении дозы 400–500 мг максимальная концентрация в плазме крови достигается через 0,45–0,5 ч и составляет 3,5–4,0 мкг/мл.

Распределение

После внутримышечного введения этилметилгидроксипиридина сукцинат определяется в плазме крови в течение 4 ч. Быстро распределяется в органах и тканях. Среднее время удержания препарата в организме составляет 0,7–1,3 ч.

Биотрансформация

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 сутки. После введения 3-й выводится в больших количествах почками; 4-й и 5-й - глюкуронконъюгаты.

Элиминация

Выводится из организма почками в основном в глюкуронконъюгированной форме и в незначительных количествах - в неизмененном виде.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Вода для инъекций

6.2. Несовместимость

Данный лекарственный препарат не следует смешивать с другими лекарственными препаратами, за исключением упомянутых в разделе 6.6.

6.3. Срок годности (срок хранения)

3 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

В оригинальной упаковке (картонной пачке) для защиты от света, при температуре не выше 20 °С.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

По 2 мл или 5 мл в ампулы из бесцветного или коричневого стекла первого гидролитического класса с точкой или кольцом надлома.

На ампулу наклеивают этикетку самоклеящуюся.

По 5 ампул в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной или из пленки поливинилхлоридной и пленки покровной.

По 1, 2 или 3 контурные ячейковые упаковки с листком-вкладышем помещают в пачку из картона

Упаковка для стационаров

По 6, 12, 20, 50 или 100 контурных ячейковых упаковок с листками-вкладышами помещают в коробку из картона. Количество листов-вкладышей равно количеству контурных ячейковых упаковок.

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

Россия

АО «Нижфарм»

603105, г. Нижний Новгород, ул. Салганская, д. 7

Тел.: (831) 278-80-88

E-mail: med@nizhpharm.ru

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация, Республика Армения

АО «Нижфарм», Россия

603105, г. Нижний Новгород, ул. Салганская, д. 7

Тел.: (831) 278-80-88

e-mail: med@nizhpharm.ru

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

Дата первой регистрации:

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

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