

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Ницерголин-Бинергия, 4 мг, лиофилизат для приготовления раствора для инъекций

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: ницерголин.

Каждая ампула содержит 4 мг ницерголина.

Каждый флакон содержит 4 мг ницерголина.

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Ллиофилизат для приготовления раствора для инъекций.

Ллиофилизат

Ллиофилизат представляет из себя пористую массу или порошок белого или почти белого цвета.

Растворитель

Прозрачный бесцветный раствор.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1. Показания к применению

Препарат показан для лечения умеренных когнитивных нарушений у пожилых людей с сосудистой патологией, в том числе при деменции.

4.2. Режим дозирования и способ применения

В некоторых случаях предпочтительно начать терапию с парентерального введения, затем перейти на прием препарата внутрь для поддерживающего лечения.

Режим дозирования

Внутримышечно

2 – 4 мг (2 – 4) мл два раза в сутки.

Внутривенно

Медленная инфузия 4 – 8 мг в 100 мл 0,9% раствора натрия хлорида или раствора декстрозы 5–10%. По назначению врача эту дозу можно вводить несколько раз в день.

Внутриартериально

4 мг в 10 мл 0,9 % раствора натрия хлорида. Препарат вводят медленно в течение не менее 2 минут.

Особые группы пациентов

Пациенты с нарушением функции почек

Больным с нарушением функции почек (сывороточный креатинин ≥ 2 мг/дл) препарат рекомендуется применять в более низких терапевтических дозах. (см. раздел 5.2.)

Дети и подростки

Препарат не следует применять у детей и подростков до 18 лет, так как безопасность и эффективность ницерголина у детей не установлена.

Способ применения

Внутримышечно, внутривенно, внутриаартериально.

Для внутримышечной инъекции следует использовать поставляемый в комплекте растворитель.

Для внутривенной инъекции/инфузии следует использовать 0,9% раствор хлорида натрия или раствор декстрозы.

Восстановленный раствор рекомендуется использовать сразу после приготовления. Доза, длительность терапии и способ введения зависят от характера и тяжести заболевания.

4.3. Противопоказания

- гиперчувствительность к ницерголину, другим эрготаминам или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1.;
- недавно перенесенный инфаркт миокарда;
- острое кровотечение;
- выраженная брадикардия;
- ортостатическая гипотензия;
- беременность и период лактации;
- детский и подростковый возраст до 18 лет.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

С осторожностью:

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

Одновременный прием с агонистами симпатомиметиков (альфа- и бета-).

Особые указания:

После внутривенного и внутриаартериального введения для предотвращения ортостатической гипотензии пациенту рекомендуется находиться в горизонтальном положении в течение 10–15 минут.

В клинических исследованиях было показано, что при однократном или многократном применении ницерголина может отмечаться снижение систолического и, в большей степени, диастолического артериального давления у пациентов с нормальными показателями и с повышенным артериальным давлением.

Ницерголин ингибирует агрегацию тромбоцитов и снижает вязкость крови, поэтому требуется более частый контроль параметров свертывающей системы крови у предрасположенных пациентов.

Были выявлены случаи фиброза (например, легких, сердца, сердечных клапанов и забрюшинного фиброза), связанные с действием алкалоидов спорыньи, обладающих агонистической активностью к 5-HT_{2B}-рецепторам серотонина.

При применении алкалоидов спорыньи и их производных были зарегистрированы симптомы эрготизма (включая тошноту, рвоту, диарею, абдоминальные боли, вазоконстрикцию периферических сосудов).

Врачи должны иметь представление о возможных симптомах передозировки препаратами спорыньи до назначения этого класса препаратов.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Ницерголин может усиливать действие гипотензивных лекарственных препаратов.

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

При применении ницерголина с ацетилсалициловой кислотой, другими антиагрегантами и антикоагулянтами возможно увеличение времени кровотечения.

Ницерголин влияет на метаболизм и экскрецию мочевой кислоты, в связи с чем, следует соблюдать осторожность при его применении с препаратами, влияющими на метаболизм мочевой кислоты.

Ницерголин потенцирует действие бета-адреноблокаторов на сердце.

Ницерголин обладает антагонистическим действием по отношению к сосудосуживающему эффекту симпатомиметиков посредством его α -адреноблокирующего влияния.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Ницерголин противопоказан при беременности. При необходимости применения препарата в период лактации, грудное вскармливание следует прекратить.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

Несмотря на то, что ницерголин улучшает реакцию и концентрацию внимания, его воздействие на способность управлять автотранспортом и пользоваться сложной техникой специально не изучалось. В любом случае, следует соблюдать осторожность, учитывая характер основного заболевания, особенно принимая во внимание, что в некоторых случаях могут развиваться головокружение или сонливость.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме нежелательных реакций

Частота развития нежелательных реакций представлена в соответствии с классификацией, рекомендованной Всемирной Организацией Здравоохранения: очень часто (>1/10), часто

($\geq 1/100$ и $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$ и $< 1/100$), редко ($\geq 1/10000$ и $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$), частота неизвестна (оценка не может быть проведена на основании имеющихся данных).

Системно-органный класс	Частота	Нежелательные реакции
Нарушения со стороны иммунной системы	Частота неизвестна	аллергические реакции в виде кожного зуда и сыпи
Психические нарушения	Нечасто	психомоторное возбуждение, спутанность сознания, бессонница
Нарушения со стороны нервной системы	Нечасто	сонливость, головокружение, головная боль
	Частота неизвестна	ощущение жара
Нарушения со стороны сосудов	Нечасто	снижение артериального давления, в основном после парентерального введения, «приливы» крови к коже лица
Желудочно-кишечные нарушения	Часто	ощущение дискомфорта в животе
	Нечасто	диарея, запор, тошнота, диспептические явления
Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей	Нечасто	кожный зуд
	Частота неизвестна	кожные высыпания
Общие нарушения и реакции в месте введения	Частота неизвестна	фиброз
Лабораторные и инструментальные данные	Нечасто	повышение концентрации мочевой кислоты в крови (этот эффект не зависит от дозы и длительности терапии)

Описание отдельных нежелательных реакций

Было отмечено развитие фиброза (например, легочного, сердечного, клапанов сердца и ретроперитонеального) при применении алкалоидов спорыньи, обладающих агонистической активностью по отношению к 5-HT_{2B} рецепторам серотонина.

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

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза – риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств – членов Евразийского экономического союза.

Российская Федерация

109012, Москва, Славянская площадь, д. 4, стр. 1

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения (Росздравнадзор)

Телефон: +7 (499) 578-02-20

e-mail: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

www.roszdravnadzor.gov.ru

4.9. Передозировка

Симптомы

Преходящее выраженное снижение артериального давления.

Лечение

Специального лечения обычно не требуется, больному достаточно на несколько минут принять горизонтальное положение. В исключительных случаях при резком нарушении кровоснабжения головного мозга и сердца рекомендуется введение симпатомиметических средств под постоянным контролем артериального давления.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: альфа-адреноблокатор

Код АТХ: C04AE02

Механизм действия и фармакодинамические эффекты

Ницерголин – синтетическое производное алкалоидов спорыньи, улучшает метаболические и гемодинамические процессы в головном мозге, снижает агрегацию тромбоцитов и улучшает гемореологические показатели, повышает скорость кровотока в верхних и нижних конечностях.

Ницерголин проявляет α_1 -адреноблокирующее действие, приводящее к улучшению кровотока. Оказывает прямое воздействие на церебральные нейротрансмиттерные системы – норадренергическую, дофаминергическую и ацетилхолинергическую. На фоне применения препарата увеличивается активность норадренергической, дофаминергической и ацетилхолинергической церебральных систем, что способствует оптимизации когнитивных процессов. В результате длительной терапии ницерголином наблюдается стойкое улучшение когнитивных функций и уменьшение выраженности поведенческих нарушений, связанных с деменцией.

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

Прием пищи или лекарственная форма не оказывают существенного влияния на степень и скорость всасывания ницерголина.

Распределение

Ницерголин активно (> 90%) связывается с белками плазмы, причем степень его сродства к α_1 -кислоте гликопротеину больше, чем к сывороточному альбумину. Объем распределения ницерголина достаточно велик – более 150 литров, что, вероятно, связано с его метаболизмом в крови и распределением в клетки крови и/или ткани.

Биотрансформация

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. Исследования подтверждают отсутствие накопления других метаболитов (включая MMDL) в крови.

Элиминация

Ницерголин выводится в виде метаболитов, в основном через почки (примерно 80% от общей дозы), и в небольшом количестве (10–20%) – через кишечник. У больных с тяжелой почечной недостаточностью наблюдалось значительное снижение степени выведения продуктов метаболизма с мочой по сравнению с пациентами с нормальной функцией почек.

Линейность (нелинейность)

Фармакокинетика ницерголина при применении доз до 60 мг носит линейный характер и не меняется в зависимости от возраста пациента.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Порошок для приготовления раствора для инъекций

Лактозы моногидрат

Винная кислота

Растворитель

Натрия хлорид

Вода для инъекций

6.2. Несовместимость

Данный лекарственный препарат не следует смешивать с другими лекарственными препаратами, за исключением упомянутых в разделе 6.6.

6.3. Срок годности (срок хранения)

4 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Хранить при температуре не выше 25 °С в оригинальной упаковке.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

По 4 мг ницерголина в ампулы из прозрачного бесцветного стекла 1-го гидролитического класса или нейтрального стекла марки НС-3 с точкой излома и насечкой или цветным кольцом излома.

По 4 мг ницерголина во флаконы из прозрачного бесцветного стекла 1-го гидролитического класса или нейтрального стекла марки НС-3, герметично укупоренные пробками из резины, обжатые алюминиевыми колпачками или алюминиевыми комбинированными колпачками.

По 1 флакону с препаратом вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

По 4 ампулы или 4 флакона с препаратом помещают в контурную пластиковую упаковку (поддон) из пленки поливинилхлоридной или из пленки полиэтилентерефталатной.

По 1 контурной пластиковой упаковке (поддону) с препаратом вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

По 5 ампул или 5 флаконов с препаратом помещают в контурную пластиковую упаковку (поддон) из пленки поливинилхлоридной или из пленки полиэтилентерефталатной.

По 1 или 2 контурные пластиковые упаковки (поддона) с препаратом вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

По 2 ампулы или 2 флакона с препаратом в комплекте с 2 ампулами растворителя («Натрия хлорид растворитель для приготовления лекарственных форм для инъекций 0,9 %») по 5 мл помещают в одну контурную пластиковую упаковку (поддон) из пленки поливинилхлоридной или из пленки полиэтилентерефталатной.

По 2 контурные пластиковые упаковки (поддона) с комплектом препарата и растворителя вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

По 4 ампулы или 4 флакона с препаратом и 4 ампулы с растворителем («Натрия хлорид растворитель для приготовления лекарственных форм для инъекций 0,9 %») по 5 мл помещают в отдельные контурные пластиковые упаковки (поддоны) из пленки поливинилхлоридной или из пленки полиэтилентерефталатной.

По 1 контурной пластиковой упаковке (поддону) с препаратом и 1 контурной пластиковой упаковке (поддону) с растворителем вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

По 5 ампул с препаратом и 5 ампул с растворителем («Натрия хлорид растворитель для приготовления лекарственных форм для инъекций 0,9 %») по 5 мл помещают в отдельные контурные пластиковые упаковки (поддоны) из пленки поливинилхлоридной или из пленки полиэтилентерефталатной.

По 1 контурной пластиковой упаковке (поддону) с препаратом и 1 контурной пластиковой упаковке (поддону) с растворителем вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Не все размеры упаковок могут быть доступны для реализации.

6.6. Особые меры предосторожности при уничтожении использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата, и другие манипуляции с препаратом

Для внутримышечной инъекции следует использовать поставляемый в комплекте растворитель.

Для внутривенной инъекции/инфузии следует использовать 0,9% раствор хлорида натрия или раствор декстрозы.

Весь оставшийся лекарственный препарат и отходы следует уничтожить в соответствии с установленными национальным законодательством требованиями.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Россия

АО «Бинергия»

Россия, 143930, Московская область, г.о. Балашиха, г. Балашиха, мкр. Салтыковка, ш. Разинское, д. 69, эт. /помещ. 1/41, офис 106А.

Тел.: 8-(495)-580-55-02

Факс: 8-(495)-580-55-03

e-mail: info@binergia.ru

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Россия

АО «Бинергия»

Россия, 143930, Московская область, г.о. Балашиха, г. Балашиха, мкр. Салтыковка, ш. Разинское, д. 69, эт. /помещ. 1/41, офис 106А.

Тел.: 8-(495)-580-55-02

Факс: 8-(495)-580-55-03

e-mail: info@binergia.ru

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата Ницерголин-Бинергия доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-коммуникационной сети «Интернет» <http://www.eec.eaeunion.org/>.