

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

НІЦЕРІУМ (NICERIUM®)

Склад:

діюча речовина: ніцерголін;

1 таблетка, вкрита цукровою оболонкою, містить 10 мг ніцерголіну;

допоміжні речовини: крохмаль кукурудзяний, лактози моногідрат, повідон, кремнію діоксид колоїдний безводний, магнію стеарат;

оболонка: метакрилатний сополімер (тип А), сахароза, тальк, глюкози розчин, кальцію карбонат, крохмаль кукурудзяний модифікований, повідон, триетилцитрат, віск монтангліколевий, титану діоксид (Е 171), жовтий захід FCF (Е 110).

Лікарська форма. Таблетки, вкриті цукровою оболонкою.

Основні фізико-хімічні властивості:

двоопуклі оранжеві круглі таблетки, вкриті цукровою оболонкою.

Фармакотерапевтична група.

Периферичні вазодилататори. Алкалоїди ріжків.

Код АТХ C04A E02.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Після перорального прийому ніцерголін швидко і екстенсивно метаболізується з утворенням метаболітів, активність яких спостерігалася у центральній нервовій системі на кількох рівнях.

Ніцеріум чинить наступну нейрофармакологічну дію: препарат не тільки покращує поглинання і споживання глюкози у мозку, біосинтез білків і нуклеїнових кислот, а й впливає на різні системи нейромедіаторів.

Посилення активності холінацетилтрансферази і щільності мускаринових рецепторів також спостерігалось після тривалого прийому Ніцеріуму. Ніцерголін значно підвищував активність ацетилхолінестерази. Як після разового, так і після тривалого прийому препарату посилюється обмін базального та агоніст-чутливого фосфоінозитиду. Ніцеріум також посилює активність і переміщення у мембрану Са-залежних РКС ізоформ. Ці ферменти приймають участь у механізмі секреції розчинного амілоїдного попередника протеїну, що призводить до посилення його вивільнення і до зниження продукції патологічного бета-амілоїду.

Антиоксидантний ефект і активація ферментів детоксикації препаратом Ніцеріум захищає нервові клітини від загибелі внаслідок окиснювального навантаження та апоптозу.

Ніцерголін послаблює залежне від віку зниження вмісту синтетази окису азоту мРНК в нейронах, що може сприяти покращанню когнітивної функції.

Фармакокінетика.

Ніцерголін швидко і майже повністю абсорбується після перорального прийому. Пік сироваткової радіоактивності після застосування низьких доз (4-5 мг) радіоактивно міченого ніцерголіну спостерігався через 1,5 години. Однак при прийомі терапевтичних доз (30 мг) ³H-міченого ніцерголіну пік радіоактивності в сироватці крові спостерігався через 3 години з періодом напіввиведення препарату приблизно 15 годин (здорові пацієнти).

Абсолютна біодоступність ніцерголіну після перорального прийому складає приблизно 5 %, що зумовлено високим печінковим кліренсом та пресистемним метаболізмом.

Препарат швидко і екстенсивно розподіляється у тканинах. Об'єм розподілу ніцерголіну досить високий (> 105 л), що, можливо, зумовлено метаболізмом у крові і розподілом у клітинах крові та/або тканин.

Ніцерголін екстенсивно зв'язується з протеїнами плазми крові з більшою спорідненістю до α -кислого глікопротеїну, ніж до альбуміну сироватки крові.

Виведення з сечею є основним шляхом екскреції, оскільки 80 % загальної дози ніцерголіну, міченого радіоактивним ізотопом, визначається у сечі і лише 10-20 % – у фекаліях.

Фармакокінетика носить лінійний характер при прийомі 30-60 мг ніцерголіну.

Ніцерголін екстенсивно метаболізується перед виведенням. У пацієнтів з тяжкими порушеннями функції нирок спостерігається значне зниження екскреції з сечею.

Клінічні характеристики.

Показання.

Гострі та хронічні порушення цереброваскулярного метаболізму внаслідок атеросклерозу, тромбозу і емболії церебральних судин; транзиторні порушення мозкового кровообігу (транзиторні ішемічні атаки).
Головний біль.

Як додаткова терапія при артеріальній гіпертензії.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до активної речовини, алкалоїдів ріжків або будь-якого компонента препарату.

Нещодавно перенесений інфаркт міокарда, гостра кровотеча, ортостатична гіпотензія, ризик колапсу, тяжка брадикардія, одночасне лікування симпатоміметиками, що стимулюють α - або β -рецептори.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

З обережністю препарат застосовують з:

- антигіпертензивними засобами (ніцерголін може потенціювати їх ефекти);
- препаратами, що метаболізуються системою цитохрому P450 D6, тому що неможливо виключити взаємодію з цими засобами (такими як хінідин, більшість антипсихотичних засобів, у тому числі клозапін, рисперидон, галоперидол, тіоридазин);
- ацетилсаліциловою кислотою (може подовжуватися час кровотечі);
- препаратами, що впливають на метаболізм сечової кислоти (можуть змінюватися метаболізм та екскреція сечової кислоти).

Ніцеріум не можна застосовувати одночасно із засобами, які збуджують центральну нервову систему α - та β -адреноміметиками.

При одночасному застосуванні з антикоагулянтами та антиагрегантами необхідно контролювати параметри згортання крові.

Препарат може посилювати ефекти холіноміметичних засобів.

Ніцерголін може потенціювати вплив β -блокаторів на серце.

Особливості застосування.

Загалом у терапевтичних дозах препарат не спричиняє зміни артеріального тиску, однак у пацієнтів, схильних до артеріальної гіпертензії, препарат може поступово знижувати артеріальний тиск.

Слід з обережністю застосовувати препарат у хворих зі стенокардією навантаження та вираженим атеросклерозом. На початку лікування можливий розвиток ортостатичної гіпотензії.

У разі легкої брадикардії препарат треба призначати з особливою обережністю.

Для лікування хворих із гіперурикемією чи подагрою в анамнезі та/або під час одночасного лікування препаратами, що впливають на метаболізм та екскрецію сечової кислоти, Ніцеріум слід застосовувати з обережністю.

Оскільки приблизно 80 % метаболітів ніцерголіну виділяється з сечею, бажано зменшувати дозу препарату пацієнтам з порушенням функції нирок (креатинін сироватки крові ≥ 2 мг/дл або ≥ 175 ммоль/л).

Таблетки Ніцеріум містять барвник жовтий захід FCF (E 110), що може спричинити реакції, подібні до алергічних, у тому числі бронхіальну астму в осіб з особливою чутливістю до цієї речовини. Алергія на цю речовину найчастіше зустрічається в осіб, чутливих до ацетилсаліцилової кислоти.

Препарат містить сахарозу, тому його не слід призначати пацієнтам з рідкісними спадковими формами непереносимості галактози, дефіцитом лактази, сахарази-ізомальтази або синдромом глюкозо-галактозної мальабсорбції.

Ефект від застосування препарату збільшується поступово. Отже, препарат слід приймати протягом тривалого часу. Бажано, щоб кожні 6 місяців лікар оцінював ефект і приймав рішення щодо доцільності продовження застосування препарату.

На період застосування препарату слід утримуватися від вживання алкоголю.

Виникнення фіброзу (наприклад фіброзу легень, серця, серцевих клапанів та перитонеального фіброзу) асоціювалося з використанням деяких алкалоїдів ріжків, яким притаманна агоністична активність до 5-HT_{2B}-рецепторів серотоніну.

Повідомлялося про виникнення симптомів ерготизму (включаючи нудоту, блювання, діарею, абдомінальний біль та звуження периферичних судин) при застосуванні деяких алкалоїдів ріжків та їх похідних.

Перед призначенням цього класу лікарських засобів лікарям необхідно ознайомитися з ознаками та симптомами передозування препаратами, що містять ріжки.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Токсикологічні дослідження не виявили тератогенного впливу ніцерголіну. Враховуючи показання препарату, його застосування вагітним жінкам та жінкам, які годують груддю, малоймовірне. Якщо показання до призначення лікування обґрунтоване, лікування необхідно розпочинати тільки після оцінки співвідношення «ризик/користь».

Не слід застосовувати препарат у період годування груддю, оскільки невідомо, чи потрапляє ніцерголін у грудне молоко.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

Хоча клінічні ефекти ніцерголіну використовують для покращення уваги та концентрації, його вплив на здатність керувати транспортними засобами та працювати з іншими автоматизованими системами при цьому ніколи не вивчався. У будь-якому випадку необхідно дотримуватись обережності, беручи до уваги основне захворювання пацієнтів.

Під час лікування препаратом можливе виникнення побічних реакцій з боку нервової системи (а саме – запаморочення, сонливість тощо), тому у таких випадках слід утриматися від керування автотранспортом або роботи з іншими механізмами.

Спосіб застосування та дози.

Перед початком лікування препаратом Ніцеріум слід виключити можливість того, що порушення є наслідком основного захворювання, яке потребує спеціального лікування.

Для забезпечення кращого всмоктування таблетки слід ковтати цілими, запиваючи певною кількістю рідини (наприклад, склянкою води), до їди.

Рекомендована доза препарату – 5-10 мг 3 рази на добу з однаковим інтервалом, бажано між прийомами їжі, протягом тривалого часу.

При призначенні ніцерголіну у дозі 5 мг застосовують препарат у необхідному дозуванні.

Дозування, тривалість застосування препарату залежить від конкретної клінічної ситуації та визначається лікарем індивідуально. У деяких випадках доцільно розпочинати лікування з парентерального введення з подальшим продовженням лікування у вигляді підтримуючої пероральної терапії.

Пацієнти літнього віку. Корекцію дозування проводити не потрібно.

Діти.

Препарат не застосовують дітям.

Передозування.

Симптоми: значне зниження артеріального тиску, атаксія, задишка і тремор.

Лікування: промивання шлунка, застосування активованого вугілля та відповідне симптоматичне лікування для підтримання функцій життєво важливих органів і систем. Може спостерігатися тимчасове зниження артеріального тиску. Спеціальне лікування зазвичай не потрібне, достатньо пацієнта покласти у положення лежачи на кілька хвилин. У виняткових випадках – введення непрямих або прямих а-симпатоміметиків; у випадку вазоспазму – застосування вазодилаторів (залежно від ситуації і ознак – антагоністів кальцію, папаверину, теофіліну). Завжди необхідним є моніторинг серцево-судинної системи.

Побічні реакції.

Рідко повідомлялося про наступні нетяжкі побічні ефекти.

З боку травного тракту: запор, нудота, блювання, збільшення кислотності шлункового соку, діарея, біль у животі.

З боку серцево-судинної системи: артеріальна гіпотензія, непритомність, напади стенокардії, похолодання кінцівок, тахікардія.

З боку нервової системи: збуджений стан, запаморочення, головний біль, сплутаність свідомості, сонливість, безсоння.

Алергічні реакції: ангіоневротичний набряк, свербіж, шкірні висипання.

З боку репродуктивної системи у чоловіків: порушення еякуляції

Загальні розлади: відчуття жару, припливи, підвищена пітливість, біль у кінцівках, підвищення температури тіла.

Спостерігалось підвищення рівня сечової кислоти у крові, що не залежало як від призначеної дози, так і від тривалості лікування.

Термін придатності.

2 роки.

Умови зберігання.

Зберігати при температурі не вище 25 °C.

Зберігати в недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 10 таблеток у блістері; по 5(10 ´ 5) блістерів у картонній коробці;

по 25 таблеток у блістері; по 2(25 ´ 2) блістери у картонній коробці.

Категорія відпуску.

За рецептом.

Виробник.

Салютас Фарма ГмбХ, Німеччина, підприємство компанії Сандоз – відповідальний за випуск серії

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

Отто-вон-Гюріке-Аллес, 1, 39179 Барлебен, Німеччина.