

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
Селегілін ГЕКСАЛ
(Selegilin HEXAL)

Загальна характеристика:

міжнародна та хімічна назви: selegilin; (R)-N, альфа-диметил-N-2-пропінілбензолетанамін;

основні фізико-хімічні властивості: таблетки по 5 мг: білі, круглі, двоопуклі таблетки з написом “SN5” на одному боці;

таблетки по 10 мг: білі, круглі, двоопуклі таблетки з написом “SN10” і рискою на одному боці;

склад: 1 таблетка містить селегіліну (у вигляді гідрохлориду) 5 мг або 10 мг;

допоміжні речовини: лактози моногідрат, крохмаль кукурудзяний, кислоти лимонної моногідрат, полівідон К30, тальк очищений, магнію стеарат.

Форма випуску. Таблетки.

Фармакотерапевтична група. Протипаркінсонічні засоби. Інгібітори моноаміноксидази типу В. Код АТС N04B D01.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Селегілін є селективним і необоротним інгібітором моноаміноксидази В у мозку (МАО-В), відповідальної, головним чином, за руйнування дофаміну. Селегілін пригнічує метаболізм дофаміну, виключаючи підвищення його концентрації в нейронах.

Потенціює та пролонгує терапевтичну дію леводопи: при комбінації із селегіліном дозу леводопи можна зменшити. В умовах комбінованої терапії, при встановленні оптимального рівня дози, побічні ефекти леводопи виражені менше, ніж при монотерапії леводопою. Додатковий прийом селегіліну в ході лікування леводопою не показаний пацієнтам, у яких спостерігаються незалежно від дози коливання ефективності дії леводопи.

Фармакокінетика. Селегілін швидко та повністю абсорбується зі шлунково-кишкового тракту. Максимальні концентрації селегіліну та його метаболітів досягаються через 0,5 - 2 год після застосування. Зв'язування з білками крові – 94%. Селегілін та його метаболіти проникають через гематоенцефалічний бар'єр.

Метаболізується, головним чином, у печінці. Для селегіліну характерний значний ефект першого проходження. У плазмі, спинномозковій рідині і сечі людини було виявлено 3 основних метаболіти (дезметилселегілін, L-метамфетамін і L-амфетамін). Накопичення селегіліну та його метаболітів в організмі не спостерігається. Біодоступність препарату збільшується при одночасному застосуванні з їжею.

Метаболіти виводяться переважно з сечею (70 - 85%), трохи менший відсоток – з фекаліями.

Показання для застосування. Хвороба Паркінсона, симптоматичний паркінсонізм.

Як монотерапія при первинно встановленому діагнозі або в комбінації з леводопою (у поєднанні з периферичними інгібіторами декарбоксілази або без них).

Спосіб застосування та дози. Початкова добова доза для дорослих зазвичай становить 5 - 10 мг селегіліну гідрохлориду у вигляді монотерапії або комбінованого лікування з леводопою та периферичним інгібітором декарбоксілази. Максимальна підтримуюча доза Селегіліну ГЕКСАЛ становить 10 мг на добу.

Таблетки слід приймати, не розжовуючи, запиваючи невеликою кількістю рідини, по 5 - 10 мг після сніданку або по 5 мг після сніданку та обіду.

При комбінованому застосуванні з леводопою доза останнього може бути зменшена настільки, наскільки це можливо для досягнення відповідного контролю за симптомами хвороби (можна

зменшити на 10 - 30% у перші 2 - 3 дні).

Тривалість застосування залежить від перебігу захворювання і встановлюється індивідуально.

Побічна дія. При лікуванні селегіліном можливі ксеростомія (сухість у роті), запаморочення і порушення сну; тимчасове транзиторне збільшення активності печінкових ферментів – аланін- і аспартат-трансамінази, що минають після припинення лікування. Рідко – аритмія (суправентрикулярна аритмія), брадикардія, атріовентрикулярна блокада.

При комбінованому лікуванні селегіліном і леводопою можуть мати місце такі ефекти: рухові розлади (такі як дискінезія), гіпотензія, нудота, блювання, ксеростомія, запаморочення, психози (у тому числі галюцинації і стани розгубленості), безсоння, головний біль. Рідко – аритмії, розлади сечовипускання, шкірні реакції, неспокій, запор, анорексія, затримка тканинної рідини, виснаження, гіпертензія, збудження, стенокардія, задишка, спазми, лейкопенія і зменшення кількості тромбоцитів.

Приймання селегіліну разом з максимальними дозами леводопи може провокувати аутокінези (мимовільні рухи) та/або ажитацію. Такі побічні ефекти зменшуються при зниженні дози леводопи, що можливо в умовах комбінованого лікування із застосуванням селегіліну.

Протипоказання. Підвищена чутливість до селегіліну або будь-яких інших допоміжних речовин. Пептична виразка шлунка або 12-палої кишки, знижена функція нирок/печінки, екстрапірамідні порушення, не пов'язані з дефіцитом дофаміну (есенціальний тремор, хорея Геттінгтона). Вагітність і лактація. Дитячий вік.

Комбіноване застосування селегіліну з леводопою протипоказано при артеріальній гіпертензії, тиреотоксикозі, феохромоцитомі, закритокутовій глаукомі, доброякісній гіпертрофії передміхурової залози, тахіаритмії, тяжкій стенокардії, при психічних розладах, прогресуючій деменції.

Передозування. Селегілін має низьку токсичність. Він швидко руйнується в організмі, а продукти метаболізму швидко виводяться. У високих дозах селегілін втрачає свою вибірковість щодо MAO-B та інгібує також MAO-A, що може призводити до перепадів артеріального тиску (так званий “сирний ефект”), особливо у поєднанні з їжею, багатой на тирамін. Сильне інгібування MAO-B супроводжується переважно блюванням.

Специфічний антидот невідомий. Лікування повинно бути симптоматичним; за пацієнтом необхідно вести спостереження протягом 24 - 48 год.

Особливості застосування. Застосування Селегіліну ГЕКСАЛ практично не супроводжується появою так званого ефекту сиру, що може бути спричинений вживанням їжі (особливо деяких сортів сиру), що містить тирамін або інші біогенні аміни, та проявляється нападами головного болю та підвищенням артеріального тиску; тому застосування препарату, на відміну від інших інгібіторів MAO, не потребує дієти.

Вплив на керування автотранспортними засобами або іншими складними механізмами.

Селегілін може погіршувати здатність концентрувати увагу під час керування автомобілем або іншими складними механізмами, особливо на початку лікування, при зміні препарату або у поєднанні з алкоголем.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами. *Протипоказано* одночасне застосування разом з такими лікарськими засобами, як: інгібітори зворотного захоплення серотоніну (наприклад циталопрамом, флуоксетином, флувоксаміном, пароксетином, сертраліном), інгібітори моноаміноксидази, петидин, трамадол та інші опіати або агоністи серотоніну (наприклад суматриптан, наратриптан, золмітриптан, ризатриптан).

Інгібітори зворотного захоплення серотоніну можна застосовувати не раніше, як через 2 тижні після завершення лікування селегіліном.

Селегілін можна призначати не раніше, як через тиждень (у випадку флуоксетину не раніше як через 5 тижнів) після відміни інгібіторів зворотного захоплення серотоніну. Суматриптан або речовини з

подібною дією не можна застосовувати раніше, як через 24 год після припинення лікування селегіліном.

Слід уникати одночасного застосування селегіліну та симпатоміметиків.

Селегілін посилює дію леводопи.

При одночасному застосуванні Селегіліну ГЕКСАЛ та амантадину або антихолінергічних лікарських засобів побічні реакції спостерігаються частіше.

При лікуванні Селегіліном ГЕКСАЛ слід уникати надмірного вживання алкоголю.

Умови та термін зберігання. Зберігати в недоступному для дітей місці при температурі не вище 25 С. Термін придатності – 3 роки.

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка. По 10 таблеток у блістері; по 3 (3 10) або по 10 (10 10) блістерів у картонній коробці.

Виробник. “Салютас Фарма ГмбХ”, підприємство компанії “Гексал АГ”, Німеччина.

Адреса. HEXAL AG, Industriestrasse 25, D-83607 Holzkirchen, Germany.