

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

СЕРМИОН[®]

Регистрационный номер: П N011253/02

Торговое наименование: Сермион[®]

Международное непатентованное или группировочное наименование: ницерголин

Лекарственная форма: лиофилизат для приготовления раствора для инъекций

Состав:

1 флакон с лиофилизатом содержит:

действующее вещество: ницерголин – 4 мг;

вспомогательные вещества: лактозы моногидрат 40 мг, винная кислота 1,04 мг.

1 ампула с растворителем содержит:

натрия хлорид 34 мг, бензалкония хлорид 0,2 мг, вода для инъекций q.s. до 4 мл.

Описание:

Лиофилизат: лиофилизированный порошок или пористая масса белого цвета.

Растворитель: прозрачная бесцветная жидкость.

Фармакотерапевтическая группа: альфа-адреноблокатор

Код АТХ: C04AE02

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Ницерголин – производное эрголина, 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, и 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.

Фармакокинетика

Основные продукты метаболизма ницерголина: 1,6-диметил-8β-гидроксиметил-10α-метоксиэрголин (MMDL, продукт гидролиза) и 6-метил-8β-гидроксиметил-10α-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. Прием пищи или лекарственная форма не оказывают существенного влияния на степень и скорость всасывания ницерголина. Ницерголин активно (> 90 %) связывается с белками плазмы, причем степень его сродства к α1-кислороду гликопротеину больше, чем к сывороточному альбумину. Объем распределения ницерголина достаточно велик - > 105 литров, что, вероятно, связано с его метаболизмом в крови и распределением в клетки крови и/или ткани. Фармакокинетика ницерголина при применении доз до 60 мг носит линейный характер и не меняется в зависимости от возраста пациента.

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

Показания к применению

Умеренные когнитивные нарушения у пожилых людей с сосудистой патологией, в том числе при деменции.

Противопоказания

Недавно перенесенный инфаркт миокарда, острое кровотечение, выраженная брадикардия, нарушение ортостатической регуляции, повышенная чувствительность к ницерголину, другим производным эрготамина или другим компонентам препарата, возраст до 18 лет, беременность, период грудного вскармливания.

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-).

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

В связи с отсутствием специальных исследований в период беременности Сермион[®] противопоказан. На время применения препарата необходимо отказаться от грудного вскармливания, так как ницерголин и продукты его метаболизма проникают в молоко матери.

В исследованиях на животных не отмечали влияния ницерголина на фертильность.

Способ применения и дозы

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 в течение 2 минут.

Восстановленный раствор рекомендуется использовать сразу после приготовления. Доза, длительность терапии и способ введения зависят от характера заболевания. В некоторых случаях предпочтительно начать терапию с парентерального введения, а затем перейти на прием препарата внутрь для поддерживающего лечения.

Больным с нарушением функции почек (сывороточный креатинин ≥ 2 мг/дл) Сермион[®] рекомендуется применять в более низких терапевтических дозах.

Побочное действие

Системно-органный класс	Очень частые $\geq 1/10$	Частые $\geq 1/100$ до $< 1/10$	Нечастые $\geq 1/1\ 000$ до $< 1/100$	Редкие $\geq 1/10\ 000$ до $< 1/1\ 000$	Очень редкие $< 1/10,000$	Частота неизвестна (невозможно оценить на основании имеющихся данных)

<i>Нарушения психики</i>			психомоторное возбуждение, спутанность сознания, бессонница			
<i>Нарушения со стороны нервной системы</i>			сонливость, головокружение, головная боль			ощущение жара
<i>Нарушения со стороны сосудов</i>			снижение артериального давления (АД), в основном после парентерального введения, «приливы» крови к коже лица			
<i>Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта</i>		ощущение дискомфорта в животе	диарея, запор, тошнота, диспептические явления			
<i>Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей</i>			кожный зуд			кожные высыпания
<i>Лабораторные и инструментальные данные</i>			повышение концентрации мочевой кислоты в крови (этот эффект не зависит от дозы и длительности терапии)			

<i>Общие расстройства и нарушения в месте введения</i>						фиброз
<i>Нарушения со стороны иммунной системы</i>						аллергические реакции в виде кожного зуда и сыпи

Была отмечена связь развития фиброза (например, легочного, сердечного, клапанов сердца и ретроперитонеального) при применении алкалоидов спорыньи, обладающих агонистической активностью по отношению к 5HT_{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.

Передозировка

Симптомы: преходящее выраженное снижение АД. 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 АД.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Сермион[®] может усиливать действие гипотензивных средств. Сермион[®] 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, 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 альфа-адреноблокирующего влияния.

Особые указания

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. Эти результаты могут варьировать, так как другие исследования не показали изменения в значениях артериального давления. Больным рекомендуется находиться в горизонтальном положении в течение нескольких минут после инъекции Сермиона[®], особенно в начале лечения, из-за возможного выраженного снижения АД.

Была отмечена связь развития фиброза (например, легочного, сердечного, клапанов сердца и ретроперитонеального) при применении алкалоидов спорыньи, обладающих агонистической активностью по отношению к 5HT_{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.

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

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Несмотря на то, что Сермион[®] 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.

Форма выпуска

Лиофилизат для приготовления раствора для инъекций, 4 мг.

Лиофилизат для приготовления раствора для инъекций: по 4 мг ницерголина в бесцветном стеклянном флаконе типа I, закупоренном резиновой пробкой и запечатанном алюминиевым колпачком с вкладышем в виде пластикового диска;

Растворитель: по 4 мл в бесцветной стеклянной ампуле типа I.

По 1 флакону с лиофилизатом и 1 ампуле с растворителем вместе с инструкцией по применению помещают в индивидуальную картонную пачку, состоящую из двух отделений, с контролем первого вскрытия или без него. 4 индивидуальные картонные пачки помещают в общую картонную пачку с контролем первого вскрытия или без него.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

Лиофилизат - 4 года; растворитель – 5 лет.

Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту

Держатель регистрационного удостоверения:

Апджон ЮЭс 1 ЭлЭлСи, США

235 Ист 42 Стрит, г. Нью-Йорк, штат Нью-Йорк, 10017, США

Urjohn US 1 LLC, USA

235 East 42nd Street, New York, New York, 10017, USA

Производитель

Лиофилизат:

Производитель готовой лекарственной формы/ Фасовщик (первичная упаковка): Вайет Фарма С.А., Испания

Аутовиа дел Норте А1, км 23, десвио Альгете, км 1, Сан Себастьян де лос Рейес, 28700 Мадрид, Испания;

Wyeth Farma S.A., Spain

Autovia del Norte A1, Km 23, desvio Algete, Km 1, San Sebastian de los Reyes, 28700 Madrid, Spain

Упаковщик (вторичная/ третичная упаковка)/ Выпускающий контроль качества:

Пфайзер МФГ. Бельгия Н.В., Бельгия

Рийксвег 12, 2870 Пуурс, Бельгия

Pfizer MFG. Belgium N.V., Belgium

Rijksweg 12, 2870 Puurs, Belgium

Растворитель:

Производитель:

Пфайзер МФГ. Бельгия Н.В., Бельгия

Рийксвег 12, 2870 Пуурс, Бельгия

Pfizer MFG. Belgium N.V., Belgium

Rijksweg 12, 2870 Puurs, Belgium

Претензии потребителей направлять по адресу ООО «Пфайзер»:

123112, г. Москва, Пресненская наб., д. 10,

БЦ «Башня на Набережной» (Блок С)

Телефон: +7 (495) 287-5000

Факс: +7 (495) 287-5300