

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

НИЦЕРГОЛИН

Регистрационный номер: ЛП-003124

Торговое наименование: Ницерголин

Международное непатентованное наименование: ницерголин

Лекарственная форма: лиофилизат для приготовления раствора для инъекций.

Состав препарата (на 1 ампулу):

Действующее вещество:

Ницерголин – 4,0 мг

Вспомогательные вещества:

Лактозы моногидрат – 30,0 мг

Винная кислота – 1,04 мг

В случае упаковки препарата в комплекте с растворителем:

Состав растворителя (на 1 мл):

Натрия хлорид – 9,0 мг

Вода для инъекций – до 1,0 мл

Описание

Препарат: пористая масса или порошок белого или почти белого цвета.

Растворитель (*в случае упаковки препарата в комплекте с растворителем*): прозрачный бесцветный раствор.

Фармакотерапевтическая группа: альфа-адреноблокатор

Код АТХ: С04АЕ02

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Ницерголин – производное эрголина, α -адреноблокатор.

Ницерголин имеет высокое сродство к α_1 -адренергическим рецепторам и обладает умеренной аффинностью к α_2 -адренергическим рецепторам.

Увеличивает кровообращение в церебральных и периферических артериях в дозах, которые не влияют на артериальное давление или частоту сердечных сокращений.

Фармакокинетика

Основные продукты метаболизма ницерголина: 1,6-диметил-8 β -гидроксиметил-10 α -метоксиэрголин (MMDL, продукт гидролиза) и 6-метил-8 β -гидроксиметил-10 α -метоксиэрголин (MDL, продукт деметилирования под действием изофермента CYP2D6). Соотношение значений площади под кривой «концентрация – время» (AUC) для MMDL и MDL при внутривенном введении ницерголина указывает на выраженный метаболизм при «первом прохождении» через печень. Прием пищи или лекарственная форма не оказывают существенного влияния на степень и скорость всасывания ницерголина. Ницерголин активно (> 90 %) связывается с белками плазмы, причем степень его сродства к α 1-кислому гликопротеину больше, чем к сывороточному альбумину. Показано, что ницерголин и его метаболиты могут распределяться в клетках крови. Фармакокинетика ницерголина при применении доз до 60 мг носит линейный характер и не меняется в зависимости от возраста пациента.

Ницерголин выводится в виде метаболитов, в основном почками (примерно 80 % от общей дозы), и в небольшом количестве (10–20 %) – через кишечник. У пациентов с тяжелыми нарушениями функции почек наблюдается значительное снижение секреции MDL с мочой. При вторичном метаболическом пути с помощью деметилирования (1-DN) образуется 1-диметил-ницерголин, который затем метаболизируется до MDL путем гидролиза эфирных связей.

Показания к применению

Умеренные когнитивные нарушения у пожилых людей с сосудистой патологией, в том числе при деменции.

Противопоказания

Гиперчувствительность, артериальная гипотензия, выраженный атеросклероз периферических сосудов, органические поражения сердца, инфаркт миокарда, стенокардия напряжения, дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция, беременность, период грудного вскармливания, детский возраст до 18 лет, острое кровотечение, тяжелая брадикардия, одновременное применение с симпатомиметиками (альфа- и бета-адреномиметики).

С осторожностью

Гиперурикемия или подагра в анамнезе и/или в сочетании с лекарственными средствами, нарушающими метаболизм или выведение мочевой кислоты.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Препарат противопоказан к применению при беременности, т.к. адекватных и строго контролируемых исследований по безопасности применения препарата в период беременности

не проводилось. В период лечения следует прекратить грудное вскармливание, т.к. ницерголин и продукты его метаболизма выделяются с грудным молоком.

Способ применения и дозы

Внутримышечно, внутривенно капельно, внутриаптериально.

Внутримышечно: рекомендуемая доза 2-4 мг препарата 2 раза в сутки.

4 мг препарата растворяют в 2 или 4 мл натрия хлорида раствора для инъекций 0,9 %. Полученный раствор имеет концентрацию соответственно 2 мг/мл и 1 мг/мл.

Внутривенно: рекомендуемая доза 4-8 мг, вводят капельно. При необходимости введение можно повторять несколько раз в день.

4 или 8 мг препарата растворяют в 100 мл раствора натрия хлорида 0,9 % или раствора декстрозы 5 %, 10 %. Приготовленный раствор имеет концентрацию соответственно 0,04 мг/мл и 0,08 мг/мл.

Внутриаптериально: рекомендуемая доза 4 мг, вводят в течение 2 минут.

4 мг препарата растворяют в 10 мл раствора натрия хлорида 0,9 %. Приготовленный раствор имеет концентрацию 0,4 мг/мл.

Раствор препарата рекомендуется использовать сразу после приготовления.

Доза, продолжительность лечения, путь введения зависят от характера и тяжести заболевания. Предпочтительно начинать лечение с парентерального введения с последующим переходом на пероральный прием препарата.

При хронической почечной недостаточности (сывороточный креатинин ≥ 2 мг/дл) препарат рекомендуется назначать в более низких дозах.

Побочное действие

Частота побочных эффектов: часто ($\geq 1/100$; $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$; $< 1/100$), редко ($\geq 1/10000$; $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$), частота неизвестна (в настоящее время данные о распространенности побочных реакций отсутствуют).

Со стороны иммунной системы: частота неизвестна – аллергические реакции в виде кожного зуда и сыпи.

Со стороны психики: нечасто - психомоторное возбуждение, спутанность сознания, бессонница.

Со стороны нервной системы: нечасто – сонливость, головокружение, головная боль; частота неизвестна - ощущение жара.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: нечасто - снижение артериального давления, «приливы» крови к лицу.

Со стороны желудочно-кишечного тракта: часто – ощущение дискомфорта в животе; нечасто - тошнота, диарея, запор, диспептические явления.

Со стороны кожи и подкожных тканей: нечасто – кожный зуд; частота неизвестна – кожные высыпания.

Общие расстройства и нарушения в месте введения: частота неизвестна - фиброз.

Была отмечена связь развития фиброза (например, легочного, сердечного, клапанов сердца и ретроперитонеального) при применении алкалоидов спорыньи, обладающих агонистической активностью по отношению к 5HT_{2β}-рецепторам серотонина.

Лабораторные и инструментальные данные: нечасто - повышение концентрации мочевой кислоты в крови (выраженность не зависит от дозы и длительности терапии).

Симптомы эрготизма: диспепсия (тошнота, рвота, диарея, абдоминальная боль), вазоконстрикция периферических сосудов, похолодание конечностей, боль в конечностях, парестезия, беспокойство, страх, потеря сознания, изменение в настроении или поведении, развитие судорог.

Передозировка

Симптомы: преходящее выраженное снижение артериального давления (АД).

Лечение: уложить пациента в горизонтальное положение, при необходимости рекомендуется введение симпатомиметических средств под контролем АД.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Ницерголин может усиливать действие гипотензивных препаратов, транквилизаторов и нейролептиков.

Адреномиметики при одновременном применении могут вызывать идиосинкразию.

При одновременном применении с ацетилсалициловой кислотой, другими антиагрегантами, а также антикоагулянтами возможно увеличение времени кровотечений.

Ницерголин метаболизируется под действием изофермента CYP2D6, поэтому нельзя исключить возможность его взаимодействия с лекарственными средствами, которые метаболизируются при участии этого фермента.

Следует соблюдать осторожность при одновременном применении с препаратами, влияющими на метаболизм мочевой кислоты.

Ницерголин потенцирует действие бета-адреноблокаторов на сердце.

Особые указания

После внутривенного введения препарата для предотвращения ортостатической гипотензии пациенту рекомендуется находиться в горизонтальном положении в течение 10-15 минут.

При выраженных побочных явлениях уменьшают дозу или прекращают прием препарата.

Была отмечена связь развития фиброза (например, легочного, сердечного, клапанов сердца и ретроперитонеального) при применении алкалоидов спорыньи, обладающих агонистической активностью по отношению к 5HT_{2β}-рецепторам серотонина.

Симптомы эрготизма (включая тошноту, рвоту, диарею, боль в области живота и периферическую вазоконстрикцию) отмечались при приеме некоторых алкалоидов спорыньи и их производных.

Во время применения препарата следует воздерживаться от употребления алкоголя.

Перед назначением этого класса лекарственных препаратов врачам необходимо ознакомиться с признаками и симптомами передозировки препаратов спорыньи.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

В период лечения необходимо воздерживаться от вождения автотранспорта и занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторной реакции.

Форма выпуска

Лиофилизат для приготовления раствора для инъекций 4 мг.

По 4 мг препарата в ампулы нейтрального стекла вместимостью 5 мл.

5 ампул препарата помещают в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной (ПВХ) или из пленки полиэтилентерефталатной (ПЭТФ).

1 или 2 контурные ячейковые упаковки с препаратом вместе с инструкцией по применению и скарификатором ампульным помещают в пачку из картона.

10 ампул препарата вместе с инструкцией по применению и скарификатором ампульным помещают в пачку из картона для потребительской тары с гофрированным вкладышем.

При использовании ампул с точкой или кольцом излома скарификатор ампульный не вкладывают.

Упаковка для стационаров.

4, 5 или 10 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкциями по применению в количестве, равном количеству контурных ячейковых упаковок, помещают в пачку из картона для потребительской тары.

50 или 100 контурных ячейковых упаковок с препаратом вместе с инструкциями по применению в количестве, равном количеству контурных ячейковых упаковок, помещают в коробку из картона гофрированного.

В случае упаковки препарата в комплекте с растворителем:

По 4 мл растворителя в ампулы нейтрального стекла.

5 ампул растворителя помещают в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной (ПВХ) или из пленки полиэтилентерефталатной (ПЭТФ).

1 контурную ячейковую упаковку с препаратом и 1 контурную ячейковую упаковку с растворителем вместе с инструкцией по применению и скарификатором ампульным помещают в пачку из картона.

При использовании ампул с точкой или кольцом излома скарификатор ампульный не вкладывают.

Упаковка для стационаров.

2 контурные ячейковые упаковки с ампулами препарата и 2 контурные ячейковые упаковки с ампулами растворителя или 5 контурных ячейковых упаковок с ампулами препарата и 5 контурных ячейковых упаковок с ампулами растворителя вместе с инструкциями по применению в количестве, равном количеству контурных ячейковых упаковок с препаратом, помещают в пачку из картона для потребительской тары.

25 или 50 контурных ячейковых упаковок с ампулами препарата и, соответственно, 25 или 50 контурных ячейковых упаковок с ампулами растворителя вместе с инструкциями по применению в количестве, равном количеству контурных ячейковых упаковок с препаратом, помещают в коробку из картона гофрированного.

Срок годности

Препарат – 3 года.

Растворитель – 5 лет.

Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Наименование и адрес производителя

ООО «Эллара»

601122, Владимирская обл., Петушинский р-н, г. Покров, ул. Франца Штольверка, д. 20,
стр. 2

Владелец регистрационного удостоверения и организация, принимающая претензии потребителей

ООО «Эллара»

601122, Владимирская обл., Петушинский р-н, г. Покров, ул. Франца Штольверка, д. 20
тел./факс: (49243) 6-42-22, (49243) 6-42-24