

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

ЗАМЕКСЕН

(ZAMEXEN)

Склад:

діюча речовина: ethylmethylhydroxypyridine succinate;

1 мл розчину містить етилметилгідроксипіридину сукцинату 50 мг;

допоміжні речовини: натрію метабісульфіт (Е 223), вода для ін'єкцій.

Лікарська форма. Розчин для ін'єкцій.

Основні фізико-хімічні властивості: безбарвна або злегка жовтувата прозора рідина.

Фармакотерапевтична група. Засоби, що впливають на нервову систему.

Код АТХ N07X X.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Замексен є інгібітором вільнорадикальних процесів, мембранопротектором, чинить антигіпоксичну, стресопротекторну, ноотропну, протисудомну та анксиолітичну дію. Препарат підвищує резистентність організму до дії різних шкідливих факторів, кисневозалежних патологічних станів (шок, гіпоксія та ішемія, порушення мозкового кровообігу, інтоксикація алкоголем та антипсихотичними засобами (нейролептиками)).

Замексен покращує мозковий метаболізм і кровозабезпечення головного мозку, покращує мікроциркуляцію та реологічні властивості крові, зменшує агрегацію тромбоцитів. Стабілізує мембранні структури клітин крові (еритроцитів і тромбоцитів) при гемолізі. Чинить гіполіпідемічну дію, зменшує вміст загального холестерину та ліпопротеїдів низької щільності (ЛПНЩ). Зменшує ферментативну токсемію та ендогенну інтоксикацію при гострому панкреатиті.

Механізм дії препарату зумовлений його антиоксидантною та мембранопротекторною дією. Він інгібує перекисне окиснення ліпідів, підвищує активність супероксиддисмутази, підвищує співвідношення ліпід – білок, зменшує в'язкість мембрани, збільшує її плинність. Модулює активність мембранозв'язаних ферментів (кальційнезалежної фосфодіестерази, аденілатциклази, ацетилхолінестерази), рецепторних комплексів (бензодіазепінового, γ -

аміномасляної кислоти (ГАМК), ацетилхолінового), що посилює їх можливість зв'язуватися з лігандами, сприяє збереженню структурно-функціональної організації біомембран, транспортуванню нейромедіаторів і покращенню синаптичної передачі.

Етилметилгідроксипіридину сукцинат підвищує вміст у головному мозку дофаміну. Викликає посилення компенсаторної активації аеробного гліколізу та зниження ступеня пригнічення окисних процесів у циклі Кребса в умовах гіпоксії з підвищенням вмісту аденозинтрифосфату (АТФ) і креатинфосфату, активацію енергосинтезуючих функцій мітохондрій, стабілізацію клітинних мембран.

Етилметилгідроксипіридину сукцинат нормалізує метаболічні процеси в ішемізованому міокарді, зменшує ділянку некрозу, відновлює і покращує електричну активність та скоротливість міокарда, а також збільшує коронарний кровотік у ділянці ішемії, зменшує наслідки реперфузійного синдрому при гострій коронарній недостатності. Підвищує антиангінальну активність нітропрепаратів. Етилметилгідроксипіридину сукцинат сприяє збереженню гангліозних клітин сітківки та волокон зорового нерва при прогресуючій нейропатії, наслідками якої є хронічна ішемія і гіпоксія. Покращує функціональну активність сітківки і зорового нерва, збільшує гостроту зору.

Фармакокінетика.

При внутрішньом'язовому введенні препарат визначається у плазмі крові протягом 4 годин після введення. Час досягнення максимальної концентрації становить 0,45-0,5 години. Максимальна концентрація при дозах 400-500 мг – 3,5-4,0 мкг/мл. Замексен швидко переходить із кровоносного русла в органи і тканини та швидко елімінується з організму. Препарат виводиться з організму зі сечею, в основному в глюкуронокон'югованій формі та в незначних кількостях – у незміненому вигляді.

-

Клінічні характеристики.

Показання.

Гострі порушення мозкового кровообігу;

черепно-мозкова травма, наслідки черепно-мозкових травм;

дисциркуляторна енцефалопатія;

хронічна ішемія мозку;

синдром вегетативної дистонії;

легкі (помірні) когнітивні розлади;

тривожні розлади при невротичних і неврозоподібних станах;

гострий інфаркт міокарда (з першої доби), у складі комплексної терапії;

первинна відкритокутова глаукома різних стадій, у складі комплексної терапії;

купірування абстинентного синдрому при алкоголізмі з переважанням неврозоподібних і нейроциркуляторних порушень;

гостра інтоксикація антипсихотичними засобами;

гострі гнійно-запальні процеси у черевній порожнині (гострий некротичний панкреатит, перитоніт), у складі комплексної терапії.

Протипоказання.

Гостра печінкова або ниркова недостатність, підвищена індивідуальна чутливість до діючої речовини та/або до допоміжних речовин лікарського засобу.

Період вагітності або годування груддю. Дитячий вік до 18 років у зв'язку з недостатньою вивченістю дії препарату.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Замексен посилює дію бензодіазепінових анксиолітиків, протисудомних засобів (карбамазепіну), протипаркінсонічних засобів (леводопи). Зменшує токсичний ефект етилового спирту.

Особливості застосування.

В окремих випадках, особливо у схильних пацієнтів, у пацієнтів із бронхіальною астмою при підвищеній чутливості до сульфітів, можливий розвиток тяжких реакцій гіперчутливості. Лікарський засіб містить натрію метабісульфіт, який може спричиняти бронхоспазм.

Цей лікарський засіб містить менше 1 ммоль (23 мг)/дозу натрію, тобто практично вільний від натрію.

З обережністю слід застосовувати лікарський засіб Замексен хворим із діабетичною ретинопатією (курс не повинен перевищувати 7-10 днів) у зв'язку з властивістю потенціювати проліферативні процеси.

Після завершення парентерального введення для підтримки досягнутого ефекту рекомендується продовжити застосування препарату у вигляді таблеток перорально.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Вагітність. Дані про застосування етилметилгідроксипіридину сукцинату у вагітних жінок відсутні. Дослідження репродуктивної токсичності на тваринах не свідчать про наявність прямих чи шкідливих ефектів. Лікарський засіб протипоказаний під час вагітності.

Період лактації. Відомості про проникнення етилметилгідроксипіридину сукцинату (метаболітів) у грудне молоко жінки, що годує, відсутні. Лікарський засіб протипоказаний у період грудного вигодовування.

Фертильність. Дослідження репродуктивної токсичності тварин не свідчать про наявність

репродуктивної токсичності.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

У період прийому препарату слід бути обережним при роботі, що потребує швидкості психофізичних реакцій (керування транспортними засобами, механізмами).

Спосіб застосування та дози.

Схема застосування залежить від захворювання

Внутрішньом'язово або внутрішньовенно (струминно або краплинно). При інфузійному способі введення слід розводити в 100–150 мл 0,9 % розчину натрію хлориду або 5 % розчину глюкози. Струминно лікарський засіб Замексен вводити повільно протягом 5–7 хвилин, краплинно – зі швидкістю 40–60 крапель за хвилину. Максимальна добова доза не повинна перевищувати 1200 мг.

При гострих порушеннях мозкового кровообігу лікарський засіб Замексен застосовувати у перші 10–14 днів – внутрішньовенно краплинно по 200–500 мг 2–4 рази на добу, потім – внутрішньом'язово по 200–250 мг 2–3 рази на добу протягом 14 діб, після чого рекомендовано перехід на прийом пероральних лікарських форм.

При черепно-мозковій травмі та наслідках черепно-мозкових травм лікарський засіб Замексен застосовувати протягом 10–15 днів шляхом внутрішньовенного краплинного введення по 200–500 мг 2–4 рази на добу, після чого рекомендовано перехід на прийом пероральних лікарських форм.

При дисциркуляторній енцефалопатії у фазі декомпенсації лікарський засіб Замексен слід застосовувати внутрішньовенно струминно або краплинно в дозі 200–500 мг 1–2 рази на добу протягом 14 днів. Потім препарат вводять внутрішньом'язово по 100–250 мг на добу протягом наступних 2 тижнів, після чого рекомендовано перехід на прийом пероральних лікарських форм.

Для курсової профілактики дисциркуляторної енцефалопатії лікарський засіб вводити внутрішньом'язово по 200–250 мг 2 рази на добу протягом 10–14 днів, після чого рекомендовано перехід на прийом пероральних лікарських форм.

При хронічній ішемії мозку лікарський засіб слід призначати по 10 мл (500 мг) 1 раз на добу внутрішньовенно краплинно або внутрішньовенно струминно повільно протягом 14 днів, після чого рекомендовано перехід на пероральні лікарські форми.

При легких (помірних) когнітивних порушеннях у хворих літнього віку лікарський засіб слід призначати по 10 мл (500 мг) 1 раз на добу внутрішньовенно краплинно або внутрішньовенно струминно повільно протягом 14 днів, після чого рекомендовано перехід на пероральні лікарські форми.

При тривожних розладах лікарський засіб застосовувати внутрішньом'язово у добовій дозі 100–300 мг на добу протягом 14–30 днів, після чого рекомендовано перехід на прийом

пероральних лікарських форм.

При гострому інфаркті міокарда лікарський засіб Замексен вводити внутрішньовенно або внутрішньом'язово протягом 14 діб на тлі традиційної терапії інфаркту міокарда, що включає нітрати, β-адреноблокатори, інгібітори АПФ, тромболітики, антикоагулянтні та антиагрегантні засоби, а також симптоматичні засоби за показаннями. У перші 5 діб для досягнення максимального ефекту бажане внутрішньовенне введення лікарського засобу, в наступні 9 діб можливе внутрішньом'язове введення. Внутрішньовенне введення проводити шляхом краплинної інфузії, повільно (щоб уникнути побічних реакцій), з 0,9 % розчином хлориду натрію або 5 % розчином глюкози в об'ємі 100-150 мл протягом 30-90 хв. За необхідності можливе повільне струминне введення протягом не менше 5 хвилин.

Введення лікарського засобу Замексен (внутрішньовенне або внутрішньом'язове) здійснювати 3 рази на добу, через кожні 8 годин. Добова терапевтична доза становить 6-9 мг на кожен кілограм маси тіла на добу, разова доза – 2-3 мг/кг маси тіла. Максимальна добова доза не повинна перевищувати 800 мг, разова – 250 мг.

При відкритокутовій глаукомі різних стадій лікарський засіб застосовувати у складі комплексної терапії внутрішньом'язово по 100-300 мг на добу, 1-3 рази на добу протягом 14 днів.

При абстинентному алкогольному синдромі вводити у дозі 200-500 мг внутрішньовенно або внутрішньом'язово 2-3 рази на добу протягом 5-7 днів.

При гострій інтоксикації антипсихотичними засобами препарат вводити внутрішньовенно в дозі 200-500 мг на добу протягом 7-14 днів.

При гострих гнійно-запальних процесах черевної порожнини (гострий некротичний панкреатит, перитоніт) препарат призначати у першу добу як у передопераційному, так і в післяопераційному періоді. Дози залежать від форми та тяжкості захворювання, поширеності процесу, варіантів клінічного перебігу. Відміна препарату повинна проводитись поступово, тільки після стійкого позитивного клінічно-лабораторного ефекту.

При гострому набряковому (інтерстиціальному) панкреатиті лікарський засіб призначати по 200-500 мг 3 рази на добу внутрішньовенно краплинно (в ізотонічному розчині натрію хлориду) та внутрішньом'язово. *Легкий ступінь тяжкості некротичного панкреатиту* – по 100-200 мг 3 рази на добу внутрішньовенно краплинно (в ізотонічному розчині натрію хлориду) та внутрішньом'язово. *Середній ступінь тяжкості* – по 200 мг 3 рази на добу внутрішньовенно краплинно (в ізотонічному розчині натрію хлориду). *Тяжкий перебіг* – у пульс-дозуванні 800 мг у першу добу, при дворазовому режимі введення; далі – по 200-500 мг 2 рази на добу з поступовим зниженням добової дози. *Дуже тяжкий перебіг* – у початковій дозі 800 мг на добу до стійкого купірування прояву панкреатогенного шоку, після стабілізації стану – по 300-500 мг 2 рази на добу внутрішньовенно краплинно (в ізотонічному розчині натрію хлориду) з поступовим зниженням добової дози.

Пацієнти літнього віку. Коригування дози для пацієнтів літнього віку не потрібно.

Діти.

Суворо контрольованих клінічних досліджень безпеки застосування препарату дітям не проводилося, тому Замексен протипоказано застосовувати цій категорії пацієнтів.

Передозування.

Симптоми: сонливість, безсоння.

Лікування: у зв'язку з низькою токсичністю передозування малоймовірне. Лікування зазвичай не потрібне, симптоми зникають самостійно протягом доби. При виражених проявах проводиться підтримуюче та симптоматичне лікування.

Побічні реакції.

Щоб уникнути виникнення побічних реакцій, рекомендується дотримуватися режиму дозування і швидкості введення препарату. Частота побічних реакцій визначалася відповідно до класифікації Всесвітньої організації охорони здоров'я (ВООЗ): дуже часто ($\geq 10\%$); часто ($\geq 1\%$ але $\leq 10\%$); нечасто ($\geq 0,1\%$ але $\leq 1\%$); рідко ($\geq 0,01\%$ але $\leq 0,1\%$); дуже рідко ($\leq 0,01\%$); частота невідома (частота не може бути визначена на основі наявних даних).

З боку імунної системи: дуже рідко – анафілактичний шок, ангіоневротичний набряк, кропив'янка; частота невідома – алергічні реакції, гіперемія, можливі тяжкі реакції гіперчутливості.

Психічні порушення: дуже рідко – сонливість; частота невідома – порушення процесу засинання, відчуття тривожності, емоційна реактивність.

З боку серцево-судинної системи: частота невідома – відчуття серцебиття, тахікардія.

З боку нервової системи: дуже рідко – головний біль, запаморочення (може бути пов'язане з надмірно високою швидкістю введення і носити короткочасний характер); частота невідома – порушення координації, тремор.

З боку судин: дуже рідко – зниження/підвищення артеріального тиску (може бути пов'язане з надмірно високою швидкістю введення і носити короткочасний характер).

З боку дихальної системи, органів грудної клітки і середостіння: дуже рідко – сухий кашель, подразнення у горлі, дискомфорт у грудній клітці, затруднення дихання (може бути пов'язане з надмірно високою швидкістю введення і носити короткочасний характер); частота невідома – бронхоспазм.

З боку шлунково-кишкового тракту: дуже рідко – сухість у роті, нудота, відчуття неприємного запаху, металевий присмак у роті; частота невідома – диспепсичні розлади, діарея.

З боку шкіри і підшкірних тканин: дуже рідко – свербіж, висипання, гіперемія обличчя; частота невідома – дистальний гіпергідроз.

Загальні порушення і реакції в місці введення: дуже рідко – відчуття тепла; частота невідома – зміни у місці введення.

На тлі довготривалого введення препарату можливе виникнення таких побічних реакцій: метеоризм, слабкість, периферичні набряки.

Термін придатності. 2 роки.

Умови зберігання. Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С. Зберігати у недоступному для дітей місці.

Несумісність.

Препарат не слід змішувати з іншими лікарськими засобами. Використовувати тільки розчинники, вказані в інструкції.

Упаковка. По 2 мл в ампулі; по 10 ампул у пачці або по 5 ампул у блістері, по 2 блістери у пачці. По 5 мл в ампулі; по 5 ампул у пачці або по 5 ампул у блістері, по 1 блістеру у пачці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. Приватне акціонерне товариство «Лекхім-Харків».

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.

Україна, 61115, Харківська обл., місто Харків, вулиця Северина Потоцького, будинок 36.