

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Атериксен

Регистрационный номер: ЛП-007921

Торговое наименование: Атериксен

Международное непатентованное или группировочное наименование: не присвоено

Лекарственная форма: таблетки

Состав

1 таблетка содержит:

действующее вещество: 1-[2-(1-Метилимидазол-4-ил)-этил]пергидроазин-2,6-дион (XC221GI) – 100 мг;

вспомогательные вещества: лактоза (лактопресс), карбоксиметилкрахмал натрия, тальк, магния стеарат.

Описание: круглые плоскоцилиндрические таблетки белого или почти белого цвета с фаской с двух сторон и риской с одной стороны. Допускается наличие вкраплений более темного цвета.

Фармакотерапевтическая группа

Иммунодепрессанты; другие иммунодепрессанты.

Код АТХ: L04AX

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Противовоспалительное средство.

В исследованиях *in vitro* показано, что Атериксен снижал выработку провоспалительных цитокинов IL-6, IL-8, а в доклинических исследованиях на животных - хемокинов IP-10 (CXCL10), MIG (CXCL9), являющихся одними из основных медиаторов острой фазы воспаления, лихорадки и «цитокинового шторма», ассоциирующегося с развитием выраженного вирусного воспаления дыхательных путей и связанных с ним осложнений.

В доклиническом исследовании *in vitro* показано, что механизм действия препарата Атериксен связан также с управлением рН-зависимыми этапами жизненного цикла респираторных вирусов, которые проходят в условиях высокой концентрации ионов водорода, наблюдаемых внутри структур эндосомально-лизосомальной системы клеток организма человека. Атериксен способен блокировать внутриклеточную распаковку генетического материала вируса и его выход в цитоплазму для последующего образования новых вирусных частиц. Предполагается, что данное действие реализуется за счет протон-акцепторных свойств молекулы действующего вещества препарата Атериксен, что обеспечивает ее проникновение через мембрану структур эндосомально-лизосомальной системы в незаряженном состоянии и последующее протонирование в изначально кислой среде внутри этих органелл. Это приводит к повышению рН внутри структур эндосомально-лизосомальной системы и одновременно препятствует быстрому обратному выходу молекулы, находящейся в заряженном состоянии, в цитоплазму.

В доклинических исследованиях на животных показано, что в условиях индуцированной интерфероном γ (ИФН γ) продукции хемокина IP-10 (CXCL10) в респираторном тракте

препарат Атериксен снижал концентрацию этого хемокина, при этом повышенный уровень IP-10 (CXCL10) связывают с развитием интерстициального поражения легких при вирусной инфекции и с риском тяжелого течения COVID-19.

В доклинических исследованиях на животных показано, что препарат Атериксен уменьшал воспаление в легочной ткани и обеспечивал протективный иммунный ответ при инфицировании различными респираторными вирусами.

В доклиническом исследовании на животных по оценке эффективности препарата Атериксен в отношении высокопатогенного штамма коронавируса CoD (SARS coronavirus SoD), вызывающего тяжелый острый респираторный синдром (ТОРС), показано, что его применение приводило к ускорению процесса элиминации вируса из легких.

Проведенные доклинические токсикологические исследования на животных свидетельствуют о низком уровне токсичности и высоком профиле безопасности препарата. По параметрам острой токсичности препарат Атериксен относится к 4 классу токсичности – «Малотоксичные вещества».

В доклинических исследованиях на животных показано, что препарат Атериксен не обладал иммунотоксическими, аллергизирующими, мутагенными и канцерогенными свойствами, не оказывал местнораздражающего действия, не оказывал эмбриотоксического и тератогенного действия, не влиял на репродуктивную функцию.

Фармакокинетика

Всасывание

Действующее вещество быстро поступает в кровь из желудочно-кишечного тракта. В исследовании у здоровых добровольцев при однократном приеме препарата в дозе 200 мг максимальная концентрация (C_{max}) составила 671 ± 509 нг/мл; время ее достижения (T_{max}) – 0,25-1,5 ч. (медиана 0,5 ч.).

Распределение

Практически не связывается с белками плазмы крови. При многократном введении в режиме один раз в сутки практически не накапливается в плазме крови.

Метаболизм

В организме подвергается незначительному гидролизу. Не метаболизируется в печени. Не влияет на систему цитохромов печени человека.

Выведение

В исследовании у здоровых добровольцев период полувыведения ($T_{1/2}$) как при однократном, так и многократном (в течение 5 дней) приеме препарата в дозе 200 мг составил $1,2 \pm 0,2$ ч. В доклинических исследованиях было установлено, что основной процесс выведения происходит через почки (через 48 часов с мочой выводится около 31 % от введенной дозы, с калом – 0,1 %).

Показания к применению

Лечение новой коронавирусной инфекции (COVID-19) легкого течения у взрослых.

Лечение неосложненного гриппа легкой и средней степени тяжести и других острых респираторных вирусных инфекций (ОРВИ) у взрослых.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к действующему веществу или любому другому компоненту препарата.

Дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция.
Нарушение функции печени и/или почек (клинические исследования у данной категории пациентов не проводились).

Беременность.

Период грудного вскармливания.

Детский возраст до 18 лет (эффективность и безопасность у детей не установлены).

С осторожностью

Пожилой возраст.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Применение препарата во время беременности не изучалось, поэтому применение препарата при беременности противопоказано.

Применение препарата во время лактации не изучалось, поэтому при необходимости применения препарата в период грудного вскармливания следует прекратить грудное вскармливание.

Способ применения и дозы

Внутрь.

Прием препарата начинают с момента появления первых симптомов заболевания, предпочтительно не позднее 36 ч от начала болезни.

COVID-19 легкого течения

По 100 мг 2 раза в день. Курс лечения – 14 дней.

Грипп и другие ОРВИ

По 100 мг 2 раза в день. Курс лечения – 5 дней.

Побочное действие

Определение частоты побочных явлений проводится в соответствии со следующими критериями: очень часто ($\geq 1/10$), часто (от $\geq 1/100$ до $< 1/10$), нечасто (от $\geq 1/1000$ до $< 1/100$), редко (от $\geq 1/10000$ до $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$), неизвестно (невозможно оценить на основании имеющихся данных).

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы

Часто: базофилия, эозинофилия, повышение уровня креатинфосфокиназы (КФК), снижение количества нейтрофилов.

Нарушения со стороны нервной системы

Часто: головокружение, дисгевзия.

Желудочно-кишечные нарушения

Часто: жидкий стул, диспепсия, тошнота.

Нарушения со стороны сосудов

Часто: эпистаксис.

Общие нарушения и реакции в месте введения

Часто: усталость.

Если любые из указанных в инструкции побочных эффектов усугубляются или Вы заметили любые другие побочные эффекты, не указанные в инструкции, сообщите об этом врачу.

Передозировка

О случаях передозировки препарата Атериксен до настоящего времени не сообщалось.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Клинические исследования лекарственных взаимодействий препарата Атериксен не проводились.

Особые указания

Применение препарата Атериксен возможно только под наблюдением врача.

При развитии побочного действия необходимо сообщать об этом в установленном порядке для осуществления мероприятий по фармаконадзору.

Всегда применяйте препарат в полном соответствии с рекомендациями лечащего врача.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Не изучалось.

Форма выпуска

Таблетки 100 мг.

По 7, 10, 28 или 30 таблеток в банке из полиэтилена высокой плотности с контролем первого вскрытия, укупоренную крышкой из полипропилена с силикагелем.

Одну банку вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения

При температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Производитель

Производство готовой лекарственной формы:

Закрытое акционерное общество «Обнинская химико-фармацевтическая компания» (ЗАО «ОХФК»), Калужская обл., г. Обнинск, Киевское шоссе, зд. 107.

Выпускающий контроль качества:

Закрытое акционерное общество «Обнинская химико-фармацевтическая компания» (ЗАО «ОХФК»), Калужская обл., г.о. «Город Обнинск», г. Обнинск, Киевское шоссе, зд. 3а, стр. 3.

Владелец регистрационного удостоверения/Организация, принимающая претензии потребителей

АО «Валента Фарм»

141108, Россия, Московская область, г. Щелково, ул. Фабричная, д. 2.

Тел. +7 (495) 933 48 62,

факс +7 (495) 933 48 63.

