

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Мексидол ФОРТЕ 250, 250 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: этилметилгидроксипиридина сукцинат.

1 таблетка содержит: этилметилгидроксипиридина сукцината (в пересчете на 100 % вещество) – 250 мг.

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: лактозы моногидрат (см. раздел 4.4).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой светло-розового цвета. На поперечном разрезе ядро почти белого цвета.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1. Показания к применению

- последствия острых нарушений мозгового кровообращения, в т.ч. после транзиторных ишемических атак, в фазе субкомпенсации в качестве профилактических курсов;
- легкая черепно-мозговая травма, последствия черепно-мозговых травм;
- энцефалопатии различного генеза (дисциркуляторные, дисметаболические, посттравматические, смешанные);
- хроническая ишемия мозга;
- синдром вегетативной дистонии;
- легкие (умеренные) когнитивные расстройства;
- тревожные расстройства при невротических и неврозоподобных состояниях;
- ишемическая болезнь сердца в составе комплексной терапии;
- купирование абстинентного синдрома при алкоголизме с преобладанием неврозоподобных и вегетативно-сосудистых расстройств, постабстинентные расстройства;
- состояние после острой интоксикации антипсихотическими средствами;
- астенические состояния, а также для профилактики развития соматических заболеваний под воздействием экстремальных факторов и нагрузок;
- воздействие экстремальных (стрессорных) факторов.

4.2. Режим дозирования и способ применения

Режим дозирования

По 250 мг 3 раза в сутки.

Начальная доза – 250 мг (1 таблетка) 1-2 раза в сутки с постепенным повышением до терапевтического эффекта. Максимальная суточная доза – 750 мг (3 таблетки).

Длительность лечения – 2-8 недель; для купирования алкогольной абстиненции – 5-7 дней.

Продолжительность курса терапии у больных ишемической болезнью сердца не менее 1,5-2 месяцев.

Курс лечения хронической ишемии мозга препаратом Мексидол ФОРТЕ 250 рекомендуется проводить после завершения курса парентеральной терапии препаратом Мексидол.

Повторные курсы (по рекомендации врача), желательно проводить в весенне-осенние периоды.

Дети

Безопасность и эффективность препарата Мексидол ФОРТЕ 250 у детей в возрасте от 0 до 18 лет не установлены.

Способ применения

Внутрь, запивая водой.

4.3. Противопоказания

- гиперчувствительность к этилметилгидроксипиридина сукцинату или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1;
- острые нарушения функции печени и/или почек;
- детский возраст (в связи с недостаточной изученностью действия препарата);
- беременность, грудное вскармливание (в связи с недостаточной изученностью действия препарата);
- непереносимость лактозы, дефицит лактазы, глюкозо-галактозная мальабсорбция.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

Пациентам с редко встречающейся наследственной непереносимостью галактозы, дефицитом лактазы или глюкозо-галактозной мальабсорбцией не следует принимать этот препарат.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Мексидол ФОРТЕ 250 сочетается со всеми препаратами, используемыми для лечения соматических заболеваний.

Усиливает действие бензодиазепиновых препаратов, антидепрессантов, анксиолитиков, противоэпилептических средств (карбамазепина) и противопаркинсонических средств (леводопа), нитратов. Уменьшает токсическое действие этанола.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Препарат Мексидол ФОРТЕ 250 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 нежелательных реакций

Частота побочных эффектов определялась в соответствии с классификацией Всемирной организации здравоохранения (ВОЗ): очень часто ($\geq 10\%$); часто ($\geq 1\%$, но $< 10\%$); нечасто ($\geq 0,1\%$, но $< 1\%$); редко ($\geq 0,01\%$, но $< 0,1\%$); очень редко ($< 0,01\%$); частота неизвестна (частота не может быть определена на основе имеющихся данных).

Нарушения со стороны иммунной системы: очень редко – ангионевротический отек, крапивница.

Психические нарушения: очень редко – сонливость.

Нарушения со стороны нервной системы: очень редко – головная боль.

Желудочно-кишечные нарушения: очень редко – сухость во рту, тошнота, боль, жжение и дискомфорт в эпигастральной области, изжога, метеоризм, диарея.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: очень редко – сыпь, зуд, гиперемия.

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

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

*Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения Российской Федерации
(Росздравнадзор)*

Телефон: +7 (800) 550-99-03

e-mail: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

сайт: <http://www.roszdravnadzor.gov.ru/>

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 препараты для лечения заболеваний нервной системы. Прочие препараты для лечения заболеваний нервной системы.

Код АТХ: N07XX.

Механизм действия

Механизм действия препарата Мексидол ФОРТЕ 250 обусловлен его антиоксидантным, антигипоксикантным и мембранопротекторным действием. Он ингибирует перекисное окисление липидов, повышает активность супероксиддисмутазы, повышает соотношение липид-белок, уменьшает вязкость мембраны, увеличивает ее текучесть. Мексидол ФОРТЕ 250 модулирует активность мембраносвязанных ферментов (кальций-независимой 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. 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.

Мексидол ФОРТЕ 250 повышает содержание в головном мозге дофамина.

Фармакодинамические эффекты

Мексидол ФОРТЕ 250 является ингибитором свободнорадикальных процессов, мембранопротектором, обладающим антигипоксическим, стресс-протекторным, ноотропным, противоэпилептическим и анксиолитическим действием. Препарат повышает резистентность организма к воздействию различных повреждающих факторов при патологических состояниях (гипоксии и ишемии, нарушении мозгового кровообращения, интоксикации этанолом и антипсихотическими средствами). Антистрессорное действие проявляется в нормализации постстрессового поведения, соматовегетативных нарушений, восстановлении циклов сон-бодрствование, нарушенных процессов обучения и памяти, снижении дистрофических и морфологических изменений в различных структурах головного мозга. Обладает гипополипидемическим действием, уменьшает содержание общего холестерина и липопротеидов низкой плотности. Мексидол ФОРТЕ 250 улучшает функциональное состояние ишемизированного миокарда. Обеспечивает целостность морфологических структур и физиологических функций ишемизированного миокарда. 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. Стабилизирует мембранные структуры клеток крови (эритроцитов и тромбоцитов), снижая вероятность развития гемолиза.

Клиническая эффективность и безопасность

Международное многоцентровое рандомизированное двойное слепое плацебо-контролируемое исследование по оценке эффективности и безопасности последовательной терапии препаратами Мексидол и Мексидол ФОРТЕ 250 фазы III (МЕМО) у пациентов с хронической ишемией мозга проводилось с участием 318 пациентов в возрасте от 40 до 90 лет. Пациенты в исследуемой группе получали терапию препаратом Мексидол по 10 мл (500 мг) 1 раз в сутки в/в капельно или внутривенно струйно медленно на протяжении 14 дней с последующим приемом препарата Мексидол ФОРТЕ 250 по 1 таблетке 3 раза в сутки в течение последующих 60 дней. Пациенты в контрольной группе получали плацебо по аналогичной схеме. По результатам исследования на момент завершения терапии пациентами были выявлены статистически значимые изменения баллов по Монреальской шкале оценки когнитивных функций (MoCA) при сравнении динамики в исследуемой и контрольной группах ($p < 0,000001$, t-критерий для независимых выборок). Нижняя граница 95 % доверительного интервала для разности средних основного показателя эффективности в группах препаратов Мексидол/Мексидол ФОРТЕ 250 и плацебо составила 1,51. Данная граница является положительной величиной, что позволило констатировать превосходящую эффективность препаратов Мексидол и Мексидол ФОРТЕ 250 над плацебо. По результатам оценки вторичных конечных точек эффективности препаратов Мексидол и Мексидол ФОРТЕ 250 в ходе терапии были получены статистически значимые различия по сравнению с плацебо по следующим показателям: динамика выраженности когнитивных нарушений по тесту замены цифровых символов; динамика выраженности астенических расстройств по шкале астении MFI-20; динамика вегетативных изменений по опроснику Вейна; динамика уровня тревоги по шкале Бека; динамика двигательных изменений по шкале Тинетти; динамика общего клинического впечатления по шкале общего клинического впечатления (The Clinical Global Impressions Scale); динамика качества жизни пациентов по опроснику SF-36 (психологический компонент здоровья).

Результаты статистического анализа частоты возникновения нежелательных явлений, показателей лабораторных анализов, результатов физикального обследования демонстрируют отсутствие

значимых различий между сравниваемыми группами по основным показателям безопасности, что доказывает профиль безопасности Мексидола, сравнимый с плацебо.

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

Быстро всасывается при приеме внутрь. Максимальная концентрация (C_{max}) при дозах 400-500 мг составляет 3,5-4,0 мкг/мл. Быстро распределяется в органах и тканях.

Распределение

Среднее время удержания (MRT) препарата в организме при приеме внутрь – 4,9-5,2 ч.

Биотрансформация

Метаболизируется в печени путем глюкуронконъюгирования. Идентифицировано 5 метаболитов: 3-оксипиридина фосфат – образуется в печени, 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 с мочой; 4-й и 5-й – глюкуронконъюгаты.

Элиминация

Период полувыведения ($T_{1/2}$) при приеме внутрь – 2,0-2,6 ч. Быстро выводится с мочой в основном в виде метаболитов и в незначительном количестве – в неизменном виде. Наиболее интенсивно выводится в течение первых 4 ч после приема препарата. Показатели выведения с мочой неизменного препарата и метаболитов имеют индивидуальную вариабельность.

5.3. Данные доклинической безопасности

В доклинических данных, полученных по результатам стандартных исследований фармакологической безопасности, токсичности при многократном введении, генотоксичности, канцерогенного потенциала, репродуктивной и онтогенетической токсичности, особый вред для человека не выявлен.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Вспомогательные вещества:

Лактозы моногидрат;

Повидон К-30;

Магния стеарат.

Пленочная оболочка:

Гипромеллоза;

Титана диоксид;

Лактозы моногидрат;

Макрогол 4000;

Триацетин;

Краситель железа оксид красный;

Краситель железа оксид желтый.

6.2. Несовместимость

Не применимо.

6.3. Срок годности (срок хранения)

3 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Хранить в защищенном от света месте, при температуре не выше 25 °С.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

По 10 таблеток, покрытых пленочной оболочкой, в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой.

По 1, 2, 3, 4, 5, 6 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению в пачку картонную.

6.6. Особые меры предосторожности при уничтожении использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата или работы с ним

Нет особых требований к утилизации.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация

ООО «НПК «ФАРМАСОФТ»,

115407, город Москва, улица Судостроительная, дом 41, этаж 1, помещение 12

Тел./ факс: +7 (495) 626-47-55

Электронная почта: pharmasoft@pharmasoft.ru

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

ООО «НПК «ФАРМАСОФТ»

115407, город Москва, улица Судостроительная, дом 41, этаж 1, помещение 12

Тел./ факс: +7 (495) 626-47-55

Электронная почта: pharmasoft@pharmasoft.ru

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

ЛП-№(000066)-(РГ-RU)

9. ДАТА ПЕРВОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

Дата первой регистрации: 03.06.2020 г.

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата Мексидол ФОРТЕ 250 доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-коммуникационной сети «Интернет» <http://eec.eaeunion.org/>.