

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

СЕРМИОН®

Регистрационный номер:

Торговое название препарата: Сермион®

Международное непатентованное название: ницерголин

Лекарственная форма:

таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Состав:

1 таблетка содержит:

Действующее вещество: ницерголин 30,000 мг

Вспомогательные вещества: кальция гидрофосфат дигидрат 72,690 мг, микрокристаллическая целлюлоза PH101 22,400 мг, магния стеарат 3,610 мг, натрия карбоксиметилцеллюлоза 1,300 мг;

Пленочная оболочка: гипромеллоза 2,8985 мг, титана диоксид (E171) 0,7246 мг, полиэтиленгликоль 6000 0,2899 мг, железа оксид желтый (E172) 0,0725 мг, силикон 0,0145 мг.

Описание:

Круглые, двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой, желтого цвета.

Фармакотерапевтическая группа: альфа-адреноблокатор

Код АТХ: C04AE02

Фармакологические свойства

Фармакодинамические свойства

Ницерголин – производное эрголина, улучшает метаболические и гемодинамические процессы в головном мозге, снижает агрегацию тромбоцитов и улучшает гемореологические показатели крови. Ницерголин увеличивает мозговой кровоток и потребление кислорода, а также улучшает электроэнцефалограмму (ЭЭГ), особенно при гипоксическом и ишемическом синдромах. Ницерголин проявляет α1-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.

Фармакокинетические свойства

После приема внутрь, ницерголин быстро и практически полностью абсорбируется. 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 приеме ницерголина внутрь указывает на выраженный метаболизм при «первом прохождении» через печень. После приема 30 мг ницерголина внутрь максимальные концентрации MMDL (21 ± 14 нг/мл) и MDL (41 ± 14 нг/мл) достигались примерно через 1 и 4 часа соответственно, затем концентрация MDL снижалась с периодом полувыведения 13 – 20 ч. 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-кислому гликопротеину больше, чем к сывороточному альбумину. Показано, что ницерголин и его метаболиты могут распределяться в клетках крови. Фармакокинетика ницерголина при применении доз до 60 мг носит линейный характер и не меняется в зависимости от возраста пациента.

Ницерголин выводится в виде 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

Симптоматическая терапия когнитивных нарушений, в том числе деменции, при хронических цереброваскулярных и органических поражениях головного мозга, сопровождающихся снижением памяти, концентрации внимания, мышления, активности, повышенной утомляемостью, эмоциональными расстройствами.

Примечание: перед началом лечения ницерголином необходимо удостовериться, что данные симптомы не являются проявлением другого заболевания (как например, внутренних болезней, психиатрических или неврологических заболеваний) и не требуют специфической терапии.

Противопоказания

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

С осторожностью

Препарат следует применять с осторожностью у пациентов с гиперурикемией, подагрой в анамнезе и/или во время сопутствующей терапии препаратами, которые могут влиять на метаболизм и экскрецию мочевой кислоты.

У пациентов, получающих ницерголин, агонисты (альфа и бета) группы симпатомиметиков следует применять с осторожностью (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными препаратами»).

Беременность и период грудного вскармливания

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

Способ применения и дозы

Сермион® применяется внутрь, независимо от приема пищи, через равные промежутки времени. Таблетки следует запивать небольшим объемом жидкости, не разжевывая.

Рекомендованная суточная доза составляет 30 – 60 мг в зависимости от тяжести симптомов и индивидуального ответа на лечение у пациента.

Терапевтическая эффективность препарата развивается постепенно и курс лечения должен быть не менее 3 месяцев. Длительность лечения не ограничена, при условии правильного применения препарата, при этом врач должен периодически (по крайней мере каждые 6 месяцев) оценивать эффект лечения и целесообразность его продолжения.

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

Побочное действие

В следующей таблице приведены нежелательные лекарственные реакции (НЛР) с разделением на категории по стандартным системно-органным классам (СОК) в порядке уменьшения степени их медицинской серьезности или клинической значимости в каждой категории частоты и СОК.

Системно-органный класс	Очень часто $\geq 1/10$	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 (невозможно определить на основании имеющихся данных)
Нарушения со стороны психики			Тревожное возбуждение, спутанность сознания, бессонница			
Нарушения со стороны нервной системы			Сонливость, головокружение, головная боль			Ощущение жара ^a
Нарушения со стороны сосудов			Гипотензия, гиперемия			
Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта		Неприятные ощущения в животе	Диарея, тошнота, запор			
Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей			Зуд			Сыпь ^a
Общие расстройства и нарушения в месте введения						Фиброз ^a
Лабораторные и инструментальные данные			Повышение уровня мочевой кислоты в крови			

^a Оценка частоты НЛР выполнялась на основе данных, полученных в ходе исследований, которые описаны в комплексном резюме по безопасности (НЛР, возникшие после начала лечения, любой причинной обусловленности). Этот объединенный анализ безопасности включает данные из 8 двойных слепых контролируемых исследований у пациентов с легкой или умеренной деменцией, 1246 из которых получали ницерголин. «Правило трех» не применялось, поскольку приведенные в комплексном резюме по безопасности (КРБ) данные были получены при применении ницерголина в популяции, включавшей менее 3000 пациентов.

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 препаратами

Сермион® следует с осторожностью назначать вместе с указанными ниже препаратами.

Антигипертензивные препараты: ницерголин может усиливать действие гипотензивных средств. Ницерголин может усиливать действие бета-адреноблокаторов на сердце.

Симпатомиметические препараты (альфа- и бета-): ницерголин может подавлять сосудосуживающий эффект симпатомиметических препаратов благодаря своему альфа-адреноблокирующему действию.

Лекарственные средства, метаболизируемые ферментом CYP 2D6: ницерголин метаболизируется под действием изофермента CYP2D6, поэтому нельзя исключить возможность его взаимодействия с препаратами, которые метаболизируются при участии этого же фермента.

Антиагреганты и антикоагулянты (например, ацетилсалициловая кислота): ницерголин усиливает воздействие этих соединений на гемостаз, поэтому может увеличиваться длительность времени кровотечения.

Препараты, влияющие на метаболизм мочевой кислоты: в связи с тем, что ницерголин может усилить бессимптомное повышение уровня мочевой кислоты в сыворотке крови.

Особые указания

В клинических исследованиях было показано, что при однократном или многократном применении ницерголина может отмечаться снижение систолического и в гораздо меньшей 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 систолического или диастолического артериального давления.

Была отмечена связь развития фиброза (например, легочного, сердечного, клапанов сердца и ретроперитонеального) при применении алкалоидов спорыньи, обладающих агонистической активностью по отношению к 5HT_{2β} 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 автомобилем и другими механизмами

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

Форма выпуска

По 15 таблеток в блистере (ПВХ/ПВДХ-алюминиевая фольга/ПВДХ). По 2 блистера вместе с инструкцией по применению помещают в картонную пачку с контролем первого вскрытия.

Условия хранения

При температуре не выше 25°C.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

По рецепту

Производитель

Пфайзер Италия С.р.Л., Италия

Марино дель Тронто, 63100 Асколи Пичено, Италия

Владелец регистрационного удостоверения:

Апджон ЮЭс 1 ЭлЭлСи, США

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

Upjohn US 1 LLC, USA

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

Претензии потребителей направлять по адресу:

ООО «Пфайзер»

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

БЦ «Башня на Набережной» (Блок С).

Тел.: +7 (495) 287-50-00

Факс: +7 (495) 287-53-00

Менеджер по регистрации

И.Н. Лаврентьев