МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ И СОЦИАЛЬНОГО РАЗВИТИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

НОРПРОЛАК® (NORPROLAC)

наименование лекарственного препарата

Регистрационный номер:

Торговое название: НОРПРОЛАК® (NORPROLAC)

Международное непатентованное название: хинаголид

Лекарственная форма: таблетки

Состав:

1 таблетка 25 мкг содержит:

активное вещество: хинаголида гидрохлорид 27,3 мкг (эквивалентно 25 мкг хинаголида).

вспомогательные вещества: лактозы моногидрат 89,908 мг, целлюлоза микрокристаллическая 24,0 мг, крахмал кукурузный 12,0 мг, гипромеллоза 3,0 мг, магния стеарат 0,7 мг, кремния диоксид коллоидный 0,3 мг, краситель железа оксид красный 0,065 мг.

1 таблетка 50 мкг содержит:

активное вещество: хинаголида гидрохлорид 54,6 мкг (эквивалентно 50 мкг хинаголида).

вспомогательные вещества: лактозы моногидрат 89,82 мг, целлюлоза микрокристаллическая 24,0 мг, крахмал кукурузный 12,0 мг, гипромеллоза 3,0 мг, магния стеарат 0,7 мг, кремния диоксид коллоидный 0,3 мг, индигокармин 0,125 мг.

1 таблетка 75 мкг содержит:

активное вещество: хинаголида гидрохлорид 81,9 мкг (эквивалентно 75 мкг хинаголида).

вспомогательные вещества: лактозы моногидрат 86,993 мг, целлюлоза микрокристаллическая 25,80 мг, крахмал кукурузный 12,9 мг, гипромеллоза 3,225 мг, магния стеарат 0,7 мг, кремния диоксид коллоидный 0,3 мг.

1 таблетка 150 мкг содержит:

активное вещество: хинаголида гидрохлорид 163,8 мкг (эквивалентно 150 мкг хинаголида).

вспомогательные вещества: лактозы моногидрат 173,97 мг, целлюлоза микрокристаллическая 51,6 мг, крахмал кукурузный 25,8 мг, гипромеллоза 6,45 мг, магния стеарат 1,4 мг, кремния диоксид коллоидный 0,6 мг.

Описание

Таблетки 25 мкг: круглые, плоские, со скошенным краем светло-розового цвета (допускаются вкрапления более темного цвета), с гравировкой «Norprolac» (радиально) на одной стороне и «25» (линейно) - на другой.

Таблетки 50 мкг: круглые, плоские, со скошенным краем светло-голубого цвета (допускаются вкрапления более темного цвета), с гравировкой «Norprolac» (радиально) на одной стороне и «50» (линейно) - на другой.

Таблетки 75 мкг: круглые, плоские, со скошенным краем белого или почти белого цвета и гравировкой «Norprolac» (радиально) на одной стороне и «75» (линейно) - на другой.

Таблетки 150 мкг: круглые, плоские, со скошенным краем белого или почти белого цвета и гравировкой «Norprolac» (радиально) на одной стороне и «150» (линейно) - на другой.

Фармакотерапевтическая группа

Дофаминовых рецепторов агонист

Код АТХ: G02CB04

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Хинаголид представляет собой селективный агонист дофаминовых D_2-рецепторов, не относящийся к химической группе производных спорыньи. Благодаря своим дофаминергическим свойствам, препарат оказывает сильное ингибирующее действие на секрецию пролактина передней доли гипофиза, не снижая при этом нормальную концентрацию других гипофизарных гормонов. У некоторых пациентов снижение

секреции пролактина может сопровождаться кратковременным незначительным повышением концентрации гормона роста в плазме крови. Клиническая значимость этого явления неизвестна.

Хинаголид, как ингибитор секреции пролактина пролонгированного действия, является эффективным при назначении внутрь один раз в день пациентам с гиперпролактинемией, приводя к уменьшению выраженности таких клинических симптомов как галакторея, олигоменорея, аменорея, бесплодие и снижение либидо.

Установлено, что длительное лечение хинаголидом приводит к уменьшению размеров или остановке роста пролактинсекретирующих микро- и макроаденом гипофиза.

Клинически значимое снижение концентрации пролактина в крови наступает через 2 часа после приема препарата, достигает максимума через 4-6 часов и сохраняется около 24 часов.

Была установлена прямая зависимость длительности действия хинаголида от величины его дозы, в то время как для пролактинснижающего эффекта такой зависимости нет. Максимальный пролактинингибирующий эффект отмечен после однократного применения дозы 50 мкг. Усиление действия наблюдалось не при увеличении дозы, а при увеличении продолжительности применения.

Фармакокинетика

После однократного приема внутрь препарата, меченного радиоактивной меткой, его активное вещество хинаголид быстро и хорошо всасывается из желудочно-кишечного тракта. Значения плазменных концентраций, измеренные для хинаголида и его метаболитов неселективным радиоиммунным методом (РИА), были близки к порогу количественного определения и не могут служить источником надежной информации.

После однократного приема внутрь препарата, меченного радиоактивной меткой, кажущийся объем распределения хинаголида составляет около 100 л.

Связь хинаголида с белками плазмы составляет около 90%.

Хинаголид в значительной степени метаболизируется при «первом прохождении» через печень.

Обладающие биологической активностью хинаголид и его N-дезэтилированные аналоги обнаруживаются в крови в малых количествах.

Их неактивные коньюгаты с серной и глюкуроновой кислотами циркулируют в крови в более значительных количествах.

Более 95% хинаголида выводится из организма в виде метаболитов с калом и мочой примерно в равных количествах. Основными метаболитами, обнаруженными в моче, являются конъюгированные сульфат и глюкоронид хинаголида и аналоги хинаголида -

N-дезэтил- и N,N-дидезэтил-производные. В кале определяются неконьюгированные формы этих веществ.

Период полувыведения неизмененного хинаголида после однократного приема составляет 11,5 часов при достижении равновесного состояния – 17 часов.

Показания к применению

Гиперпролактинемия (идиопатическая или вызванная пролактинсекретирующей микро- или макроаденомой гипофиза).

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к активному веществу или компонентам препарата,
- Нарушения функций почек или печени,
- Дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция,
- Детский возраст (до 18 лет).

С осторожностью следует применять Норпролак® у пациентов с психическими заболеваниями, в том числе в анамнезе.

Опыт использования препарата Норпролак® у пациентов пожилого возраста отсутствует.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Результаты исследований на животных свидетельствуют об отсутствии у препарата Норпролак® эмбриотоксического или тератогенного действия, однако опыт его применения у беременных женщин все еще ограничен. Пациенткам, желающим сохранить беременность в случае ее наступления, прием препарата Норпролак® следует прекратить, за исключением тех случаев, когда продолжение лечения является жизненно необходимым. Прекращение приема препарата Норпролак® не приводило к увеличению количества самопроизвольных абортов.

В случае отмены препарата Норпролак® при наступлении беременности у пациентки с аденомой гипофиза, показано тщательное наблюдение за пациенткой в течение всего срока беременности.

Поскольку Норпролак® подавляет лактацию, грудное вскармливание, как правило, невозможно. Если все же во время лечения препаратом Норпролак® лактация

продолжается, кормление грудью не рекомендовано, так как неизвестно, выделяется ли хинаголид с грудным молоком.

Способ применения и дозы

Учитывая возможность развития ортостатической гипотензии вследствие дофаминергической стимуляции, дозу препарата Норпролак® до терапевтической следует увеличивать постепенно, начиная лечение с применения "стартовой" упаковки. Принимать Норпролак® предпочтительнее на ночь перед сном, с небольшим количеством пищи.

Взрослые

Оптимальную дозу следует подбирать индивидуально, основываясь на степени уменьшения концентрации пролактина в плазме крови и переносимости. Лечение начинают с использования "стартовой" упаковки. В первые 3 дня препарат назначают в дозе 25 мкг/сутки (таблетки светло-розового цвета); в последующие 3 дня - в дозе 50 мкг/сутки (таблетки светло-голубого цвета). Начиная с 7-го дня и далее, рекомендуемая доза составляет 75 мкг/сутки. При необходимости проводят дальнейшее постепенное увеличение дозы (но не чаще, чем 1 раз в неделю) до достижения оптимального терапевтического эффекта. Поддерживающая доза составляет 75-150 мкг/сутки.

У 1/3 пациентов возникает необходимость применения суточной дозы в 300 мкг/сутки и выше. В подобных случаях суточную дозу препарата можно повышать на 75-150 мкг, но не чаще, чем 1 раз в 4 недели до тех пор, пока не будет достигнут удовлетворительный терапевтический эффект или пока не ухудшится переносимость препарата, что может потребовать перерыва в лечении.

Дети и пациенты пожилого возраста

Опыт применения отсутствует.

Побочное действие

Побочные реакции, описанные при приеме препарата Норпролак®, характерны для препаратов - агонистов дофаминовых рецепторов. Обычно они выражены не настолько сильно, чтобы привести к отмене препарата, и имеют тенденцию к исчезновению при продолжении лечения.

	Очень часто (< 10%)	*Часто* (≥ 1% и < 10%)	*Редко* (> 0,01% и < 1,0%)
Со стороны нервной	Головная боль,	Бессонница	Внезапное

системы	головокружение,		засыпание, острый психоз
Со стороны сердечно-сосудистой системы		Снижение артериального давления	
Со стороны пищеварительной системы	Тошнота, рвота	Анорексия, боли в животе, запор или диарея	
Прочие	Слабость	"Приливы", заложенность носа	

Наблюдались единичные случаи развития строго психоза на фоне приема препарата Норпролак®.

У пациентов с болезнью Паркинсона при приеме высоких доз препарата Норпролак® возможно развитие патологического гемблинга (игровая зависимость, игромания), повышение либидо. Эти нежелательные явления проходят самостоятельно при снижении дозы или отмене препарата.

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

Передозировка

Данные о передозировке отсутствуют. Можно ожидать, что она будет сопровождаться сильной тошнотой, рвотой, головными болями, головокружением, сонливостью, снижением артериального давления и, возможно, коллапсом. Также вероятно появление галлюцинаций. Лечение должно быть симптоматическим.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

До настоящего времени не сообщалось о взаимодействии препарата Норпролак® с другими лекарственными средствами.

Существует теоретическая возможность, что при одновременном применении препарата Норпролак® и мощных блокаторов дофаминовых рецепторов (например, нейролептики), способность первого к угнетению секреции пролактина может снизиться. В связи с этим при одновременном применении указанных препаратов следует соблюдать осторожность.

Прием алкоголя ухудшает переносимость препарата Норпролак®.

Особые указания

Лечение аденом препаратом Норпролак® не заменяет хирургического вмешательства!

На фоне лечения препаратом Норпролак® возможно восстановление детородной функции, угнетенной гиперпролактиемией. Если беременность нежелательна, следует во время терапии использовать адекватные методы контрацепции.

Для профилактики тошноты и рвоты, в случае необходимости, может быть применен антагонист дофамина, например, домперидон, который назначается, по крайней мере, за 1 час до приема препарата Норпролак®. В первые дни терапии, а также при увеличении дозы препарата рекомендуется регулярно контролировать артериальное давление в горизонтальном и вертикальном положениях тела в связи с возможностью развития ортостатической гипотензии и обморока.

При назначении препарата Норпролак®, как любого другого агониста дофаминовых рецепторов, необходимо предупреждать пациентов, особенно страдающих болезнью Паркинсона, о возможности возникновения приступа нарколепсии (внезапное засыпание). У пациентов с психическими заболеваниями прием препарата Норпролак® может вызвать острый психоз.

У пациентов с болезнью Паркинсона при приеме высоких доз препарата Норпролак® возможно развитие патологического гемблинга (игровая зависимость, игромания), повышение либидо. Эти нежелательные явления проходят самостоятельно при снижении дозы или отмене препарата.

Влияние на способность управлять автотранспортом и работать с механизмами

Поскольку иногда на фоне лечения, особенно в первые дни, может возникать сонливость, снижение скорости двигательных и психических реакций, артериальная гипотензия, пациенты должны быть особенно внимательными при вождении транспортных средств и управлении механизмами, а в ряде случаев не должны управлять автотранспортом и/или участвовать в механизированном производственном процессе.

Форма выпуска

Таблетки 25 мкг + 50 мкг ("стартовая" упаковка): 3 таблетки по 25 мкг и 3 таблетки по 50 мкг в блистере из ПВХ/Ал (6 таблеток в блистере). 1 блистер вместе с инструкцией по применению в картонной пачке.

Таблетки 75 мкг и 150 мкг: по 10 таблеток в блистер из ПВХ/Ал. По 3 блистера вместе с инструкцией по применению в картонной пачке.

Условия хранения

При температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

5 лет.

Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Производитель

Новартис Фармасьютикалз ЮК Лтд.,

Умблхерст Роуд, Хоршем,

Западный Суссекс, RH12 5AB, Великобритания

С претензиями и за дополнительной информацией обращаться по адресу:

115054 Москва, Космодамианская наб. 52 стр. 4

Тел. 8 495 287 0343, факс: 8 495 287 0342

Руководитель отдела регистрации ЛП Pharmaceuticals B.V. И. В. Демидова

Ferring Pharmaceuticals B.V. Разрешение № 726 Представительство Ферринг Фармасетикалз Б.В. в Москве