

УТВЕРЖДЕНО
Приказ Министерства
здравоохранения Украины
06.09.11 № 570
Регистрационное удостоверение
№ UA/5252/01/01

ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению препарата

НИЦЕРГОЛИН
(NICERGOLINE)

Состав:

действующее вещество: nicergoline;

1 таблетка содержит 10 мг ницерголина;

вспомогательные вещества: лактоза моногидрат, магния карбонат тяжелый, кислота стеариновая, крахмал картофельный; *оболочка:* магния карбонат тяжелый, сахар, тальк, титана диоксид (E171), повидон, кремния диоксид коллоидный безводный, воск белый.

Лекарственная форма. Таблетки, покрытые оболочкой.

Фармакотерапевтическая группа. Периферические вазодилататоры. Алкалоиды спорыньи.

Код АТС С04А Е02.

Клинические характеристики.

Показания.

Острые и хронические нарушения цереброваскулярного метаболизма вследствие атеросклероза, тромбоза и эмболии церебральных сосудов, транзиторных нарушений церебрального кровообращения (транзиторные ишемические атаки).

Острые и хронические периферические васкулярные метаболические нарушения (органические и функциональные нарушения артерий конечностей, болезнь Рейно и другие синдромы, которые ассоциируются с нарушением кровообращения).

Головная боль.

Как сопутствующая терапия при артериальной гипертензии.

Противопоказания.

Повышенная чувствительность к активному веществу, алкалоидам спорыньи или к какому-нибудь компоненту препарата. Недавно перенесенный инфаркт миокарда, острое кровотечение, ортостатическая гипотензия, тяжелая брадикардия, стенокардия напряжения, выраженный атеросклероз сосудов.

Способ применения и дозы.

Рекомендованная доза препарата - 5-10 мг 3 раза в сутки с одинаковыми интервалами, желательно между приемами пищи, на протяжении длительного времени.

Дозировка и длительность лечения препаратом зависит от конкретной клинической ситуации. В некоторых случаях целесообразно начинать лечение с парентерального введения препарата с последующим продолжением лечения в виде поддерживающей пероральной терапии.

Пациенты пожилого возраста. Коррекцию дозы проводить нет необходимости.

Побочные реакции.

Редко сообщалось о следующих нетяжелых побочных эффектах.

Нарушения со стороны пищеварительного тракта: запор, тошнота, рвота, повышение кислотности желудочного сока, диарея, боль в животе.

Нарушения со стороны сердечно-сосудистой системы: артериальная гипотензия, приступы стенокардии, тахикардия, обморок, похолодание конечностей.

Нарушения со стороны нервной системы: головная боль, спутанность сознания, сонливость, бессонница, головокружение.

Аллергические реакции: ангионевротический отек, зуд, кожные высыпания.

Репродуктивные нарушения у мужчин: нарушение эякуляции.

Общие нарушения: ощущение жара, приливы, повышенное потоотделение, боль в конечностях, повышение температуры тела. Может отмечаться повышение уровня мочевой кислоты в крови, не зависящее от назначенной дозы, ни от длительности лечения.

Передозировка.

При применении ницерголина в высоких дозах может отмечаться временное снижение артериального давления. Как правило, специальное лечение не требуется, достаточно пациента перевести в положение лежа на несколько минут. В исключительных случаях недостаточности кровоснабжения головного мозга и сердца рекомендовано приём симпатомиметиков и постоянный мониторинг показателей артериального давления.

Использование в период беременности или кормления грудью.

Препарат не применяют в период беременности или кормления грудью.

Дети. Препарат не используют детям.

Особенности применения.

В целом в терапевтических дозах ницерголин не приводит к изменениям артериального давления, однако у пациентов, склонных к артериальной гипотензии, препарат может постепенно понижать артериальное давление. В начале лечения возможно развитие ортостатической гипотензии. Для лечения больных с гиперурикемией или подагрой в анамнезе, и/или во время одновременного лечения препаратами, влияющими на метаболизм и экскрецию мочевой кислоты, ницерголин следует применять с осторожностью.

Поскольку около 80 % метаболитов ницерголина выделяется с мочой, желательно уменьшать дозу препарата пациентам с нарушением функции почек (креатинин сыворотки крови ≥ 2 мг/дл или 175 мкмоль/л).

Эффект от применения препарата увеличивается постепенно. Следовательно, препарат надо принимать длительно. Желательно, чтобы каждые 6 месяцев врач оценивал эффект и принимал решение относительно целесообразности дальнейшего приема препарата.

На время применения препарата следует воздержаться от употребления алкоголя.

Препарат нельзя применять пациентам с наследственной непереносимостью галактозы, дефицитом лактазы или синдромом мальабсорбции глюкозы/галактозы.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с другими механизмами.

У некоторых больных во время лечения препаратом могут возникать нежелательные реакции со стороны нервной системы (а именно: головокружение, сонливость и т.п.), поэтому в таких случаях следует избегать управления автотранспортом или работы с другими механизмами.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий.

С осторожностью препарат применяют одновременно с:

- антигипертензивными средствами (ницерголин может потенцировать их эффекты);
- препаратами, которые также метаболизируются системой цитохрома P450 2D6, так как невозможно исключить взаимодействие с этими средствами (такими как хинидин, большинство антипсихотических средств, в том числе клозапин, рисперидон, галоперидол, тиоридазин);
- ацетилсалициловой кислотой (может удлинять время кровотечения);
- препаратами, которые влияют на метаболизм мочевой кислоты (могут изменяться метаболизм и экскреция мочевой кислоты).

Ницерголин нельзя применять одновременно со средствами, возбуждающими центральную нервную систему, альфа- и бета-адреномиметиками. При одновременном применении с антикоагулянтами и антиагрегантами необходимо контролировать параметры свертываемости крови.

Препарат может усиливать эффекты холиномиметических средств.

Фармакологические свойства.

Фармакодинамика.

Ницерголин обладает следующим нейрофармакологическим действием: не только улучшает всасывание и утилизацию глюкозы в мозге, биосинтез белков и нуклеиновой кислоты, но и влияет на различные системы нейромедиаторов.

Также возможно усиление активности холинацетилтрансферазы и плотности мускариновых рецепторов после длительного перорального приема препарата Ницерголин. Кроме этого, ницерголин значительно повышает активность ацетилхолинэстеразы. Как после однократного, так и длительного перорального приема препарата усиливается обмен базального и агонист-чувствительного фосфоинозиотида. Ницерголин так же усиливает активность и перемещение в мембрану Са-зависимых РКС изоформ. Эти ферменты принимают участие в механизме секреции растворимого амилоидного предшественника протеина, который приводит к усилению его высвобождения и к снижению продукции патологического бета-амилоида.

Антиоксидантный эффект и активация ферментов детоксикации препаратом Ницерголин защищает нервные клетки от гибели вследствие окислительной нагрузки и апоптоза.

Ницерголин уменьшает зависимость от возраста снижение синтетазы окиси азота мРНК в нейронах, что может способствовать улучшению когнитивной функции.

Фармакокинетика.

Ницерголин быстро и почти полностью всасывается после приема внутрь. Пик сывороточной радиоактивности после применения в низких дозах (4-5 мг) радиоактивно меченного ницерголина отмечается через 1,5 часа. Однако при приеме терапевтических пероральных доз (30 мг) ³H-меченного ницерголина пик сывороточной радиоактивности в сыворотке крови отмечается через 3 часа с периодом полувыведения препарата около 15 суток (здоровые добровольцы).

Абсолютная биодоступность ницерголина после перорального приема составляет приблизительно 5 %, что обусловлено высоким печеночным клиренсом и пресистемным метаболизмом.

Препарат быстро и экстенсивно распределяется в тканях. Объем распределения ницерголина достаточно высокий, >105 л, что, возможно, обусловлено метаболизмом в крови и распределением в клетках крови и/или тканей.

Ницерголин экстенсивно связывается с протеинами плазмы крови человека, с большим родством к а-кислоту гликопротеину, чем к альбуминам сыворотки крови.

Выделение с мочой является основным путем экскреции, поскольку 80 % общей дозы ницерголина, меченного радиоактивным изотопом, определяется в моче, и только 10-12 % в фекалиях.

При пероральном приеме в дозах 30-60 мг фармакокинетика ницерголина носит линейный характер.

Ницерголин экстенсивно метаболизируется перед выведением. Основной путь метаболизма - гидролиз эфирных связей с образованием MMDL, а потом MDL путем деметилирования. Процесс деметилирования происходит путем каталитического действия изофермента CYP2D6.

У пациентов с тяжелыми нарушениями функции почек отмечается значительное снижение секреции с MDL мочой.

Фармацевтические характеристики.

Основные физико-химические свойства: таблетки, покрытые оболочкой, белого цвета. На поперечном разрезе видно два слоя.

Срок хранения. 3 года.

Условия хранения.

В оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С в месте, недоступном для детей.

Упаковка.

10 таблеток в блистере, по 3 блистера в пачке.

Категория отпуска. По рецепту.

Производитель.

АО «Галичфарм».

Местонахождение.

Украина, 79024, г. Львов, ул. Опрышковская, 6/8.

Дата последнего пересмотра.