

ЗАТВЕРДЖЕНО
Наказ Міністерства охорони
здоров'я України
02.02.2009 № 51
Реєстраційне посвідчення
№ UA/9337/01/01
№ UA/9338/01/01
№ UA/9338/01/02

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
НОРПРОЛАК
(NORPROLAC®)

Склад:

діюча речовина: хінаголід гідрохлорид;

1 таблетка містить хінаголід гідрохлориду 27,3 мкг, 54,6 мкг, 81,9 мкг і 163,8 мкг, що відповідає 25, 50, 75 або 150 мкг хінаголід відповідно;

допоміжні речовини: кремнію діоксид колоїдний безводний, магнію стеарат, гіпромелоза, крохмаль кукурудзяний, целюлоза мікрокристалічна, лактози моногідрат, заліза оксид червоний (Е 172) (лише в таблетках по 25 мкг), індигокарміновий лак (Е 132) (лише в таблетках по 50 мкг).

Лікарська форма. Таблетки.

Фармакотерапевтична група.

Агоністи дофамінових рецепторів. Інгібітори синтезу пролактину. Код АТС G02C B04.

Клінічні характеристики.

Показання.

Ідіопатична гіперпролактинемія.

Гіперпролактинемія, спричинена пролактин-секретуючою мікро- або макроаденомою гіпофіза.

Противоказання.

Підвищена чутливість до діючої речовини або до інших компонентів препарату.

Порушення функції нирок або печінки.

Наявність в анамнезі психічних розладів.

Спосіб застосування та дози.

З огляду на можливість розвитку ортостатичної гіпотонії внаслідок дофамінергічної стимуляції дозу Норпролаку слід збільшувати до терапевтичної поступово, починаючи лікування із застосування таблеток по 25 мкг, 50 мкг. Приймати Норпролак слід один раз на добу, бажано на ніч, перед сном, з невеликою кількістю їжі.

Дорослі.

Оптимальну дозу препарату слід підбирати індивідуально, враховуючи ступінь зменшення рівня пролактину в плазмі крові й переносимість.

Лікування розпочинають із застосування таблеток по 25 мкг, 50 мкг. У перші 3 дні препарат призначають у дозі 25 мкг/добу; у наступні 3 дні – в дозі 50 мкг/добу. Починаючи з 7-го дня й далі рекомендована доза становить 75 мкг/добу. При необхідності здійснюють подальше поступове збільшення дози до досягнення оптимального терапевтичного ефекту. Підтримуюча доза становить 75 - 150 мкг/добу.

У 1/3 пацієнтів виникає необхідність застосування добової дози 300 мкг/добу й вище. У таких випадках добову дозу препарату можна підвищувати в межах від 75 до 150 мкг з інтервалами не менше 4 тижнів до досягнення задовільного терапевтичного ефекту або погіршення переносимості препарату, що може потребувати перерви в лікуванні.

Побічні реакції.

Побічні ефекти застосування Норпролаку, зазвичай, не потребують відміни препарату і зникають при продовженні терапії.

Побічні ефекти розподілені за частотою проявів на групи: більше 10 % – дуже часто; 1 - 10 % – часто; 0,1 - 1 % – нечасто; 0,01 - 0,1 % – рідко; менше 0,01 % – дуже рідко, включаючи поодинокі випадки.

Дуже часто: нудота, блювання, головний біль, запаморочення, втома. Ці побічні реакції розвиваються переважно в перші кілька днів після початку терапії й носять короткочасний характер. За необхідності блювання і нудоту можна усунути прийомом будь-якого допамінергічного антагоніста (наприклад, домперидону) протягом декількох днів. Застосування даного препарату слід здійснювати, принаймні, за годину до прийому Норпролаку.

Часто: анорексія, біль у животі, запор або діарея, безсоння, набряки, гіперемія, закладеність носа, артеріальна гіпотензія. Внаслідок розвитку ортостатичної гіпотензії, що може призвести до непритомності, рекомендується регулярно перевіряти артеріальний тиск у горизонтальному й вертикальному положенні тіла в перші дні терапії, а також при збільшенні дози препарату.

Дуже рідко терапія із застосуванням Норпролаку призводила до розвитку гострого психозу. Зазвичай із припиненням терапії цей побічний ефект зникав. Його розвиток спостерігався й у пацієнтів, у яких раніше розлади подібного типу не спостерігалися. Застосування хінаголід у може спричинити сонливість.

Передозування.

Про гостру інтоксикацію Норпролаку дані відсутні. Можливі симптоми: сильна нудота, блювання, головний біль, запаморочення, сонливість, артеріальна гіпотензія, непритомність. Також ймовірна поява галюцинацій.

У випадку інтоксикації показане симптоматичне лікування.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Досвід застосування Норпролаку в період вагітності дуже обмежений. Тому жінкам слід припинити застосування Норпролаку при підтвердженні вагітності, якщо немає вагомих клінічних причин для продовження терапії. Припинення застосування Норпролаку не призводило до збільшення кількості мимовільних викиднів.

Якщо вагітність підтверджена у хворої з аденомою гіпофіза й застосування Норпролаку було припинено, то протягом усього періоду вагітності необхідно проводити пильний моніторинг її стану.

Норпролак інгібує секрецію пролактину, що призводить до пригнічення лактації. Тому годування груддю зазвичай неможливе. Якщо ж процес лактації не порушився у ході терапії, годування груддю не рекомендовано, оскільки не відомо, чи виділяється хінаголід у грудне молоко.

Діти.

Досвід застосування Норпролаку у дітей відсутній.

Особливості застосування.

Застосування хінаголідіду може спричинити виникнення сонливості. Одночасне призначення інших агоністів допаміну, особливо у пацієнтів з хворобою Паркінсона, може призвести до розвитку гострого епізоду психічних розладів. Слід з обережністю застосовувати Норпролак у пацієнтів, історія хвороби яких включає психічні розлади.

При лікуванні Норпролаком можливе відновлення дітородної функції, пригніченої гіперпролактинемією. Якщо вагітність небажана, під час терапії Норпролаком необхідно використовувати оптимальні методи контрацепції.

Для профілактики нудоти і блювання, у разі потреби, може бути застосований антагоніст допаміну, наприклад, домперидон, що призначається принаймні за 1 годину до прийому Норпролаку.

У перші дні терапії, а також при збільшенні дози препарату рекомендується регулярно контролювати артеріальний тиск у горизонтальному й вертикальному положенні тіла у зв'язку з можливістю розвитку ортостатичної гіпотонії й непритомності.

Досвід застосування препарату в осіб літнього віку відсутній.

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

Під час терапії Норпролаком слід утриматись від керування транспортними засобами та роботи зі складними механізмами через зниження уваги і можливий розвиток сонливості.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Не повідомлялося про взаємодію препарату Норпролак з іншими лікарськими засобами.

Існує теоретична можливість, що при одночасному застосуванні препарату Норпролак і препаратів, що мають виражені антидофамінергічні властивості (наприклад, нейролептики), здатність першого до пригнічення секреції пролактину може знизитися. У зв'язку з цим при одночасному призначенні зазначених препаратів слід дотримуватися обережності.

Прийом алкоголю погіршує переносимість Норпролаку.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Хінаголід являє собою селективний агоніст дофамінових D₂-рецепторів, що не належить до хімічної групи похідних ріжків. Завдяки своїм дофамінергічним властивостям препарат чинить сильну інгібуючу дію на секрецію пролактину передньої долі гіпофіза, не знижуючи при цьому нормальні рівні інших гіпофізарних гормонів. У деяких пацієнтів зниження секреції пролактину може супроводжуватися короточасним незначним підвищенням рівня гормона росту в плазмі крові. Клінічна значимість цього явища не відома.

Норпролак як інгібітор секреції пролактину пролонгованої дії є ефективним при призначенні внутрішньо один раз на добу пацієнтам із гіперпролактинемією, призводячи до зменшення вираженості таких клінічних симптомів, як галакторея, олігоменорея, аменорея, безпліддя і зниження лібідо.

Встановлено, що тривале лікування Норпролаком призводить до зменшення розмірів або зупинки росту пролактинсекретуючих мікро- і макроаденом гіпофіза.

Клінічно значиме зниження рівня пролактину в крові настає через 2 години після прийому препарату, досягає максимуму через 4 - 6 годин і зберігається майже 24 години.

Була встановлена пряма залежність тривалості дії Норпролаку від величини його дози, тоді як для пролактинзнижуючого ефекту такої залежності немає. Максимальний пролактинінгібуючий ефект відзначений після одноразового застосування дози 50 мкг. Посилення дії спостерігалось не при збільшенні дози, а при збільшенні тривалості застосування.

Фармакокінетика. Після одноразового прийому внутрішньо препарату, міченого радіоактивною міткою, його діюча речовина хінаголід швидко й майже повністю всмоктується зі шлунково-кишкового тракту. Значення плазмових концентрацій, вимірювані для хінаголідіду та його метаболітів неселективним радіоімунологічним методом (RIA), були

близькі до порога кількісного визначення і не можуть служити джерелом надійної інформації. Після одноразового прийому внутрішньо препарату, міченого радіоактивною міткою, уявний об'єм розподілу хінаголід становить майже 100 л.

Зв'язування хінаголід з білками становить майже 90 %.

Хінаголід значною мірою метаболізується при «першому проходженні» через печінку.

Біологічно активні хінаголід та його N-дезетильовані аналоги виявляються у крові в малих кількостях. Їхні неактивні кон'югати із сірчаною і глюкуроновою кислотами циркулюють у крові в набагато більших кількостях.

Понад 95 % препарату виводиться з організму у вигляді метаболітів з калом і сечею приблизно в рівних кількостях. Основними метаболітами, виявленими в сечі, є кон'юговані сульфат хінаголід і глюкуронід хінаголід та аналоги хінаголід - N-дезетил та N, N-дидезетил. У калі визначаються некон'юговані форми цих речовин.

Період напіввиведення незміненого хінаголід після одноразового прийому становить 11,5 години, при досягненні рівноважного стану – 17 годин.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості:

таблетки 25 мкг: круглі, плоскі, зі скошеним краєм світло-рожевого кольору із вкрапленнями барвника. З одного боку тиснення «25», з іншого – тиснення «NORPROLAC»;

таблетки 50 мкг: круглі, плоскі, зі скошеним краєм світло-блакитного кольору з вкрапленнями барвника. З одного боку тиснення «50», з іншого – тиснення «NORPROLAC»;

таблетки 75 мкг: круглі, плоскі, зі скошеним краєм білого або майже білого кольору. З одного боку тиснення «75», з іншого – тиснення «NORPROLAC»;

таблетки 150 мкг: круглі, плоскі, зі скошеним краєм білого або майже білого кольору. З одного боку тиснення «150», з іншого – тиснення «NORPROLAC».

Термін придатності.

5 років.

Не слід застосовувати препарат після закінчення терміну придатності, зазначеного на упаковці.

Умови зберігання.

Зберігати при температурі не вище 25 °С.

Зберігати в недоступному для дітей місці.

Упаковка.

Таблетки 25 мкг і 50 мкг: таблетки по 25 мкг № 3 + таблетки по 50 мкг № 3 у блістері. Блістер в алюмінієвому пакеті в картонній пачці.

Таблетки 75 мкг і 150 мкг: по 10 таблеток у блістері; 3 блістери в картонній пачці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник.

Ельфа Фармасетікал Компані СА, Польща.

Каталент Ю.К. Пекінг Лімітед, Великобританія.

Феррінг ГмбХ, Німеччина.

Місцезнаходження.

21 Винсентего Пола, 58-500 Зеления Гора, Польща.

Сувже Клозе, Хедвей, Гріт Оаклей, Корді, Норсанс, NN18 8HS, Великобританія.

Вітланд 11, Д-24109 Кіль, Німеччина.