Прономран



Код АТХ:

- N04BC08

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Пирибедил

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Таблетки с контролируемым высвобождением, покрытые оболочкой красного цвета, круглые, двояковыпуклые; допускаются незначительная неоднородность окрашивания, степени глянцевости и наличие незначительных вкраплений.

	1 таб.
пирибедил	50 мг

Вспомогательные вещества: магния стеарат - 5 мг, повидон - 20 мг, тальк - 130 мг.

Состав оболочки: кармеллоза натрия - 0.71 мг, полисорбат 80 - 0.30 мг, краситель пунцовый (Понсо 4R) - 3.87 мг, повидон - 6.31 мг, натрия гидрокарбонат - 0.15 мг, кремния диоксид коллоидный - 0.27 мг, сахароза - 51.17 мг, тальк - 50.37 мг, титана диоксид - 0.78 мг, воск пчелиный белый - 0.07 мг.

30 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Интермедианты
- Нейротропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противопаркинсонический препарат, агонист допаминовых рецепторов. Проникает в кровоток головного мозга, где связывается с допаминовыми рецепторами головного мозга, проявляя высокое сродство и селективность по отношению к допаминовым рецепторам типа D_2 и D_3.

Механизм действия пирибедила обуславливает основные клинические свойства препарата для лечения болезни Паркинсона как на начальных, так и на более поздних стадиях заболевания с воздействием на все основные моторные симптомы. Пирибедил помимо воздействия на допаминовые рецепторы проявляет активность антагониста двух основных α-адренергических рецепторов ЦНС (типа α_{2A} и α_{2C}).

Синергическое действие пирибедила, как антагониста α_2-адренорецепторов и агониста допаминовых рецепторов головного мозга, было продемонстрировано на различных животных моделях с болезнью Паркинсона: длительное применение пирибедила приводит к развитию менее выраженной дискинезии, чем применение леводопы, со сходной эффективностью по отношению к обратимой акинезии, сопутствующей болезни Паркинсона.

В ходе фармакодинамических исследований у людей было показано возбуждение коркового электрогенеза допаминергического типа как при пробуждении, так и во время сна с проявлением клинической активности по отношению к различным функциям, контролируемым допамином. Данная активность была продемонстрирована при использовании поведенческой или психометрической шкалы. Было показано, что у здоровых добровольцев пирибедил улучшает внимание и бдительность, связанные с когнитивными задачами.

Эффективность Пронорана в качестве монотерапии или в комбинации с леводопой при лечении болезни Паркинсона изучалась в ходе трех двойных слепых, плацебо-контролируемых клинических исследований (2 исследования по сравнению с плацебо и 1 исследование по сравнению с бромокриптином). В исследованиях участвовало 1103 пациента 1-3 стадии по шкале Хен и Яра (Hahn & Jahr), 543 из которых получали Прономан. Показано, что Прономан в дозе 150-300 мг/сут эффективен при действии на все моторные симптомы с 30% улучшением по Унифицированной Шкале Оценки Болезни Паркинсона (UPDRS) III часть (двигательная) в течение более 7 месяцев при монотерапии и 12 месяцев в комбинации с леводопой. Улучшение части "активность в повседневной жизни" по шкале UPDRS II было оценено в тех же значениях.

При монотерапии статистически значимое соотношение пациентов, нуждающихся в экстренном лечении леводопой, получавших пирибедил (16.6%) было меньше, чем в группе пациентов, получавших плацебо (40.2%).

Наличие допаминовых рецепторов в сосудах нижних конечностей объясняет вазодилатирующее действие пирибедила (увеличивает кровоток в сосудах нижних конечностей).

Фармакокинетика

Всасывание и распределение

Пирибедил быстро и почти полностью абсорбируется из ЖКТ и интенсивно распределяется.

C_{max} в плазме крови достигается через 3-6 ч после приема таблеток с контролируемым высвобождением. Связывание с белками плазмы среднее (несвязанная фракция составляет 20-30%), поэтому риск лекарственного взаимодействия при применении с другими препаратами низкий.

Метаболизм

Пирибедил интенсивно метаболизируется в печени и выводится главным образом с мочой: 75% абсорбированного пирибедила экскретируется почками в виде метаболитов.

Выведение

Плазменная элиминация пирибедила носит двухфазный характер и состоит из первоначальной фазы и второй более медленной фазы, приводящей к поддержанию устойчивой концентрации пирибедила в плазме крови в течение более чем 24 ч. В ходе комбинированного фармакокинетического анализа было показано, что $T_{1/2}$ пирибедила после в/в введения составляет в среднем 12 ч и не зависит от введенной дозы.

Показания к применению:

— в качестве вспомогательной симптоматической терапии при хроническом нарушении когнитивной функции и нейросенсорном дефиците в процессе старения (в т.ч. расстройства внимания и памяти);

— болезнь Паркинсона в виде монотерапии (при формах, преимущественно сопровождающихся тремором) или в составе комбинированной терапии с леводопой как на начальных, так и на более поздних стадиях заболевания, особенно при формах, включающих тремор;

— в качестве вспомогательной симптоматической терапии при перемежающейся хромоте вследствие

облитерирующих заболеваний артерий нижних конечностей (II стадия по классификации Лериша и Фонтейна);

— терапия симптомов офтальмологических заболеваний ишемического генеза (в т.ч. снижение остроты зрения, сужение поля зрения, снижение контрастности цветов).

Относится к болезням:

- Тремор

Противопоказания:

— коллапс;

— острый инфаркт миокарда;

— совместный прием с нейролептиками (кроме клозапина);

— детский и подростковый возраст до 18 лет (в связи с отсутствием данных);

— повышенная чувствительность к пирибедилу и/или вспомогательным веществам, входящим в состав препарата.

В связи с тем, что в состав препарата входит сахароза, пациентам с непереносимостью фруктозы, глюкозы или галактозы, а также пациентам с дефицитом сукрозоизомальтазы (редкое нарушение обмена веществ) препарат принимать не рекомендуется.

Способ применения и дозы:

Таблетки принимают внутрь, после еды, не разжевывая, запивая 1/2 стакана воды.

По *всем показаниям (кроме болезни Паркинсона)* препарат назначают в дозе 50 мг (1 таб.) 1 раз/сут. При необходимости возможно повышение дозы до 100 мг/сут (по 50 мг 2 раза/сут).

При *болезни Паркинсона в виде монотерапии* назначают 150-250 мг/сут (3-5 таб./сут), разделенных на 3 приема. При необходимости приема препарата в дозе 250 мг рекомендуется принять 2 таб. по 50 мг утром и 2 таб. по 50 мг днем и 1 таб. 50 мг вечером.

При *применении в комбинации с препаратами леводопы* суточная доза составляет 150 мг (3 таб.) в 3 приема.

При подборе дозы в случае ее увеличения рекомендуется титровать дозу, постепенно увеличивая на 1 таб. (50 мг) каждые 2 недели.

Побочное действие:

Отмеченные побочные реакции при применении пирибедила носят дозозависимый характер и, главным образом, связаны с его допаминергической активностью. Побочные реакции носят умеренный характер, встречаются, главным образом, в начале лечения и проходят после отмены препарата.

При приеме препарата могут встречаться следующие побочные реакции.

Со стороны ЖКТ: часто (≥1/100, <1/10) - незначительные желудочно-кишечные симптомы (тошнота, рвота, метеоризм), данные побочные реакции носят обратимый характер при подборе соответствующей индивидуальной дозы. Подбор дозы, путем постепенно увеличения дозы (по 50 мг каждые 2 недели до достижения рекомендованной дозы), приводит к значительному снижению проявления данных побочных эффектов.

Со стороны ЦНС: часто (≥1/100, <1/10) - могут отмечаться психические расстройства, такие как спутанность сознания, галлюцинации, возбуждение или головокружение, исчезающие при отмене препарата. Применение пирибедила сопровождается сонливостью и в крайне редких случаях может сопровождаться выраженной сонливостью в дневное время суток вплоть до внезапного засыпания.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: нечасто (≥1/1000, <1/100) - гипотензия, ортостатическая гипотензия с потерей сознания или недомоганием или лабильностью АД.

Аллергические реакции: риск развития аллергических реакций на краситель пунцовый, входящий в состав препарата.

У пациентов с болезнью Паркинсона, получавших терапию агонистами допамина, включая пирибедил, отмечалась

склонность к азартным играм, усиление либидо и гиперсексуальность, навязчивое желание делать покупки и компульсивное переедание.

Передозировка:

Симптомы: рвота (обусловленная действием пирибедила на хеморецепторную триггерную зону), лабильность АД (повышение или снижение), нарушение функции ЖКТ (тошнота, рвота).

Лечение: отмена препарата, проводят симптоматическую терапию.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат в основном применяется у пожилых пациентов, у которых возникновение беременности маловероятно. Было показано, что у мышей пирибедил проникает через плацентарный барьер и распределяется в органах плода.

В связи с отсутствием данных препарат не должен применяться при беременности и в период грудного вскармливания.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

В связи с взаимным антагонизмом между допаминергическими противопаркинсоническими препаратами и нейролептиками, одновременное назначение с нейролептиками (за исключением клозапина) противопоказано.

Пациентам с экстрапирамидным синдромом, вызванным приемом нейролептиков, следует назначать терапию антихолинергическими лекарственными препаратами и не следует назначать допаминергические противопаркинсонические лекарственные препараты (вследствие блокирования нейролептиками допаминергических рецепторов).

Допаминергические противопаркинсонические препараты могут вызывать или усиливать психотические расстройства. Если требуется назначение нейролептиков пациентам с болезнью Паркинсона, получающим лечение допаминергическими противопаркинсоническими препаратами, доза последних должна постепенно снижаться до окончательной отмены (внезапная отмена допаминергических препаратов связана с риском развития злокачественного нейролептического синдрома).

Противорвотные нейролептики: следует применять противорвотные препараты, не вызывающие экстрапирамидных симптомов.

В связи с взаимным антагонизмом между допаминергическими противопаркинсоническими препаратами и тетрабеназином одновременное применение этих препаратов не рекомендуется.

Не рекомендуется одновременное применение пирибедила с алкоголем.

Следует соблюдать осторожность при применении пирибедила с другими лекарственными препаратами, обладающими седативным действием.

Особые указания и меры предосторожности:

У некоторых пациентов (особенно у больных болезнью Паркинсона) на фоне приема пирибедила иногда внезапно возникает состояние сильной сонливости вплоть до внезапного засыпания. Данное явление наблюдается крайне редко, но, тем не менее, пациенты, управляющие автомобилем и/или работающие на оборудовании, требующем высокой степени внимания, должны быть предупреждены об этом. При возникновении подобных реакций необходимо рассмотреть вопрос о снижении дозы пирибедила или прекращении терапии данным препаратом.

Учитывая возраст популяции, получающей терапию пирибедилом, следует учитывать риск падений которые могут быть вызваны внезапным засыпанием, артериальной гипотензией или спутанностью сознания.

Пациентов и их опекунов следует предупреждать о возможных симптомах расстройства поведения (склонность к азартным играм, усиление либидо и гиперсексуальность, навязчивое желание делать покупки и компульсивное переедание) при применении препарата. При возникновении подобных симптомов необходимо рассмотреть вопрос о снижении дозы или постепенном прекращении терапии препаратом.

Краситель пунцовый, входящий в состав препарата, у некоторых пациентов повышает риск развития аллергической реакции.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Пациентам, имевшим эпизоды сильной сонливости и/или внезапного засыпания во время терапии пирибедилом, следует воздержаться от управления транспортными средствами и оборудованием, требующим высокой степени внимания, до исчезновения данных реакций.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте. Специальных условий хранения не требуется. Не применять по окончании срока годности, указанного на упаковке.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Pronoran