

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

SERMION® powd. Inj. 4 mg+ solv. 4 ml

1. Търговско наименование на лекарствения продукт

SERMION®

SERMIION®

2. Количествен и качествен състав

Всеки флакон съдържа 4 mg nicergoline.

За помощните вещества виж раздел 6.1.

3. Лекарствена форма

Прах и разтворител за инжекционен разтвор.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Показания

Мозъчни метаболитно-съдови нарушения - остри и хронични, в резултат на артериосклероза, тромбоза и емболизъм на мозъчните съдове, преходни нарушения на мозъчното кръвообращение (транзиторни исхемични атаки).

Периферни метаболитно-съдови нарушения – остри и хронични (органични и функционални артериопатии на крайниците, болест на Raynaud, други синдроми, свързани с нарушен кръвоток).

Главоболие.

Добавъчна терапия при артериална хипертония и парентерално при хипертонични кризи.

4.2 Дозирание и начин на приложение

Интрамускулна инжекция: 2-4 mg (2-4 ml) два пъти дневно.

Бавна интравенозна инфузия: доза от 4-8 mg в 100 ml физиологичен разтвор или глюкозен разтвор. По преценка на лекаря тази доза може да се повтори неколккратно през деня.

Sermion е бил използван и интраартериално: доза от 4 mg в 10 ml физиологичен разтвор, инжектиран за две минути.

Дозировката, продължителността на лечението и начинът на приложение са в зависимост от клиничния случай. Понякога е за предпочитане лечението да започне парентерално и да продължи като перорална поддържаща терапия.

4.3 Противопоказания

Свръхчувствителност към nicergoline или някое от помощните вещества;

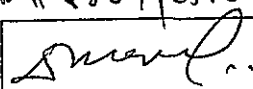
Пресен миокарден инфаркт;

Остър кръвоизлив;

Тежка брадикардия;

Нарушена ортостатична регулация.

4.4 Специални противопоказания и специални предупреждения за употреба

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВКОПАВАНАТО	
Приложение към разрешение за употреба № 11-7867/25.02.07	
642/15.07.03	



Най-общо, Sermion, приет в препоръчителните дози, не оказва влияние върху артериалното налягане. При хипертоници може да е причина, обаче, за постепенно понижение на артериалното налягане.

Тъй като основният път на екскреция на nicergoline и неговите метаболити е бъбречният, препоръчително е намаляване на дозата при пациенти с увредена бъбречна функция. Лекарственият продукт трябва да се прилага внимателно при пациенти с хиперурикемия или анамнестични данни за подагра и/или на терапия с лекарства, които имат ефект върху метаболизма и екскрецията на пикочната киселина.

Да се пази от деца!

4.5 Лекарствени и други взаимодействия

Nicergoline може да усилва ефекта на антихипертензивните лекарства. Тъй като Sermion се метаболизира чрез CYP 2D6, не може да се изключи възможността за взаимодействие с лекарства, които се метаболизират от същия ензим.

4.6 Бременност и кърмене

Въпреки че в токсикологични проучвания nicergoline не е показвал тератогенен ефект, лекарственият продукт трябва да се употребява при бременни само в случай на реална необходимост и винаги под директен медицински контрол.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Не е познато въздействие върху способността за шофиране или работа с машини.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Описани са само редки случаи на нежелани лекарствени реакции, които не са клинично тежки:

Сърдечно-съдова система: хипотония;

Гастро-интестинална система: стомашни смущения (диспепсия, гадене, повръщане);

Автономна нервна система: световъртеж, замаяване, топли вълни;

Кожа/кожни придатъци: обриви по кожата;

Психиатрични: сънливост, безсъние.

4.9 Предозиране

В литературата не са описани случаи на предозиране.

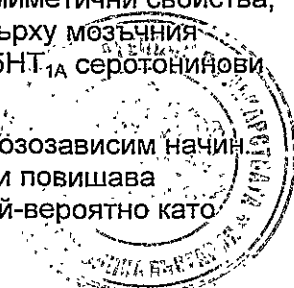
5. Фармакологични данни

5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: Периферни вазодилататори АТС код: C04AE02

Sermion има няколко вероятни механизми на действие: холиномиметични свойства, стимулиране на преобразуването на фосфоинозида, ефект върху мозъчния метаболизъм и ефекти върху алфа1-адренергичните и подтип 5HT_{1A} серотонинови рецептори.

Nicergoline потиска активността на ацетилхолинестеразата по дозозависим начин. Той улеснява търновъра на допамин и норадреналин в мозъка и повишава концентрациите на метаболита на норадреналин в кортекса, най-вероятно като



резултат от блокада на адренорецепторите. Влиянието на nicergoline върху трансдукционната система на втория месинджър фосфоинозитид може да обясни част от положителния ефект на лекарството при сенилното мозъчно увреждане. Nicergoline повишава синтеза на мозъчните протеини и нуклеинови киселини при плъхове, което е свързано с подобрени способности за заучаване. Механизмът на ефект на nicergoline след хипоксия по-вероятно е свързан с директно подобрене на церебралната метаболитна функция, отколкото с повишен мозъчен кръвоток, тъй като се проявява и при хиперкапнични условия при максимално дилатирани мозъчни съдове. Nicergoline не показва седраща, антиконвулсантна или антирезерпинова активност. Невропротективният му ефект се медира от антиоксидантната му активност. Неговите ефекти върху сърдечносъдовата система са широко проучени и напр., намалява кръвното налягане и сърдечната честота в ниски дози при кучета подобно на клонидин. В експериментални условия Sermion подобрява постхипоксичния и постисхемичния мозъчен метаболизъм. Установено е, че потиска адхезията на човешки тромбоцити, активирани с адреналин и предотвратява образуването на тромбоцитни емболи, предизвикано от лезии в артериалната стена, на което се дължи най-вероятно неговото хемореологично действие. Установена е зависимост между дозата и ефекта при зрели доброволци и хора в напреднала възраст по отношение на ЕЕГ параметрите. Ефектът на nicergoline 10 mg, 30 mg и 60 mg в условия на кислороден глад показва увеличаване на делта- и тета-активността в париеталните, темпоралните и централните региони, намаляване на бета-активността в лявата темпорална област и намаляване на алфа-активността в по-голяма част от мозъка. Nicergoline значително намалява влошаването на мозъчните функции в резултат на хипоксия. Той активира биосинтезата на протеини и повишава регионалния обратен захват на норадреналин и допамин в мозъка. Ефектът му върху допаминовия обратен захват е уникален и може да се обясни с антагонистично действие на допаминовите рецептори.

5.2. Фармакокинетични свойства

След IV приложение nicergoline се подлага на бърза хидролиза на естерната връзка и се образува 1,6-dimehtyl-8b-hydroxymethyl-10a-methoxy ergoline (MMDL). Последващата биотрансформация води до образуването на метаболита 6-mehtyl-8b-hydroxymethyl-10a-methoxy ergoline (MDL). Приблизително 51% от приложената доза се елиминира с урината, а само 10 % - с фецеса.

При перорално приложение се наблюдава почти пълна абсорбция, а абсолютната бионаличност на лекарството е по-малко от 5%. И след перорално приложение се образуват тези метаболити, като най-вероятно това се дължи на "first pass" ефект. Степента и скоростта на абсорбция на nicergoline, описани чрез MMDL и MDL, изглежда не се повлияват съществено от приема на храна. Обемът на разпределение е повече от 105 L. Метаболитният профил след перорално приложение не се различава съществено от този след IV приложение. След значителен "first pass" метаболизъм се образуват MMDL и MDL.

Основният път на елиминиране и при пероралната форма остава бъбречния. Той се елиминира слабо във фецеса чрез билиарна екскреция. Поради тази причина трябва да се има предвид намаляване на дозата при пациенти с тежко увреждане на бъбречната функция. Има данни, показващи, че процесът на деметилиране на MMDL се осъществява чрез каталитичното действие на CYP 2D6. Затова трябва да се има предвид възможността, макар и малка, за взаимодействие с лекарства, които също се метаболизират от този ензим.

Nicergoline има линейна фармакокинетика както при млади, така и при възрастни пациенти.



КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

SERMION[®] powd. Inj. 4 mg+ solv. 4 ml

Тъй като фармакокинетиката при пациенти в напреднала възраст е сходна с тази при млади, не е необходимо коригиране на дозите. Това е особено важно, имайки предвид факта, че лекаството се използва и при такива пациенти.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Токсикологичните тестове върху различни животински видове доказват, че *nisergoline* притежава отлична поносимост (LD_{50} при перорално приложение: 726 mg/kg при мишки, 2872 mg/kg при плъхове). Още повече *nisergoline* не показва ембриофетална токсичност или тератогенни ефекти.

6. Фармацевтични данни

6.1 Списък на помощните вещества

Флакон с прах за инжекционен разтвор: tartaric acid, lactose monohydrate.

Ампула с разтворител: sodium chloride, beznalkonium chloride, стерилна вода за инжекции.

6.2 Физико-химични несъвместимости

За интрамускулни инжекции използвайте приложения в опаковката разтворител.

За интравенозни инжекции/инфузии използвайте физиологичен разтвор или глюкозен разтвор.

6.3 Срок на годност

4 години.

Срок на годност след разтваряне: 48 часа при стайна температура на защитено от светлина място.

6.4 Специални условия на съхранение

При температура под 25°C.

6.5 Вид на опаковката и съдържание

Sermion се предлага в опаковки с 4 флакона прах за инжекционен разтвор и 4 ампули с разтворител (4 ml).

6.6 Препоръки при употреба

Препоръчва се готовият разтвор да се съхранява при стайна температура на защитено от светлина място.

7. Притежател на разрешението за употреба

Pharmacia Enterprises S.A.
Circuit de la Foire Internationale
Luxembourg

8. Регистрационен номер

9. Дата на първо разрешаване за употреба

10. Дата на (частична) актуализация на текста

