Рольприна Ср



Код АТХ:

- N04BC04

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Ропинирол

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки пролонгированного действия, покрытые пленочной оболочкой розового цвета, овальные, двояковыпуклые.

	1 таб.
ропинирола гидрохлорид	2.28 мг,
что соответствует содержанию ропинирола	2 мг

Вспомогательные вещества: гипромеллоза 250 мг, лактозы моногидрат 164.72 мг, кремния диоксид коллоидный 3 мг, карбомер 20 мг, касторовое масло гидрогенизированное 50 мг, магния стеарат 10 мг.

Состав пленочной оболочки: Опадрай белый Y-1-7000 14.925 мг (гипромеллоза 62.5%, титана диоксид 31.25%, макрогол-400 6.25%), краситель железа оксид красный 0.045 мг, краситель железа оксид желтый 0.03 мг.

7 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.
7 шт. - блистеры (8) - пачки картонные.
7 шт. - блистеры (12) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (6) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (9) - пачки картонные.

Таблетки пролонгированного действия, покрытые пленочной оболочкой светло-коричневого цвета, овальные, двояковыпуклые.

	1 таб.
ропинирола гидрохлорид	4.56 мг,
что соответствует содержанию ропинирола	4 мг

Вспомогательные вещества: гипромеллоза 250 мг, лактозы моногидрат 162.44 мг, кремния диоксид коллоидный 3 мг, карбомер 20 мг, касторовое масло гидрогенизированное 50 мг, магния стеарат 10 мг.

Состав пленочной оболочки: Опадрай белый Y-1-7000 14.3 мг (гипромеллоза 62.5%, титана диоксид 31.25%, макрогол-400 6.25%), краситель железа оксид красный 0.14 мг, краситель железа оксид желтый 0.49 мг, краситель железа оксид черный 0.07 мг.

7 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.
7 шт. - блистеры (8) - пачки картонные.

7 шт. - блистеры (12) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (6) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (9) - пачки картонные.

Таблетки пролонгированного действия, покрытые пленочной оболочкой коричневато-розового цвета, овальные, двояковыпуклые.

	1 таб.
ропинирола гидрохлорид	9.12 мг,
что соответствует содержанию ропинирола	8 мг

Вспомогательные вещества: гипромеллоза 250 мг, лактозы моногидрат 157.88 мг, кремния диоксид коллоидный 3 мг, карбомер 20 мг, касторовое масло гидрогенизированное 50 мг, магния стеарат 10 мг.

Состав пленочной оболоки: Опадрай белый Y-1-7000 14.3 мг (гипромеллоза 62.5%, титана диоксид 31.25%, макрогол-400 6.25%), краситель железа оксид красный 0.49 мг, краситель железа оксид желтый 0.14 мг, краситель железа оксид черный 0.07 мг.

7 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.
7 шт. - блистеры (8) - пачки картонные.
7 шт. - блистеры (12) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (6) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (9) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Интермедианты
- Нейротропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Ропинирол является эффективным и высокоселективным неэрголиновым агонистом D_2-, D_3-допаминовых рецепторов, который обладает периферическим и центральным действием.

Препарат не действует на разрушающиеся пресинаптические дофаминергические нейроны черного вещества и действует непосредственно как синтетический нейротрансмиттер. Таким образом, ропинирол уменьшает степень гиподинамии, ригидности и тремора, которые являются симптомами болезни Паркинсона.

Ропинирол компенсирует дефицит дофамина в системах черного вещества и полосатого тела посредством стимулирования дофаминовых рецепторов в полосатом теле.

Ропинирол оказывает действие на уровне гипоталамуса и гипофиза, ингибируя секрецию пролактина.

Ропинирол усиливает эффекты леводопы, включая контроль частоты феномена «включения-выключения» и эффекта «конца дозы», связанные с длительной терапией леводопой.

Влияние ропинирола на реполяризацию миокарда

Влияние ропинирола на продолжительность интервала QT изучали у здоровых добровольцев (мужчин и женщин), получавших ропинирол в таблетках немедленного высвобождения в дозах 0,5, 1,2 и 4 мг один раз в сутки. Максимальное удлинение интервала QT при приеме ропинирола в дозе 1 мг составило 3,46 мс по сравнению с плацебо. Верхняя граница одностороннего 95% доверительного интервала для максимального среднего эффекта составила менее 7,5 мс. Влияние ропинирола на продолжительность интервала QT при его приеме в более высоких дозах не изучалось. Отсутствует риск удлинения интервала QT на ЭКГ при применении ропинирола в дозах до 4 мг/сут. Полностью исключить риск удлинения интервала QT на ЭКГ при применении ропинирола невозможно, так как нет анализа данных по его применению в дозах до 24 мг/сут.

Фармакокинетика

Всасывание

Биодоступность ропинирола после приема внутрь составляет примерно 50% (36-57%). После приема внутрь ропинирола в таблетках пролонгированного действия его концентрация в плазме крови повышается медленно, среднее время достижения максимальной концентрации (TC_{max}) в плазме крови составляет 6-10 часов. В равновесном состоянии у пациентов с болезнью Паркинсона после приема внутрь 12 мг ропинирола один раз в сутки одновременно с жирной пищей, в сравнении с применением натощак наблюдалось повышение системной экспозиции ропинирола. При этом отмечалось увеличение площади под кривой AUC (90% доверительного интервала (1,12; 1,28)) и C_{max}(90% доверительного интервала (1,34; 1,56)) в плазме крови, в среднем, на 20% и 44%, соответственно, а TC_{max} удлинялось на 3 ч.

Системная экспозиция ропинирола при приеме таблеток пролонгированного действия соответствует системной экспозиции при приеме таблеток немедленного высвобождения в одинаковой суточной дозе. Фармакокинетика ропинирола в дозе до 24 мг/сут линейна (таблетки ропинирола немедленного высвобождения 8 мг 3 раза в сутки).

Распределение

Связь с белками плазмы крови низкая и составляет 10-40%. Благодаря высокой липофильности ропинирол характеризуется большим объемом распределения (около 7 л/кг).

Метаболизм

Ропинирол активно метаболизируется в печени преимущественно изоферментом CYP1A2. Основной метаболит (N-депропил метаболит) является неактивным и в дальнейшем конвертируется до карбамилглюкуронида, карбоновой кислоты и N-депропил гидроксиметаболитов. Метаболиты преимущественно выводятся почками.

Выведение

$T_{1/2}$ ропинирола из системного кровотока, в среднем, составляет около 6 ч. Увеличение продолжительности системного действия ропинирола C_{max} и AUC приблизительно пропорционально увеличению дозы. Нет отличий в выведении ропинирола после однократного приема дозы внутрь или при его регулярном применении. Отмечена высокая межиндивидуальная вариабельность показателей фармакокинетики. При применении ропинирола в таблетках пролонгированного действия в равновесном состоянии межиндивидуальная вариабельность C_{max} составила 30-55%, AUC - 40-70%.

Фармакокинетика у отдельных групп пациентов

Нарушение функции почек

Фармакокинетические показатели не изменяются у пациентов с болезнью Паркинсона с нарушением функции почек легкой и средней степени.

У пациентов с терминальной почечной недостаточностью, находящихся на программном (хроническом) гемодиализе, клиренс ропинирола при приеме внутрь снижается примерно на 30%. Клиренс метаболитов ропинирола также снижается примерно на 60-80%. Поэтому максимальная суточная доза в этих случаях составляет 18 мг.

Пациенты пожилого возраста

Клиренс ропинирола после приема внутрь снижается примерно на 15% у пациентов в возрасте 65 лет и старше по сравнению с более молодыми пациентами. Коррекции дозы у данной категории пациентов не требуется.

Показания к применению:

Болезнь Паркинсона:

— монотерапия ранних стадий заболевания у пациентов, нуждающихся в дофаминергической терапии;

— в качестве комбинированной терапии у пациентов, получающих препараты леводопы, в целях повышения эффективности леводопы, включая контроль флуктуаций терапевтического действия леводопы (феномен «включения-выключения») и эффекта «конца дозы» на фоне хронической терапии леводопы, а так же в целях снижения суточной дозы леводопы.

Противопоказания:

— гиперчувствительность к действующему веществу или любому из компонентов препарата;

— почечная недостаточность тяжелой степени (клиренс креатинина (КК) менее 30 мл/мин) у пациентов, не получающих лечение программным (хроническим) гемодиализом;

— нарушение функции печени;

— детский возраст до 18 лет;

— дефицит лактазы, непереносимость лактозы, синдром глюкозо-галактозной мальабсорбции;

— период грудного вскармливания.

С осторожностью:

В связи с фармакологическим действием ропинирола его следует назначать с осторожностью пациентам с тяжелой сердечно-сосудистой недостаточностью.

Ропинирол можно назначать пациентам с психотическими расстройствами в анамнезе, в тех случаях, если ожидаемая польза его применения превышает потенциальный риск.

Способ применения и дозы:

Внутрь. Препарат Рольприна СР следует принимать один раз в сутки, в одно и то же время, вне зависимости от приема пищи. Пациентам для достижения требуемой дозы ропинирола рекомендуется принимать минимальное количество таблеток пролонгированного действия, используя максимальные возможные дозировки таблеток препарата Рольприна СР. У некоторых пациентов одновременное применение с жирной пищей может увеличить AUC и/или C_{max} в 2 раза. Таблетки Рольприна СР следует проглатывать целиком. Не следует разжевывать или делить на части, т. к. оболочка таблетки обеспечивает пролонгированное высвобождение ропинирола.

Рекомендуется индивидуальный подбор дозы препарата с учетом эффективности и переносимости. Если пациент испытывает сонливость на любом этапе подбора дозы, рекомендуется снизить дозу препарата. При развитии других нежелательных реакций необходимо снизить дозу препарата с последующим постепенным увеличением дозы. Необходимость подбора дозы должна рассматриваться при пропуске дозы (одной или более).

Монотерапия

Начальный подбор дозы

Рекомендованная стартовая доза препарата Рольприна СР составляет 2 мг один раз в сутки в течение первой недели, на второй неделе дозу следует увеличить до 4 мг один раз в сутки. Терапевтический эффект может быть достигнут при применении препарата Рольприна СР в дозе 4 мг один раз в сутки.

Схема лечения

Необходимо проводить терапию ропиниролом в минимальной эффективной дозе.

В дальнейшем, при необходимости, дозу увеличивают на 2 мг с интервалами не менее 1 недели до 8 мг в сутки.

Если терапевтический эффект препарата Рольприна СР в дозе 8 мг/сутки недостаточно выражен или является неустойчивым, можно продолжить увеличение суточной дозы препарата на 2-4 мг каждые 2 недели или с более длительными интервалами (до достижения необходимого терапевтического эффекта). Максимальная суточная доза составляет 24 мг в один прием.

Комбинированная терапия

При одновременном применении препарата Рольприна СР в дозах, применяющихся при монотерапии, с леводопой, возможно постепенное снижение дозы леводопы (до 30%) в зависимости от клинического эффекта. У пациентов с прогрессирующей формой болезни Паркинсона, одновременно получающих леводопу, в период подбора дозы ропинирола пролонгированного высвобождения может развиться дискинезия. При возникновении дискинезии дозу леводопы следует снизить.

В случае перехода с терапии другим агонистом дофаминовых рецепторов на препарат Рольприна СР необходимо выполнить рекомендации, касающиеся отмены ранее принимавшегося препарата.

Отмена терапии

Как и в случае с другими агонистами дофаминовых рецепторов, препарат Рольприна СР следует отменять постепенно, снижая суточную дозу в течение не менее 1 недели.

Переход от терапии таблетками ропинирола (с немедленным высвобождением) на терапию таблетками пролонгированного действия Рольприна СР

Пациенты могут быть сразу же переведены с терапии таблетками ропинирола с немедленным высвобождением на терапию таблетками пролонгированного действия Рольприна СР.

Доза препарата Рольприна СР (таблетки пролонгированного действия) должна соответствовать принимаемой суточной дозе ропинирола в таблетках немедленного высвобождения. Рекомендуемые соответствующие дозы препарата Рольприна СР (таблетки пролонгированного действия) в случае перехода с терапии таблетками ропинирола немедленного высвобождения представлены в таблице (см. ниже). При приеме другой дозы таблеток ропинирола немедленного высвобождения, неуказанной в таблице, пациента следует перевести на ближайшую дозу, указанную в таблице:

Ропинирол, таблетки немедленного высвобождения Суточная доза (мг)	Ропинирол, таблетки пролонгированного действия (препарат Рольприна СР) Суточная доза (мг)
0,75-2,25	2
3-4,5	4
6	6
7,5-9	8
12	12
15-18	16
21	20
24	24

При необходимости, в дальнейшем доза может быть скорректирована в зависимости от терапевтического ответа (см. подразделы «Начальный подбор дозы» и «Схема лечения»).

Прерывание терапии

При пропуске дозы (одной или более) и дальнейшего возобновления терапии необходимо повторно провести подбор дозы.

Особые группы пациентов

Пациенты пожилого возраста

Клиренс ропинирола после приема внутрь снижается примерно на 15% у пациентов пожилого возраста по сравнению с более молодыми пациентами. Коррекции дозы у данной категории пациентов не требуется.

У пациентов в возрасте 75 лет и старше целесообразен более медленный подбор дозы.

Нарушение функции почек

У пациентов с легким или умеренным нарушением функции почек (КК 30-50 мл/мин) клиренс ропинирола не изменяется. Поэтому коррекции дозы ропинирола не требуется. Рекомендуемая стартовая доза ропинирола у пациентов с терминальной стадией почечной недостаточности, находящихся на гемодиализе, составляет 2 мг один раз в сутки. В дальнейшем, дозу увеличивают с учетом переносимости и эффективности препарата. Максимальная суточная доза ропинирола у пациентов, находящихся на программном (хроническом) гемодиализе, составляет 18 мг. Прием дополнительных доз после проведения гемодиализа не требуется.

У пациентов с тяжелой почечной недостаточностью (КК менее 30 мл/мин), не получающих лечение программным (хроническим) гемодиализом, применение ропинирола не изучалось.

Побочное действие:

Классификация частоты развития побочных эффектов Всемирной организации здравоохранения (ВОЗ):

очень часто ≥ 1/10

часто от ≥ 1/100 до < 1/10

нечасто от ≥ 1/1000 до < 1/100

редко от ≥ 1/10000 до < 1/1000

очень редко < 1/10000

частота неизвестна не может быть оценена на основе имеющихся данных.

В пределах каждой группы частота побочных реакций представлена в порядке уменьшения значимости.

Нежелательные реакции, наблюдавшиеся у пациентов с болезнью Паркинсона в клинических исследованиях по изучению применения ропинирола в таблетках пролонгированного действия в дозах до 24 мг/сут

	Монотерапия	Одновременное применение с леводопой
Нарушения психики		

Часто	галлюцинации	галлюцинации
Нарушения со стороны нервной системы		
Очень часто	сонливость	дискенезия*
Часто	головокружения (включая вертиго)	сонливость, головокружения (включая вертиго)
Нарушения со стороны сосудов		
Часто		ортостатическая гипотензия, снижение АД
Нечасто	ортостатическая гипотензия, снижение АД	
Нарушения со стороны ЖКТ		
Очень часто	тошнота	
Часто	запор	тошнота, запор
Общие расстройства и нарушения в месте введения		
Часто	периферические отеки	периферические отеки

*У пациентов с прогрессирующей формой болезни Паркинсона в период подбора дозы ропинирола может развиться дискинезия. По данным клинических исследований снижение дозы леводопы может привести к уменьшению выраженности дискинезии.

Нежелательные реакции, наблюдавшиеся у пациентов с болезнью Паркинсона в клинических исследованиях (в дозах до 24 мг/сут), и/или при пострегистрационном применении ропинирола немедленного высвобождения

	Монотерапия	Одновременное применение с леводопой
Нарушения со стороны иммунной системы:		
Частота неизвестна	реакции гиперчувствительности (включая крапивницу, ангионевротический отек, кожную сыпь и кожный зуд)	реакции гиперчувствительности (включая крапивницу, ангионевротический отек, кожную сыпь и кожный зуд)
Нарушения психики:		
Часто		спутанность сознания
Нечасто	психотические реакции (помимо галлюцинаций), включая делирий, бред, паранойю	психотические реакции (помимо галлюцинаций), включая делирий, бред, паранойю
Частота неизвестна	нарушение контроля импульсов, включая патологическое влечение к азартным играм, гиперсексуальность, повышение либидо, непреодолимое влечение к покупкам. компульснвное переедание	нарушение контроля импульсов, включая патологическое влечение к азартным играм, гиперсексуальность, повышение либидо, непреодолимое влечение к покупкам. компульснвное переедание
Нарушения со стороны нервной системы:		
очень часто	обморок	сонливость
Нечасто	выраженная сонливость и эпизоды внезапного засыпания**	выраженная сонливость и эпизоды внезапного засыпания**
Нарушения со стороны сосудов:		
Нечасто	ортостатическая гипотензия, снижение АД (редко тяжелое)	ортостатическая гипотензия, снижение АД (редко тяжелое)
Нарушения со стороны ЖКТ:		
очень часто		тошнота
Часто	рвота, изжога, боль в животе	изжога
Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей:		
частота неизвестна	нарушение функции печени (в основном, повышение активности «печеночных» ферментов)	нарушение функции печени (в основном, повышение активности «печеночных» ферментов)
Общие расстройства и нарушения в месте введения:		
Часто	отеки ног	

**Лечение ропиниролом вызывало развитие сонливости и нечасто сопровождалось выраженной сонливостью и эпизодами внезапного засыпания.

Нарушение контроля импульсов (расстройства привычек и влечений) патологическое влечение к азартным играм, повышение либидо, гиперсексуальность, непреодолимое влечение к покупкам, компульсивное переедание, может возникнуть у пациентов, применяющих агонисты дофаминовых рецепторов, в том числе препарат Рольприна СР (см, раздел «Особые указания»).

Передозировка:

Симптомы: в основном симптомы передозировки связаны с дофаминергической активностью (тошнота, рвота, головокружение, сонливость).

Лечение: антагонисты дофаминовых рецепторов, такие как типичные нейролептики и метоклопрамид.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Недостаточно данных по применению ропинирола у беременных женщин. В исследованиях на животных выявлена репродуктивная токсичность. Потенциальный риск применения у беременных женщин неизвестен, поэтому применение препарата Рольприна СР при беременности возможно, если потенциальная польза для матери превышает риск для плода.

Не следует принимать в период грудного вскармливания, т. к. может ингибировать лактацию.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Не отмечено фармакокинетического взаимодействия между ропиниролом и леводопой или домперидоном, которое потребовало бы изменения доз этих препаратов. Нейролептики и другие антагонисты дофаминовых рецепторов центрального действия, такие как сульпирид или метоклопрамид, могут уменьшить эффективность ропинирола, поэтому следует избегать одновременного применения этих препаратов.

У пациентов, получавших высокие дозы эстрогенов, отмечено повышение концентрации ропинирола в плазме крови. У женщин, уже получающих заместительную гормонотерапию (ЗГТ) до начала лечения ропиниролом, коррекции дозы ропинирола не требуется. Однако, в случае назначения ЗГТ или ее отмены на фоне лечения ропиниролом, может потребоваться коррекция дозы препарата Рольприна СР.

Ропинирол, в основном, метаболизируется под действием изофермента CYP1A2. При одновременном применении ропинирола (в дозе 2 мг три раза в сутки) с ципрофлоксацином увеличивались показатели C_{max} и AUC ропинирола на 60% и 84%, соответственно, что может привести к развитию нежелательных явлений. В связи с этим, у пациентов, получающих ропинирол, его доза должна быть скорректирована при назначении или отмене препаратов, ингибирующих изофермент CYP1A2, таких как: ципрофлоксацин, эноксацин или флувоксамин.

Фармакокинетического взаимодействия между ропиниролом (в дозе 2 мг три раза в сутки) и теофиллином, являющимся субстратом изофермента CYP1A2, у пациентов с болезнью Паркинсона не отмечено.

Никотин повышает активность изофермента CYP1A2. Если пациент прекращает или начинает курить во время лечения ропиниролом, может потребоваться коррекция его дозы.

Особые указания и меры предосторожности:

Учитывая риск развития артериальной гипотензии, у пациентов с тяжелой сердечнососудистой недостаточностью (в частности, с ишемической болезнью сердца) рекомендуется контролировать АД, особенно в начале лечения. Одновременное применение с гипотензивными и антиаритмическими препаратами не изучаюсь. Следует соблюдать осторожность при одновременном применении с указанными препаратами, т. к. риск развития артериальной гипотензии, брадикардии или других аритмий неизвестен.

Пациентам с психотическими расстройствами или наличием их в анамнезе следует назначать агонисты дофаминовых рецепторов только в случаях, если ожидаемая польза применения превышает потенциальный риск.

Следует предупредить пациентов о возможном развитии сонливости или эпизодов внезапного засыпания, особенно у пациентов с болезнью Паркинсона. Эпизоды внезапного засыпания в течение дня, в некоторых случаях без предвестников, отмечались нечасто. В случае возникновения таких реакций следует рассмотреть возможность отмены терапии.

Нарушение контроля импульсов (расстройства привычек и влечений)

Необходимо регулярно контролировать возможность развития нарушений контроля импульсов. Пациентов и их опекунов следует информировать о том, что при применении агонистов дофаминовых рецепторов, в т. ч. ропинирола, возможны поведенческие проявления расстройства импульсивного контроля, например, патологическое влечение к азартным играм, увеличение либидо, гиперсексуальность, непреодолимое влечение к покупкам, компульсивное переедание. Нарушения контроля импульсов, как правило, обратимы после снижения дозы или отмены препарата. При появлении таких симптомов целесообразно снизить дозу ропинирола или постепенно прекратить его применение.

Препарат Рольприна СР выпускается в виде таблеток пролонгированного действия, покрытых пленочной оболочкой, со свойством высвобождения действующего вещества в течение 24 часов. В случае быстрого прохождения препарата через ЖКТ существует риск неполного высвобождения лекарственного вещества и перехода его остатка в стул.

Специальная информация по вспомогательным веществам

Препарат Рольприна СР содержит лактозу, поэтому противопоказан пациентам с дефицитом лактазы, непереносимостью лактозы, синдромом глюкозо-галактозной мальабсорбции.

Влияние на способность управлять автотранспортом и другими техническими устройствами

Пациенты должны быть предупреждены о возможных нежелательных реакциях во время терапии ропиниролом. Пациенты должны быть проинформированы о том, что имеются очень редкие случаи развития эпизодов внезапного засыпания без каких-либо предвестников и случаи головокружения (вплоть до вертиго).

Если у пациента развилась сонливость днем и/или возникли эпизоды внезапного засыпания в течение дня, требующие активного вмешательства, пациента необходимо предупредить о том, что он не должен управлять автомобилем, и ему следует избегать других видов деятельности, требующих высокой скорости психомоторных реакции.

При нарушениях функции почек

Прием препарата противопоказан пациентам с почечной недостаточностью тяжелой степени (КК менее 30 мл/мин), не получающим лечение программным (хроническим) гемодиализом

При нарушениях функции печени

Прием препарата противопоказан пациентам с нарушением функции печени.

Применение в пожилом возрасте

Коррекции дозы пациентам пожилого возраста не требуется.

Применение в детском возрасте

Препарат противопоказан детям до 18 лет.

Условия хранения:

При температуре не выше 30°С, в оригинальной упаковке. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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