

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

НЕРГОЛИН

NERGOLIN

Кратка характеристика на продукта - Приложение 1
УЗМ РУ 11-5506 / 14.08.09
Одобрено: 381 / 15.06.09

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Нерголин 10 mg обвити таблетки

Nergoilin 10 mg coated tablets

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Активно вещество в една обвита таблетка:

Ницерголин (*Nicergoline*) 10 mg.

Помощни вещества: лактоза монохидрат

За пълния списък на помощните вещества вж. 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Обвити таблетки.

Описание: кръгли двойно изпъкнали обвити таблетки с бял или почти бял цвят.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1. Терапевтични показания

- Остри и хронични мозъчни метаболитно-съдови нарушения, в резултат на артериосклероза, тромбоза и емболизъм на мозъчните съдове, преходни нарушения на мозъчното кръвообращение (транзиторни исхемични атаки).
- Остри и хронични периферни метаболитно-съдови нарушения (органични и функционални артериопатии на крайниците, болест на Raynaud, други синдроми, свързани с нарушен кръвоток).
- Главоболие.
- Добавъчна терапия при артериална хипертония.

4.2. Дозировка и начин на приложение

Възрастни – препоръчителна доза 5-10 mg, 3 пъти дневно, на равни интервали от време, за предпочитане между храненията.

Специални групи пациенти

Данните от изследвания върху пациенти с бъбречно увреждане показват, че дозата трябва да бъде редуцирана при приложение на nicergoline на пациенти с бъбречна недостатъчност.



Деца - Този продукт не се препоръчва за деца. При тях безопасността и ефективността не е доказана.

Приема се перорално за предпочитане между храненията. Дозировката и продължителността на лечението се определят индивидуално.

Продължителност на лечението

Лечението с ницерголин обикновено е продължително.

4.3. Противопоказания

- Свръхчувствителност към ницерголин или към някое от помощните вещества или към ергоалкалоиди;
- Остър миокарден инфаркт;
- Остри хеморагии;
- Тежка хипотония и брадикардия.

4.4. Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Обикновено приет в препоръчаните дози ницерголин не оказва влияние върху артериалното налягане. При болни с артериална хипертония, обаче може да предизвика постепенно понижаване на стойностите на артериалното налягане.

Продуктът трябва да се прилага внимателно при пациенти с хиперурикемия или анамнестични данни за подагра и/или провеждащи лечение с лекарствени продукти, които имат ефект върху метаболизма и екскрецията на пикочната киселина.

Този лекарствен продукт съдържа като помощно вещество лактоза, което го прави неподходящ за пациенти с лактозна непоносимост.

4.5. Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Известно е, че ницерголин се метаболизира от CYP 2D6, поради което не може да се изключи възможността за взаимодействие с лекарства, които се метаболизират от същата ензимна система.

При едновременна употреба усилва ефекта на антихипертензивните лекарствени продукти, анксиолитиците и антипсихотичните средства.

Антиацидните средства и холестирамина забавят резорбцията му.

Трябва да се избягва съвместното приложение с продукти възбуждащи ЦНС, алфа- и бета-адреномиметици.



При едновременно приложение с антикоагуланти и антиагреганти е необходим контрол на показателите за съсирваемост на кръвта.

4.6. Бременност и кърмене

Въпреки, че в токсикологични проучвания ницерголин не е показал тератогенен ефект, продуктът трябва да се използва при бременни само в случай на реална необходимост, след преценка на съотношението риск/полза и под директен медицински контрол.

4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Няма данни за въздействие на ницерголин върху способността за шофиране и работа с машини.

4.8. Нежелани лекарствени реакции

Описани са само редки случаи на нежелани лекарствени реакции, които в повечето случаи са временни и отзвучават след спиране на лечението. При някои пациенти могат да се наблюдават:

Сърдечни нарушения – хипотония, брадикардия, синкоп.

Нарушения на нервната система – отпадналост, замаяност, лек световъртеж, топли вълни, нарушение на съня.

Стомашно-чревни нарушения – диспепсия, гадене, повръщане, метеоризъм.

Нарушения на кожата и подкожната тъкан – рубеоza, кожни алергични реакции (еритема, пруритус, екзантем).

4.9. Предозиране

При предозиране може да се наблюдава поява на описаните нежелани реакции.

При случай на предозиране е необходимо да се прекрати приема на продукта, да се направи стомашен лаваж и да се назначат активен въглен и симптоматични средства.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: Периферни вазодилататори, ерго-алкалоиди и производни; АТС код СО4АЕ02.

Ницерголин е полусинтетичен ерголинов дериват. Той притежава както блокиращо, така и миотропно спазмолитично действие, като намалява съдовата резистентност (особено по отношение на съдовете на главния мозък и крайниците) и повишава тяхната проницаемост като подобрява



глюкозната и кислородна утилизация. Инхибира тромбоцитната агрегация. Подобрява мозъчния, белодробния и бъбречния кръвоток и нормализира кръвоснабдяването на крайниците при спастични и облитериращи артериопатии.

Ницерголин повлиява също така и редица клетъчни и молекулярни механизми включени в патофизиологията на деменцията. Ницерголин засилва холинергичната и катехоламинергична невротрансмитерна функция и подобрява свързаните с това когнитивни дефицити; стимулира фосфоинозитидния търновър; модулира протеин киназната C (PKC) транслокация и PKC-медирания процес на секреция на амилоидния прекурсорен протеин; активира протеиновата синтеза; протектира невронната смърт, предизвикана от оксидативен стрес и апоптоза; повишава невронния растежен фактор, осигуряващ подобряване на трофиката на холинергичните неврони.

Ницерголин значително намалява влошаването на мозъчните функции, резултат на хипоксия, като активира биосинтезата на протеини и повишава регионалния обратен захват на норадреналин и допамин в мозъка. Ефектът му върху допаминовия обратен захват е уникален и може да се обясни с антагонистичното действие на допаминовите рецептори.

В терапевтични дози ницерголин, като правило, не повлиява артериалното налягане, но при пациенти с артериална хипертония може да предизвика постепенно снижаване на артериалното налягане.

Двата основни метаболита на ницерголин MDL и MMDL допринасят за цялостната фармакологична активност на ницерголин при хора, като основният метаболит MDL наследява около 80% от неговата активност.

5.2. Фармакокинетични свойства

След венозно приложение ницерголин се подлага на бърза хидролиза на естерната връзка и се образува метаболита 1-methyl-10 α -methoxy-9,10-dihydrolysergol (MMDL). Последващата биотрансформация води до образуването на метаболита 10 α -methoxy-9,10-dihydrolysergol (MDL).

Приблизително 51% от приложената доза се елиминира с урината и само 10% с фецеса.

При перорално приложение се наблюдава почти пълна абсорбция, абсолютната бионаличност е по-малко от 5%. И след перорално приложение



се образуват същите метаболити, като най-вероятно това се дължи на "first pass" ефект. Степента и скоростта на абсорбция на ницерголин, описани чрез MMDL и MDL, изглежда не се повлияват съществено от приема на храна. Обемът на разпределение е повече от 105 L. Метаболитният профил след перорално приложение не се различава съществено от този след венозно приложение. В резултат на изразен "first pass" метаболизъм се образуват MMDL и MDL.

Основният път на елиминиране и при пероралното приложение остава бъбречния. Ницерголин се елиминира слабо във фецеса чрез билиарна екскреция. Поради тази причина трябва да се има предвид намаляване на дозата при пациенти с тежко увреждане на бъбречната функция. Има данни, че процесът на деметилиране на MMDL се осъществява чрез каталитичното действие на CYP 2D6. Поради това трябва да се има предвид възможността за взаимодействие с лекарствени продукти, които също се метаболизират от тази ензимна система.

Ницерголин има линейна фармакокинетика както при млади, така и при възрастни пациенти.

Тъй като фармакокинетиката при пациенти в напреднала възраст е сходна с тази при млади, не е необходимо коригиране на дозите. Това е особено важно, имайки се предвид че този лекарствен продукт се използва при такива пациенти.

5.3. Предклинични данни за безопасност

Токсичност

Токсикологичните тестове върху различни животински видове показват, че nicergoline притежава отлична поносимост

Установени са следните стойности за LD₅₀:

При мъжки мишки след перорално приложение – 860 mg/kg.

При мъжки мишки след венозно приложение – 46 mg/kg.

При мъжки плъхове след перорално приложение – 2800 mg/kg.

При мъжки плъхове след венозно приложение – 43 mg/kg.

Канцерогенност/туморогенност, мутагенност

Няма данни за канцерогенност и туморогенност. Проучванията за мутагенност са негативни.

Репродуктивност и бременност:



Не се установява нарушение на фертилитета при мъжки и женски мишки третирани с дози надвишаващи максималните терапевтични дози при хора.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1. Списък на помощните вещества

Помощни вещества при гранулиране

Царевично нишесте

Лактоза монохидрат

Целулоза, микрокристална

Повидон

Помощни вещества при таблетирание

Целулоза, микрокристална

Магнезиев стеарат

Кросповидон

Помощни вещества при обвиване

Основен бутилметакрилатен съполимер (Eudragit E 100)

Глицерол

Хипромелоза E5-LV

Хипромелоза E15-LV

Пропиленгликол

Полисорбат 80

Титанов диоксид

6.2. Несъвместимости

Не са известни.

6.3. Срок на годност

2 /две/ години от датата на производство.

6.4. Специални условия на съхранение

При температура под 25°C.

Да се съхранява на място недостъпно за деца.

6.5. Данни за опаковката

По 10 обвити таблетки в блистер от PVC/PVDC/AL фолио.

По 3 блистера в картонена кутия

По 30 таблетки в блистер от PVC/PVDC/AL фолио.

По 1 блистер в картонена кутия.



6.6. Специални предпазни мерки при изхвърляне

Няма специални изисквания

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Actavis Group ehf.,

Reykjavikurvegur 76-78, 220 Hafnarfjordur,

Исландия.

8. НОМЕР НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ ЗА УПОТРЕБА

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

Юни 2009 г.

