

ИНСТРУКЦИЯ
для медицинского применения лекарственного средства
КСАВРОН (XAVRON)

Состав:

действующее вещество: эдаравон;
1 мл раствора содержит 1,5 мг эдаравона;
вспомогательные вещества: натрия метабисульфит (Е 223), натрия хлорид, натрия гидроксид, фосфорная кислота, вода для инъекций.

Лекарственная форма. Раствор для инъекций.

Основные физико-химические свойства: прозрачная бесцветная или слегка желтоватая жидкость.

Фармакотерапевтическая группа. Другие препараты для лечения заболеваний центральной нервной системы. АТХ N07 XX.

Фармакологические свойства.

Фармакодинамика.

Свободные радикалы, такие как гидроксильные радикалы (ОН), являются одними из основных факторов сосудистых нарушений в головном мозге, связанных с ишемией; при ишемии или кровоизлиянии в момент восстановления проходимости из-за аномального увеличения продукции арахидоновой кислоты увеличивается количество продуцированных свободных радикалов. Эти свободные радикалы вызывают перекисное окисление ненасыщенных жирных кислот, входящих в состав липидов клеточных мембран, повреждая их, что приводит к нарушению функции головного мозга.

На острой стадии ишемического инфаркта мозга препарат демонстрирует защитное действие, подавляя возникновение и развитие ишемических цереброваскулярных расстройств, таких как отек головного мозга, неврологические симптомы, медленная гибель нейронов.

Этиология начала и развития бокового амиотрофического склероза (БАС) в настоящее время окончательно не определена. Однако было высказано предположение, что оксидативный стресс, вызванный свободными радикалами, может быть этиологическим фактором для данной патологии. Эдаравон, благодаря своему подавляющему воздействию на перекисное окисление липидов путем связывания свободных радикалов, демонстрирует торможение развития заболевания посредством уменьшения окисного повреждения клеток мозга (сосудистые эндотелиальные клетки/нервные клетки).

Фармакокинетика.

Фармакокинетика препарата исследовали на пяти здоровых мужчинах-добровольцах и пяти здоровых мужчинах-добровольцах пожилого возраста через 30 минут после многократного внутривенного введения дозы препарата (0,5 мг/кг) два раза в сутки в течение 2 дней. Концентрация неизмененного препарата в плазме крови в обеих группах снижалась одинаково без следов накопления.

Фармакокинетические параметры	Здоровые добровольцы-мужчины (n=5)	Здоровые мужчины-добровольцы пожилого возраста (n=5)
C max (нг/мл)	888±171	1041±106
t ½ α (г)	0,27±0,11	0,17±0,03
t ½ β (г)	2,27±0,80	1,84±0,17

Уровень связывания эдаравона с белками сыворотки крови и сывороточным альбумином составляет 92 % и 89–91 % соответственно (in vitro).

В плазме крови главными метаболитами эдаравона выступают сульфатные конъюгаты, также были обнаружены конъюгаты с глюкуроновой кислотой. В моче по большей части были обнаружены глюкурониды и в меньшем количестве – сульфаты.

Через 12 часов после введения 0,7–0,9 % препарата выводится с мочой в неизменном виде и 71,0–79,9 % в виде метаболитов.

Показания к применению.

Облегчение неврологических симптомов, проявлений нарушений деятельности в повседневной жизни и функциональных расстройств, связанных с острым ишемическим инсультом.

Замедление прогрессирования функциональных расстройств у больных боковым амиотрофическим склерозом.

Противопоказания.

Тяжелая форма почечной недостаточности.

Гиперчувствительность к компонентам препарата.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий.

При одновременном применении с антибиотиками с почечным типом экскреции (цефазолин натрия, цефотиам гидрохлорид, пиперациллин натрия и пр.) существует вероятность усиления дисфункции почек, в случае комбинированного применения следует тщательно вести наблюдение, регулярно осуществляя анализ функционирования почек.

Ксаврон перед введением нужно растворить в 100 мл физиологического раствора натрия хлорида. Смешивание препарата с другими растворами для внутривенного введения, содержащими различные сахара, может привести к снижению концентрации эдаравона.

Препарат не следует смешивать с растворами для парентерального питания и/или растворами, содержащими аминокислоты, а также вводить через те же инфузионные системы.

Препарат не смешивать с противосудорожными препаратами, включая диазепам, фенитоин натрия и пр., из-за возможности образования мути. Также не смешивать с калия канреноатом.

Способ применения и дозы.

Неврологические симптомы, связанные с острым ишемическим инсультом, проявления нарушений повседневной деятельности, облегчение разного рода дисфункций: 30 мг эдаравона (1 ампула) два раза в сутки, утром и вечером, путем внутривенной инфузии в течение 30 минут. Перед введением содержимое ампулы следует растворить в 100 мл натрия хлорида 0,9 %. Терапию необходимо начать в течение 24 часов после появления симптомов, длительность лечения — не менее 14 дней.

Ингибирующее влияние на прогрессирование дисфункции при боковом амиотрофическом склерозе (БАС): назначать 60 мг эдаравона (2 ампулы), путем внутривенной инфузии в течение 60 минут, 1 раз в сутки. Перед введением содержимое ампулы следует растворить в достаточном объеме натрия хлорида 0,9 %. Как правило, период введения препарата и период покоя в сумме составляют 28 дней и считаются как 1 курс, такие курсы повторяются. Первый курс состоит из 14 дней приема препарата, после чего наступает 14-дневный период перерыва и покоя, второй курс и последующие состоят из 10 дней введения препарата в течение 14 дней, после чего начинается период покоя продолжительностью 14 дней.

У пациентов с острым ишемическим инсультом продолжительность терапии может быть сокращена в зависимости от клинического состояния пациента.

Пациенты пожилого возраста.

Поскольку у пациентов пожилого возраста в целом снижены физиологические функции, то в случае появления побочных эффектов следует прекратить прием препарата и принять соответствующие меры. Опубликовано много примеров того, что у пациентов пожилого возраста часто возникают летальные исходы, поэтому наблюдение должно быть особо тщательным.

Дети. Безопасность применения препарата у детей не установлена.

Недостаточно опыта применения при остром ишемическом инсульте у детей; при БАС опыт клинического применения детям отсутствует.

Побочные реакции.

Со стороны мочевыделительной системы: острая почечная недостаточность, нефротический синдром.

Со стороны кожи: сыпь, покраснение, отек, ощущение зуда, эритема.

Со стороны гепатобилиарной системы: нарушения функций печени, печеночная недостаточность, фульминантный гепатит, желтуха.

Со стороны нервной системы: бессонница, головная боль.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: повышение артериального давления.

Со стороны крови: агранулоцитоз, ДВС-синдром, снижение количества эритроцитов, лейкоцитоз, лейкопения, уменьшение уровня гематокрита, снижение гемоглобина, тромбоцитоз, тромбоцитопения.

Со стороны дыхательной системы: синдром острого повреждения легких, сопровождающийся пирексией, кашлем, диспноэ, аномалиями рентгенографии грудной клетки.

Со стороны желудочно-кишечной системы: тошнота, рвота.

Со стороны костно-мышечной системы: рабдомиолиз.

Со стороны иммунной системы: шок, анафилактический шок (крапивница, снижение артериального давления, затрудненное дыхание и пр.).

Изменение лабораторных показателей: повышение уровней АлАТ, АсАТ, ЛДГ, γ -глутамилтранспептидазы, ЩФ, билирубина, креатинина, мочевой кислоты в сыворотке крови, глюкозурия, гематурия, протеинурия.

Изменения в месте введения: покраснение в месте инъекций, припухлость в месте инъекций.

Общие расстройства: гипертермия.

Срок годности. 2 года.

Условия хранения.

Хранить при температуре не выше 25 °С в оригинальной упаковке.

Хранить в недоступном для детей месте.

Несовместимость.

Не следует смешивать с другими лекарственными средствами, кроме лекарственных средств, указанных в разделе «Способ применения и дозы».

Упаковка.

По 20 мл в ампулах стеклянных;

по 2 ампулы в контурной ячейковой упаковке, по 1 ячейковой упаковке в пачке из картона;

по 5 ампул в контурной ячейковой упаковке, по 1 ячейковой упаковке в пачке из картона;

по 5 ампул в контурной ячейковой упаковке, по 2 ячейковые упаковки в пачке из картона.

Категория отпуска. По рецепту.

Производитель.

ООО «Юрия-Фарм».

Местонахождение производителя и адрес места осуществления его деятельности.

Украина, 18030, Черкасская обл., г. Черкассы, ул. Вербовецкого, 108. Тел.: (044) 281-01-01.