Мексифин



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Этилметилгидроксипиридина сукцинат

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Ингибитор свободнорадикальных процессов - мембранопротектор, обладающий также антигипоксическим, стресспротекторным, ноотропным, противоэпилептическим и анксиолитическим действием. Относится к классу 3-оксипиридинов.

Механизм действия обусловлен антиоксидантным и мембранопротекторным свойствами. Подавляет ПОЛ, повышает активность супероксидоксидазы, повышает соотношение липид-белок, улучшает структуру и функцию мембраны клеток. Модулирует активность мембраносвязанных ферментов (Ca^{2+}-независимой ФДЭ, аденилатциклазы, ацетилхолинэстеразы), рецепторных комплексов (бензодиазепинового, ГАМК, ацетилхолинового), что способствует их связыванию с лигандами, сохранению структурно-функциональной организации биомембран, транспорта нейромедиаторов и улучшению синаптической передачи. Повышает концентрацию в головном мозге дофамина.

Усиливает компенсаторную активацию аэробного гликолиза и снижает степень угнетения окислительных процессов в цикле Кребса в условиях гипоксии с увеличением АТФ и креатинфосфата, активирует энергосинтезирующую функцию митохондрий.

Повышает резистентность организма к воздействию различных повреждающих факторов при патологических состояниях (шок, гипоксия и ишемия, нарушения мозгового кровообращения, интоксикация этанолом и антипсихотическими лекарственными средствами).

Улучшает метаболизм и кровоснабжение головного мозга, микроциркуляцию и реологические свойства крови, уменьшает агрегацию тромбоцитов. Стабилизирует мембраны клеток крови (эритроцитов и тромбоцитов), снижая вероятность развития гемолиза.

Обладает гиполипидемическим действием, уменьшает содержание общего холестерина и ЛПНП.

Улучшает функциональное состояние ишемизированного миокарда при инфаркте миокарда, сократительную функцию сердца, а также уменьшает проявления систолической и диастолической дисфункции ЛЖ.

В условиях критического снижения коронарного кровотока способствует сохранению структурно-функциональной организации мембран кардиомиоцитов, стимулирует активность мембранных ферментов - ФДЭ, аденилатциклазы, ацетилхолинэстеразы. Поддерживает развивающуюся при острой ишемии активацию аэробного гликолиза и способствует в условиях гипоксии восстановлению митохондриальных окислительно-восстановительных процессов, увеличивает синтез АТФ и креатинфосфата. Обеспечивает целостность морфологических структур и физиологических функций ишемизированного миокарда.

Улучшает клиническое течение инфаркта миокарда, повышает эффективность проводимой терапии, ускоряет восстановление функциональной активности миокарда ЛЖ, снижает частоту возникновения аритмий и нарушений внутрисердечной проводимости. Нормализует метаболические процессы в ишемизированном миокарде, уменьшает зону некроза, восстанавливает и/или улучшает электрическую активность и сократимость миокарда, а также увеличивает коронарный кровоток в зоне ишемии, повышает антиангинальную активность нитропрепаратов, улучшает реологические свойства крови, уменьшает последствия реперфузионного синдрома при острой коронарной недостаточности.

Уменьшает ферментативную токсемию и эндогенную интоксикацию при остром панкреатите.

Фармакокинетика

Всасывание

Быстро всасывается при приеме внутрь (период полуабсорбции - 0.08-1 ч). $ТС_{max}$ при в/м введении - 0.3-0.58 ч, при приеме внутрь - 0.46-0.5 ч. $С_{max}$ при в/м введении в дозе 400-500 мг - 2.5-4 мкг/мл, при приеме внутрь - 50-100 нг/мл.

Распределение

Быстро распределяется в органах и тканях. Среднее время удержания препарата в организме при в/м введении - 0.7-1.3 ч, при приеме внутрь - 4.9-5.2 ч.

Метаболизм

Метаболизируется в печени путем глюкуронирования. Идентифицировано 5 метаболитов: 3-оксипиридина фосфат - образуется в печени и при участии ЩФ распадается на фосфорную кислоту и 3-оксипиридин; 2-й метаболит - фармакологически активный, образуется в больших количествах и обнаруживается в моче на 1-2 сут после введения; 3-й - выводится в больших количествах с мочой; 4-й и 5-й - глюкуронконъюгаты.

Выведение

$Т_{1/2}$ при приеме внутрь - 4.7-5 ч. Быстро выводится с мочой в основном в виде метаболитов (50% за 12 ч) и в незначительном количестве - в неизмененном виде (0.3% за 12 ч). Наиболее интенсивно выводится в течение первых 4 ч после приема препарата. Показатели выведения с мочой неизмененного препарата и метаболитов имеют значительную индивидуальную вариабельность.

Показания к применению:

— тревожные состояния при невротических и неврозоподобных состояниях;

— вегето-сосудистая дистония;

— дисциркуляторная энцефалопатия;

— легкие когнитивные расстройства атеросклеротического генеза;

— острые нарушения мозгового кровообращения (в составе комбинированной терапии);

— абстинентный синдром при алкоголизме с преобладанием неврозоподобных и вегетативно-сосудистых расстройств;

— острая интоксикация антипсихотическими лекарственными средствами;

— острые гнойно-воспалительные процессы в брюшной полости (в т.ч. острый некротический панкреатит, перитонит (в составе комплексной терапии));

— острый инфаркт миокарда с первых суток (парентерально);

— ИБС;

— комплексная терапия ишемического инсульта (перорально) - в составе комплексной терапии.

Относится к болезням:

- Абстинентный синдром
- Алкоголизм
- Атеросклероз
- Вегето-сосудистая дистония
- Дисциркуляторная энцефалопатия
- Инсульт
- Интоксикация
- Интоксикация антипсихотическими лекарственными средствами
- Инфаркт миокарда
- Когнитивные расстройства атеросклеротического генеза
- Миокардит
- Нарушение мозгового кровообращения
- Неврит
- Неврозы
- Панкреатит
- Перитонит
- Тревожные состояния
- Энцефалит

Противопоказания:

— гиперчувствительность;

— острая печеночная и/или почечная недостаточность;

— беременность;

— период лактации;

— детский возраст.

С осторожностью: при наличии аллергических заболеваний в анамнезе (для парентерального введения).

Способ применения и дозы:

Мексидол, Мексидант

Внутрь, 0.25-0.5 г/сут в 2-3 приема; максимальная суточная доза - 0.6-0.8 г. Длительность лечения - 2-6 нед; для *купирования алкогольной абстиненции* - 5-7 дней. Лечение прекращают постепенно, уменьшая дозу в течение 2-3 дней.

В/м, в/в (струйно, в течение 5-7 мин или капельно, со скоростью 60 кап/мин). При инфузионном способе введения разводят в 200 мл 0.9% раствора натрия хлорида. Начальная доза - 0.05-0.1 г 1-3 раза/сут с постепенным повышением до получения терапевтического эффекта. Максимальная суточная доза - 0.8 г.

При *остром нарушении мозгового кровообращения* - в/в капельно, по 0.2-0.3 г 1 раз/сут в первые 2-4 дня, затем в/м, по 0.1 г 3 раза/сут.

При *дисциркуляторной энцефалопатии* (фаза декомпенсации) - в/в струйно или капельно, по 0.1 г 2-3 раза/сут в течение 14 дней, а затем в/м, по 0.1 г в течение 14 дней. При *курсовой профилактике дисциркуляторной энцефалопатии* - в/м, по 0.1 г 2 раза/сут в течение 10-14 дней.

ВСД, невротические и неврозоподобные состояния - в/м, по 0.05-0.4 г/сут в течение 14 дней.

При *абстинентном синдроме* - в/м, по 100-200 мг 2-3 раза/сут или в/в капельно, 1-2 раза/сут в течение 5-7 дней.

При *острой интоксикации антипсихотическими средствами* - в/в 0.05-0.3 г/сут в течение 7-14 дней.

При *легких когнитивных расстройствах* - в/м по 0.1-0.3 г/сут в течение 14-30 дней.

При *гнойно-воспалительных процессах в брюшной полости (острый некротический панкреатит, перитонит)* - в первые сутки в предоперационном и послеоперационном периоде. Доза зависит от формы и тяжести заболевания, распространенности процесса, клинического течения.

Отмена препарата производится постепенно после устойчивого клинико-лабораторного улучшения.

При *остром отечном (интерстициальном) панкреатите легкой степени тяжести* - 0.1-0.2 г 3 раза/сут в/в капельно и в/м;
средней степени тяжести - по 0.2 г 3 раза/сут;
при *тяжелом течении* - в/в капельно, 0.8 г в первые сутки (разделенные на 2 введения), далее - по 0.3 г 2 раза/сут с постепенным снижением суточной дозы;
крайне тяжелое течение - в/в капельно, по 0.8 г/сут до стойкого купирования симптомов панкреатогенного шока;
после стабилизации состояния - по 0.3-0.4 г 2 раза/сут с постепенным снижением суточной дозы.

При *инфаркте миокарда* - в/в (в первые 5 дней) и в/м (последующие 9 дней) 3 раза/сут (через каждые 8 ч). Суточная доза - 6-9 мг/кг/сут, разовая доза - 2-3 мг/кг. Максимальная суточная доза не должна превышать 800 мг, разовая - 250 мг. В/в вводят инфузионно в течение 30-90 мин в 100-150 мл 0.9% раствора натрия хлорида или 5% раствора декстрозы или струйно в течение не менее 5 мин.

При *ИБС*: внутрь, по 100 мг 3 раза/сут. Продолжительность курса не менее 2 мес; при необходимости возможно проведение повторных курсов.

Побочное действие:

Тошнота, сухость во рту, диарея, сонливость, аллергические реакции.

При парентеральном введении (особенно в/в струйном): сухость, "металлический" привкус во рту, ощущения "разливающегося тепла" во всем теле, неприятный запах, першение в горле и дискомфорт в грудной клетке, ощущение нехватки воздуха (как правило связаны с чрезмерно высокой скоростью введения и носят кратковременный характер); при длительном применении - тошнота, метеоризм; нарушения сна (сонливость или нарушение засыпания).

Передозировка:

Симптомы: нарушения сна (бессонница, в некоторых случаях - сонливость); при в/в введении - незначительное и кратковременное (до 1.5-2 ч) повышение АД.

Лечение: как правило, не требуется. Симптомы исчезают самостоятельно в течение суток. В тяжелых случаях при бессоннице - нитразепам 10 мг, оксазепам 10 мг или диазепам 5 мг. При чрезмерном повышении АД - гипотензивные лекарственные средства под контролем АД.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан при беременности, в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Усиливает действие бензодиазепиновых анксиолитиков, противоэпилептических (карбамазепин), противопаркинсонических (леводопа) лекарственных средств, нитратов.

Уменьшает токсические эффекты этанола.

Особые указания и меры предосторожности:

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Противопоказан при острой почечной недостаточности.

При нарушениях функции печени

Противопоказан при острой печеночной недостаточности.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском возрасте.

Источник: http://drugs.thead.ru/Meksifin