

ЗАТВЕРДЖЕНО
Наказ Міністерства охорони
здоров'я України
13.02.2014 № 125
Ресстраційне посвідчення
№ UA/9337/01/01
№ UA/9338/01/01
№ UA/9338/01/02

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату

НОРПРОЛАК
(NORPROLAC®)

Склад:

діюча речовина: хінаголіді гідрохлорид;

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

допоміжні речовини: лактоза, моногідрат; гіпромелоза; крохмаль кукурудзяний; целюлоза мікрокристалічна; кремнію діоксид колоїдний безводний; магнію стеарат; 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.

Засоби, що застосовуються в гінекології. Інгібітори пролактину. Код АТХ G02C B04.

Клінічні характеристики.

Показання.

Гіперпролактинемія (ідіопатична або спричинена пролактинсекретуючою мікро- або макроаденомою гіпофіза).

Протипоказання.

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 гіпотензії, нудоти, блювання та запаморочення внаслідок дофамінергічної стимуляції дозу Норпролаку слід збільшувати до терапевтичної поступово, починаючи лікування із застосування стартової упаковки. Норпролак слід застосовувати 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 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.

Більшість побічних ефектів залежить від дози препарату та має тимчасовий характер. Побічні ефекти застосування Норпролаку зазвичай не потребують відміни препарату і зникають при продовженні терапії.

Частота виникнення побічних ефектів класифікується таким чином: дуже часто ($\geq 1/10$); часто ($\geq 1/100 - < 1/10$); нечасто ($\geq 1/1000 - < 1/100$); рідко ($\geq 1/10000 - < 1/1000$) та дуже рідко ($< 1/10000$), включаючи окремі повідомлення.

Дуже часто: нудота, блювання, головний біль, запаморочення, підвищена втомлюваність.

Часто: анорексія, біль у животі, запор або діарея, безсоння, набряк, приливи, закладеність носа, артеріальна гіпотензія, ортостатична гіпотензія, м'язова слабкість. З огляду на можливість розвитку ортостатичної гіпотензії, що може призвести до втрати свідомості, рекомендується регулярно перевіряти артеріальний тиск у горизонтальному й вертикальному положенні тіла пацієнта в перші дні терапії, а також при збільшенні дози препарату.

Дуже рідко терапія із застосуванням Норпролаку призводила до розвитку нетривалого 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 хінаголідіду може спричинити сонливість.

У пацієнтів, що лікувалися агоністами допаміну, в тому числі Норпролаком, спостерігалися випадки надмірної схильності до азартних ігор, збільшення сексуального потягу, гіперсексуальності, нав'язливих витрат або покупок, компульсивного або панічного переїдання

Не можна виключити ризик виникнення реакції підвищеної чутливості.

Передозування.

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

У випадку інтоксикації показано промивання шлунка, прийом активованого вугілля, симптоматичне лікування.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Досвід застосування Норпролаку в період вагітності 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 ретельний 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 невідомо, чи виділяється хінаголід у грудне молоко.

Діти.

Досвід застосування Норпролаку дітям обмежений.

Особливості застосування.

Гіперпролактинемія може мати фізіологічне походження (вагітність, годування груддю), але може також бути викликана іншими причинами, в тому числі пухлиною гіпоталамуса або гіпофіза та прийомом деяких ліків. Тому важливим є визначення причини виникнення гіперпролактинемії та застосування необхідного лікування.

У перші дні терапії, а також при збільшенні дози препарату рекомендується регулярно контролювати артеріальний тиск у горизонтальному й вертикальному положенні тіла пацієнта у зв'язку з можливістю розвитку ортостатичної гіпотензії й непритомності. Крім того, ортостатичні зміни артеріального тиску з рефлекторним прискоренням пульсу можуть бути небезпечні для пацієнтів з тяжкими захворюваннями серця.

У жінок зі зниженою репродуктивною здатністю, що залежить від пролактину, лікування препаратом може викликати підвищення репродуктивної здатності. Тому жінки репродуктивного віку, які не хочуть завагітніти, під час терапії Норпролаком повинні застосовувати ефективні методи контрацепції.

У кількох випадках, у т.ч. у пацієнтів, які, з їхніх слів, не мали психічної хвороби, при лікуванні препаратом виникав гострий психоз, який зазвичай зникав після припинення лікування. Тому слід дотримуватися особливої обережності при застосуванні препарату пацієнтам, які в анамнезі мали психічні хвороби.

Одночасне призначення інших агоністів допаміну може призвести до розвитку гострого епізоду психічних розладів, особливо у пацієнтів із хворобою Паркінсона. Слід з обережністю застосовувати Норпролак пацієнтам із психічними розладами в анамнезі.

Застосування хінаголідіду може спричинити виникнення сонливості. Пацієнтам, у яких з'явилася сонливість, не можна керувати транспортними засобами та обслуговувати інші механізми. Крім того, їм слід зменшити дозу ліків або припинити лікування.

Досвід застосування препарату пацієнтам літнього віку обмежений.

Досвід застосування препарату пацієнтам з порушеннями функції печінки або нирок відсутній.

Пацієнти з рідкісними спадковими формами непереносимості галактози, вродженою недостатністю лактази або синдромом мальабсорбції глюкози/галактози не повинні застосовувати цей лікарський препарат.

Розлади імпульсного регулювання

Пацієнтів слід регулярно перевіряти щодо розвитку розладів імпульсного регулювання. Пацієнти та особи, які наглядають за ними, повинні знати симптоми поведінки при розладах імпульсного регулювання, що включають патологічні азартні ігри, підвищене лібідо, гіперсексуальність, нав'язливі витрати або покупки, компульсивне або панічне переїдання. Такі симптоми можуть виникнути у пацієнтів, які отримували агоністи допаміну, в тому числі Норпролак. У таких випадках рекомендується розглянути питання про зниження дози або поступову відміну препарату.

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

Враховуючи, що в чутливих хворих при застосуванні препарату можуть виникнути запаморочення, сонливість, на час застосування препарату слід утриматися від керування транспортними засобами та роботи зі складними механізмами.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Дослідження взаємодії хінаголідіду з іншими лікарськими засобами не проводилися, тому слід з обережністю застосовувати Норпролак з іншими лікарськими засобами.

Існує теоретична можливість, що при одночасному застосуванні препарату Норпролак і препаратів, що мають виражені антидофамінергічні властивості (наприклад нейролептиків), здатність першого до пригнічення секреції пролактину може знизитися.

Оскільки спорідненість хінаголідіду з рецепторами 5-HT₁ та 5-HT₂ є приблизно в 100 разів меншою, ніж з D₂-рецепторами, взаємодія між препаратом Норпролак та 5-HT_{1a} є

малоймовірною. Однак слід з обережністю призначати лікарські засоби, що взаємодіють з цими рецепторами.

З огляду на обмежену кількість даних стосовно ензимів, що беруть участь у метаболізмі хінаголід, важко передбачити потенційну фармакологічну взаємодію. Відсутні також дані про можливий вплив хінаголід на фармакінетику інших лікарських засобів, наприклад, шляхом сповільнення виділення ензиму. Тому слід з обережністю застосовувати Норпролак з іншими лікарськими засобами, особливо з препаратами, які сильно стримують ензими, що метаболізують ліки.

Прийом алкоголю погіршує переносимість Норпролаку.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

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

Норпролак як інгібітор секреції пролактину пролонгованої дії ефективний 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.

Обмежена кількість пацієнтів літнього віку застосовували хінаголід у дозі від 50 до 300 мкг/добу при аденомі гіпофіза та ревматоїдному артриті. Лікування тривало від 6 до 93 місяців і організм добре сприймав препарат.

Обмежена кількість дітей віком від 7 до 17 років застосовували Норпролак у дозі від 75 до 600 мкг/добу при аденомі з підвищеним рівнем виділення пролактину. Лікування тривало від 1 до 5 років і організм добре сприймав препарат.

Фармакокінетика.

Після одноразового прийому внутрішньо радіоактивно міченого препарату його діюча речовина хінаголід швидко й майже повністю всмоктується зі шлунково-кишкового тракту. Значення плазмових концентрацій, визначені для хінаголід та його метаболітів неселективним радіоімунологічним методом (RIA), були близькі до порога кількісного визначення і не можуть бути джерелом надійної інформації. Після одноразового прийому внутрішньо радіоактивно міченого препарату 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 глюкуроною 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 хінаголіді після одноразового прийому становить 11,5 години, в стані рівноваги – 17 годин.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості:

таблетки 25 мкг: круглі плоскі таблетки зі скошеними краями діаметром приблизно 7 мм. Колір - світло-рожевий із вкрапленнями барвника. З одного боку: тиснення «25», з іншого боку: тиснення «NORPROLAC» по периметру;

таблетки 50 мкг: круглі плоскі таблетки зі скошеними краями діаметром приблизно 7 мм. Колір - світло-блакитний із вкрапленнями барвника. З одного боку: тиснення «50», з іншого боку: тиснення «NORPROLAC» по периметру;

таблетки 75 мкг: круглі плоскі таблетки зі скошеними краями білуватого кольору діаметром приблизно 7 мм. З одного боку: тиснення «75», з іншого боку: тиснення «NORPROLAC» по периметру;

таблетки 150 мкг: круглі плоскі таблетки зі скошеними краями білуватого кольору діаметром приблизно 9 мм. З одного боку: тиснення «150», з іншого боку: тиснення «NORPROLAC» по периметру.

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: по 3 таблетки по 25 мкг та по 3 таблетки по 50 мкг у блістері; по 1 блістеру в алюмінієвому пакеті в картонній коробці.

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

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник.

Відповідальний за випуск серії:

Феррінг ГмбХ, Німеччина/Ferring GmbH, Germany.

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

Вітланд 11, Постфаш 21 45, Д-24109 Кіль, Німеччина/Wittland 11, Postfach 21 45, D-24109 Kiel, Germany.

Дата останнього перегляду. 13.02.2014

ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению препарата

НОРПРОЛАК
(NORPROLAC®)

Состав:

действующее вещество: хинаголида гидрохлорид;

1 таблетка содержит хинаголида гидрохлорида 27,3 мкг, 54,6 мкг, 81,9 мкг или 163,8 мкг, что эквивалентно хинаголида 25, 50, 75 или 150 мкг соответственно;

вспомогательные вещества: лактоза, моногидрат; гипромеллоза; крахмал кукурузный; целлюлоза микрокристаллическая; кремния диоксид коллоидный безводный; магния стеарат; железа оксид красный (Е 172) (только в таблетках по 25 мкг); индигокарминовый лак (Е 132) (только в таблетках по 50 мкг).

Лекарственная форма. Таблетки.

Фармакотерапевтическая группа.

Средства, применяемые в гинекологии. Ингибиторы пролактина.

Код АТС G02C B04.

Клинические характеристики.

Показания.

Гиперпролактинемия (идиопатическая или вызванная пролактинсекретирующей микро- или макроаденомой гипофиза).

Противопоказания.

Повышенная чувствительность к действующему веществу или к другим компонентам препарата.

Нарушение функции почек или печени.

Наличие в анамнезе психических расстройств.

Способ применения и дозы.

Учитывая возможность развития ортостатической гипотензии, тошноты, рвоты и головокружения вследствие дофаминергической стимуляции, дозу Норпролака следует увеличивать до терапевтической постепенно, начиная лечение с применения стартовой упаковки. Норпролак следует применять один раз в сутки, желательно на ночь перед сном, с небольшим количеством пищи.

Взрослые.

Оптимальную дозу препарата следует подбирать индивидуально, учитывая степень уменьшения уровня пролактина в плазме крови и переносимость.

Лечение начинают с применения таблеток по 25 мкг, 50 мкг. В первые 3 дня препарат назначают в дозе 25 мкг/сутки, в последующие 3 дня – в дозе 50 мкг/сутки. Начиная с 7-го дня и далее рекомендуемая доза составляет 75 мкг/сутки. При необходимости осуществляют дальнейшее постепенное увеличение дозы до достижения оптимального терапевтического эффекта. Поддерживающая доза составляет 75-150 мкг/сутки.

У 1/3 пациентов возникает необходимость применения дозы 300 мкг/сутки и выше. В таких случаях суточную дозу препарата можно повышать в пределах от 75 до 150 мкг с интервалами не менее 4 недель до достижения удовлетворительного терапевтического эффекта или ухудшения переносимости препарата, что может потребовать перерыва в лечении.

Побочные реакции.

Большинство побочных эффектов зависит от дозы препарата и носит временный характер. Побочные эффекты применения Норпролака обычно не требуют отмены препарата и исчезают при продолжении терапии.

Частота возникновения побочных эффектов классифицируется следующим образом: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100 - < 1/10$); нечасто ($\geq 1/1000 - < 1/100$), редко ($\geq 1/10000 - < 1/1000$) и очень редко ($< 1/10000$), включая отдельные сообщения.

Очень часто: тошнота, рвота, головная боль, головокружение, повышенная утомляемость.

Часто: анорексия, боль в животе, запор или диарея, бессонница, отек, приливы, заложенность носа, артериальная гипотензия, ортостатическая гипотензия, мышечная слабость. Учитывая возможность развития ортостатической гипотензии, которая может привести к потере сознания, рекомендуется регулярно проверять артериальное давление в горизонтальном и вертикальном положении тела пациента в первые дни терапии, а также при увеличении дозы препарата.

Очень редко терапия с применением Норпролака приводила к развитию непродолжительного острого психоза. Обычно с прекращением терапии этот побочный эффект исчезал. Его развитие наблюдалось и у пациентов, у которых ранее расстройства подобного типа не наблюдались.

Применение хинаголида может вызвать сонливость.

У пациентов, лечившихся агонистами допамина, в том числе Норпролаком, наблюдались случаи чрезмерной склонности к азартным играм, увеличение сексуального влечения, гиперсексуальности, навязчивых расходов или покупок, компульсивного или панического переедания.

Нельзя исключить риск возникновения реакции гиперчувствительности.

Передозировка.

Об острой интоксикации Норпролака данные отсутствуют. Возможные симптомы: сильная тошнота, рвота, головная боль, головокружение, сонливость, артериальная гипотензия. Также возможно появление галлюцинаций.

В случае интоксикации показано промывание желудка, прием активированного угля, симптоматическое лечение.

Применение в период беременности или кормления грудью.

Опыт применения Норпролака в период беременности ограничен. Поэтому женщинам следует прекратить применение Норпролака при подтверждении беременности, если нет веских клинических причин для продолжения терапии. Прекращение применения Норпролака не приводило к увеличению количества самопроизвольных выкидышей.

Если беременность подтверждена у больной с аденомой гипофиза и применение Норпролака было прекращено, то в течение всего периода беременности необходимо проводить тщательный мониторинг ее состояния.

Норпролак ингибирует секрецию пролактина, что приводит к угнетению лактации. Поэтому кормление грудью обычно невозможно. Если же процесс лактации не нарушился в ходе терапии, кормление грудью не рекомендуется, поскольку неизвестно, выделяется ли хинаголид в грудное молоко.

Дети.

Опыт применения Норпролака детям ограничен.

Особенности применения.

Гиперпролактинемия может иметь физиологическое происхождение (беременность, кормление грудью), но может также быть вызвана другими причинами, в том числе опухолью гипоталамуса или гипофиза и приемом некоторых лекарств. Поэтому важным является определение причины возникновения гиперпролактинемии и применение необходимого лечения.

В первые дни терапии, а также при увеличении дозы препарата рекомендуется регулярно контролировать артериальное давление в горизонтальном и вертикальном положении тела пациента в связи с возможностью развития ортостатической гипотензии и обморока. Кроме того, ортостатические изменения артериального давления с рефлекторным учащением пульса могут быть опасны для пациентов с тяжелыми заболеваниями сердца.

У женщин с пониженной репродуктивной способностью, зависящей от пролактина, лечение препаратом может вызвать повышение репродуктивной способности. Поэтому женщины репродуктивного возраста, которые не хотят забеременеть, во время терапии Норпролаком должны применять эффективные методы контрацепции.

В нескольких случаях, в т.ч. у пациентов, которые, по их словам, не имели психической болезни, при лечении препаратом возникал острый психоз, который обычно исчезал после прекращения лечения. Поэтому следует соблюдать особую осторожность при применении препарата пациентам, которые в анамнезе имели психические болезни.

Одновременное назначение других агонистов дофамина может привести к развитию острого эпизода психических расстройств, особенно у пациентов с болезнью Паркинсона. Следует с осторожностью применять Норпролак пациентам с психическими расстройствами в анамнезе.

Применение хинаголида может вызвать сонливость. Пациентам, у которых появилась сонливость, нельзя управлять транспортными средствами и обслуживать другие механизмы. Кроме того, им следует уменьшить дозу лекарств или прекратить лечение.

Опыт применения препарата пациентам пожилого возраста ограничен.

Опыт применения препарата пациентам с нарушениями функции печени или почек отсутствует.

Пациенты с редкими наследственными формами непереносимости галактозы, врожденной недостаточностью лактазы или синдромом мальабсорбции глюкозы/галактозы не должны применять этот лекарственный препарат.

Расстройства импульсного регулирования

Пациентов следует регулярно проверять относительно развития расстройств импульсного регулирования. Пациенты и лица, которые присматривают за ними, должны знать симптомы поведения при расстройствах импульсного регулирования, включающие патологические азартные игры, повышенное либидо, гиперсексуальность, навязчивые расходы или покупки, компульсивное или паническое переедание. Такие симптомы могут возникнуть у пациентов, которые получали агонисты дофамина, в том числе Норпролак. В таких случаях рекомендуется рассмотреть вопрос о снижении дозы или постепенной отмене препарата.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с другими механизмами.

Учитывая, что в чувствительных больных при применении препарата могут возникнуть головокружение, сонливость, на время применения препарата следует воздержаться от управления транспортными средствами и работы со сложными механизмами.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий.

Исследования взаимодействия хинаголида с другими лекарственными средствами не проводились, поэтому следует с осторожностью применять Норпролак с другими лекарственными средствами.

Существует теоретическая возможность, что при одновременном применении препарата Норпролака и препаратов, имеющих выраженные антидофаминергические свойства (например нейролептиков), способность первого к угнетению секреции пролактина может снизиться.

Поскольку сродство хинаголида с рецепторами 5-HT₁ и 5-HT₂ приблизительно в 100 раз меньше, чем с D₂-рецепторами, взаимодействие между препаратом Норпролак и 5-HT_{1a} маловероятно. Однако следует с осторожностью назначать лекарственные средства, которые взаимодействуют с этими рецепторами.

Учитывая ограниченное количество данных относительно энзимов, участвующих в метаболизме хинаголида, трудно предвидеть потенциальное фармакологическое взаимодействие. Отсутствуют также данные о возможном влиянии хинаголида на фармакинетику других лекарственных средств, например, путем замедления выделения энзима. Поэтому следует с осторожностью применять Норпролак с другими лекарственными средствами, особенно с препаратами, которые сильно сдерживают энзимы, метаболизирующие лекарства.

Прием алкоголя ухудшает переносимость Норпролака.

Фармакологические свойства.

Фармакодинамика.

Хинаголид – это селективный агонист дофаминовых D₂-рецепторов, который не относится к химической группе производных спорыньи. Благодаря своим дофаминергическим свойствам препарат оказывает сильное ингибирующее действие на секрецию гормона передней доли гипофиза – пролактина, не снижая при этом нормальные уровни других гормонов гипофиза. У некоторых пациентов снижение секреции пролактина может сопровождаться кратковременным незначительным повышением уровня гормона роста в плазме крови. Клиническая значимость этого явления неизвестна.

Норпролак как ингибитор секреции пролактина пролонгированного действия эффективен при назначении внутрь один раз в сутки пациентам с гиперпролактинемией, приводя к уменьшению выраженности таких клинических симптомов, как галакторея, олигоменорея, аменорея, бесплодие и снижение либидо.

Установлено, что длительное лечение Норпролаком приводит к уменьшению размеров или остановке роста пролактинсекретирующих микро- и макроаденом гипофиза.

Клинически значимое снижение уровня пролактина в крови наступает через 2 часа после приема препарата, достигает максимума через 4-6 часов и сохраняется около 24 часов.

Была установлена прямая зависимость продолжительности действия Норпролака от величины его дозы, тогда как для пролактинснижающего эффекта такой зависимости нет. Максимальный пролактинингибирующий эффект отмечен после однократного применения дозы 50 мкг. Усиление действия наблюдалось не при увеличении дозы, а при увеличении длительности применения.

Ограниченное количество пациентов пожилого возраста применяли хинаголид в дозе от 50 до 300 мкг/сутки при аденоме гипофиза и ревматоидном артрите. Лечение продолжалось от 6 до 93 месяцев, и организм хорошо воспринимал препарат.

Ограниченное количество детей в возрасте от 7 до 17 лет применяли Норпролак в дозе от 75 до 600 мкг/сутки при аденоме с повышенным уровнем выделения пролактина. Лечение продолжалось от 1 до 5 лет, и организм хорошо воспринимал препарат.

Фармакокинетика.

После однократного приема внутрь радиоактивно меченого препарата его действующее вещество хинаголид быстро и почти полностью всасывается из желудочно-кишечного тракта. Значения плазменных концентраций, которые были определены для хинаголида и его метаболитов неселективным радиоиммунологическим методом (RIA), были близки к порогу количественного определения и не могут быть источником надежной информации. После однократного приема внутрь радиоактивно меченого препарата представляемый объем распределения хинаголида составляет почти 100 л.

Связывание хинаголида с белками составляет почти 90 %.

Хинаголид в значительной степени метаболизируется при первом прохождении через печень.

Биологически активные хинаголид и его N-деэтилированные аналоги определяются в крови в малых количествах. Их неактивные конъюгаты с серной и глюкуроновой кислотами циркулируют в крови в гораздо больших количествах.

Более 95 % препарата выводится из организма в виде метаболитов с калом и мочой приблизительно в равных количествах. Основными метаболитами, обнаруженными в моче, являются конъюгированные сульфат хинаголида и глюкуронид хинаголида, а также аналоги

хинаголида – N-дезэтил и N,N-дидезэтил. В кале определяются неконъюгированные формы этих веществ.

Период полувыведения неизмененного хинаголида после однократного приема составляет 11,5 часа, в состоянии равновесия – 17 часов.

Фармацевтические характеристики.

Основные физико-химические свойства:

таблетки 25 мкг: круглые плоские таблетки со скошенными краями диаметром приблизительно 7 мм. Цвет – светло-розовый с вкраплениями красителя. На одной стороне: тиснение «25», на другой стороне: тиснение «NORPROLAC» по периметру;

таблетки 50 мкг: круглые плоские таблетки со скошенными краями диаметром приблизительно 7 мм. Цвет – светло-голубой с вкраплениями красителя. На одной стороне: тиснение «50», на другой стороне: тиснение «NORPROLAC» по периметру;

таблетки 75 мкг: круглые плоские таблетки со скошенными краями беловатого цвета диаметром приблизительно 7 мм. На одной стороне: тиснение «75», на другой стороне: тиснение «NORPROLAC» по периметру;

таблетки 150 мкг: круглые плоские таблетки со скошенными краями беловатого цвета диаметром приблизительно 9 мм. На одной стороне: тиснение «150», на другой стороне: тиснение «NORPROLAC» по периметру.

Срок годности. 5 лет.

Не следует применять препарат по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия хранения.

Хранить при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка.

Таблетки 25 мкг и 50 мкг: по 3 таблетки по 25 мкг и по 3 таблетки по 50 мкг в блистере; по 1 блистеру в алюминиевом пакете в картонной коробке.

Таблетки 75 мкг и 150 мкг: по 10 таблеток в блистере; по 3 блистера в картонной коробке.

Категория отпуска. По рецепту.

Производитель.

Ответственный за выпуск серии:

Ферринг ГмбХ, Германия/Ferring GmbH, Germany.

Местоположение и адрес места ведения его деятельности.

Витланд 11, Постфаш 21 45, Д-24109 Киль, Германия/Wittland 11, Postfach 21 45, D-24109 Kiel, Germany.