Берголак



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Каберголин

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки белого цвета, продолговатые, двояковыпуклые, с риской с одной стороны.

	1 таб.
каберголин	500 мкг

Вспомогательные вещества: лейцин, лактоза безводная (лактопресс), магния стеарат.

2 шт. - флаконы полимерные (1) - пачки картонные.
8 шт. - флаконы полимерные (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Агонист допаминовых рецепторов, эрголиновое производное, подавляет секрецию пролактина. Стимулирует допаминовые D_2-рецепторы лактотропных клеток гипофиза; в высоких дозах обладает центральным допаминергическим эффектом. Снижает концентрацию пролактина в крови, восстанавливает менструальный цикл и фертильность. За счет снижения концентрации пролактина в крови у женщин восстанавливается пульсирующая секреция гонадотропинов и высвобождение лютеинизирующего гормона в середине цикла, устраняются ановуляторные циклы и повышается концентрация эстрогенов в организме, снижается выраженность гипоэстрогенных (повышение массы тела, задержка жидкости, остеопороз) и гиперандрогенных (акне, гирсутизм) симптомов.

У мужчин уменьшает обусловленные гиперпролактинемией снижение либидо, импотенцию (со снижением концентрации пролактина возрастает концентрация тестостерона), гинекомастию, лакторею. Подвергаются

обратному развитию макроаденомы гипофиза и связанная с ними симптоматика (головная боль, нарушение полей и остроты зрения, функций черепных нервов и передней доли гипофиза). Снижает концентрацию пролактина у больных с пролактиномой и псевдопролактиномой (у последних - без уменьшения размеров аденомы гипофиза). Снижение концентрации пролактина отмечается через 3 ч после приема и сохраняется в течение 7-28 дней у пациентов с гиперпролактинемией и 14-21 дней - при подавлении послеродовой лактации. Снижение концентрации пролактина происходит в течение 2-4 недель лечения.

Фармакокинетика

Всасывание и распределение

Абсорбция высокая, не зависит от приема пищи. Время достижения C_{max} в плазме крови - 0.5-4 ч. Связывание с белками плазмы - 41-42%.

$T_{1/2}$ составляет 63-68 ч у здоровых добровольцев и 79-115 ч - у пациентов с гиперпролактинемией. Вследствие длительного $T_{1/2}$ состояние равновесной концентрации достигается через 4 недели терапии.

Метаболизм и выведение

Активно метаболизируется. Метаболиты обладают значительно меньшим эффектом в отношении подавления секреции пролактина по сравнению с каберголином.

Выводится почками и через кишечник около 18% и 72% от принятой дозы каберголина соответственно, при этом в виде неизмененного каберголина почками выводится 2-3%.

Показания к применению:

— предотвращение послеродовой лактации;

— подавление уже установившейся послеродовой лактации;

— лечение нарушений, связанных с гиперпролактинемией, включая аменорею, олигоменорею, ановуляцию, галакторею;

— пролактинсекретирующие аденомы гипофиза (микро- и макропролактиномы); идиопатическая гиперпролактинемия; синдром пустого турецкого седла в сочетании с гиперпролактинемией.

Относится к болезням:

- Аменорея

Противопоказания:

— возраст до 16 лет (безопасность и эффективность у данной категории пациентов не установлена);

— редкие наследственные формы непереносимости галактозы, врожденный дефицит лактазы lapp или нарушение всасывания глюкозы-галактозы (т.к. препарат содержит лактозу);

— повышенная чувствительность к каберголину или другим компонентам препарата, а также к любым алкалоидам спорыньи.

С *осторожностью* следует назначать препарат при следующих состояниях и/или заболеваниях:

— артериальная гипертензия, развившаяся на фоне беременности (например, преэклампсия) и/или послеродовая артериальная гипертензия;

— тяжелые заболевания сердечно-сосудистой системы, синдром Рейно;

— пептическая язва, желудочно-кишечное кровотечение;

— тяжелая печеночная недостаточность;

— тяжелые психотические и когнитивные нарушения (в т.ч. в анамнезе);

— наличие фиброзных изменений сердца (вальвулопатия) и дыхательной системы (плеврит/плевральный фиброз), в т.ч. в анамнезе;

— одновременный прием с препаратами, оказывающими гипотензивное действие (из-за риска развития ортостатической гипотензии).

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь, во время еды.

Для *предотвращения лактации после родов* - 1 мг однократно (2 таб.) в первый день после родов.

Для *подавления установившейся лактации* - по 0.25 мг (1/2 таб.) 2 раза/сут через каждые 12 ч в течение 2 дней (общая доза - 1 мг).

С целью снижения риска ортостатической гипотензии у кормящих грудью матерей, однократная доза препарата Берголак не должна превышать 0.25 мг.

Для *лечения нарушений, связанных с гиперпролактинемией*: рекомендуемая начальная доза составляет 0.5 мг в неделю в 1 прием (1 таб.) или в 2 приема (по 1/2 таб., например, в понедельник и четверг). Увеличение недельной дозы должно проводиться постепенно - на 0.5 мг с месячным интервалом до достижения оптимального терапевтического эффекта. Терапевтическая доза обычно составляет 1 мг в неделю, но может колебаться от 0.25 до 2 мг в неделю.

Максимальная доза для пациентов с гиперпролактинемией не должна превышать 4.5 мг в неделю.

В зависимости от переносимости, недельную дозу препарата Берголак можно принимать однократно или разделить на 2 и более приемов в неделю. Разделение недельной дозы на несколько приемов рекомендуется при назначении препарата в дозе более 1 мг в неделю.

Вероятность развития побочных явлений можно уменьшить, начав терапию препаратом Берголак с низкой дозы (например, по 0.25 мг 1 раз в неделю), с последующим постепенным ее увеличением до достижения терапевтической дозы. Для улучшения переносимости препарата при возникновении выраженных побочных явлений возможно временное снижение дозы с последующим более постепенным ее увеличением (например, увеличение на 0.25 мг в неделю каждые 2 недели).

Побочное действие:

Побочные явления обычно преходящие, но степени тяжести - слабо или умеренно выражены и носят дозозависимый характер. Возникают, в основном, в течение первых 2 недель терапии и в большинстве случаев исчезают самостоятельно по мере продолжения терапии или через несколько дней после отмены каберголина.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: сердцебиение, приливы крови к коже лица, спазмы сосудов пальцев (как и другие производные спорыньи, каберголин может оказывать сосудосуживающее действие), вальвулопатия; редко - ортостатическая гипотензия (при длительном лечении каберголином - гипотензивное действие), отмечалось бессимптомное снижение АД в течение первых 3-4 дней после родов (систолического - более чем на 20 мм рт.ст., диастолического - более чем на 10 мм рт.ст.).

Со стороны нервной системы: головокружение/вертиго, головная боль, повышенная утомляемость, сонливость, депрессия, мания, астения, парестезии, обморок.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, боль в эпигастральной области, боль в животе, запор, гастрит, диспепсия, нарушение функции печени.

Аллергические реакции: реакции повышенной чувствительности, кожная сыпь.

Прочие: мастодиния, носовое кровотечение, транзиторная гемианопсия, судороги мышц нижних конечностей, алопеция, повышение активности КФК в сыворотке крови, отеки, плевральный фиброз, дыхательные нарушения (в т.ч. дыхательная недостаточность).

Передозировка:

Симптомы: тошнота, рвота, боль в животе, запор, снижение АД, ортостатическая гипотензия, головная боль, судороги икроножных мышц, резкая астения, потливость, сонливость, психомоторное возбуждение, психоз, галлюцинации.

Лечение: промывание желудка, контроль АД, назначение антагонистов допаминовых рецепторов (производные фенотиазина, бутирофенона, тиоксантена, метоклопрамида).

Применение при беременности и кормлении грудью:

Поскольку контролируемые клинические исследования с применением каберголина у беременных женщин не проводились, назначение препарата при беременности возможно только в случае крайней необходимости, когда потенциальная польза от применения препарата для женщины значительно превышает возможный риск для плода.

Наступления беременности следует избегать в течение, как минимум, одного месяца после прекращения приема каберголина, учитывая длительный $T_{1/2}$ препарата и наличие ограниченных данных о его воздействии на плод (по имеющимся данным применение каберголина в дозе 0.5-2 мг в неделю по поводу нарушений, связанных с гиперпролактинемией, не сопровождалось увеличением частоты выкидышей, преждевременных родов, многоплодной беременности и врожденных пороков развития).

Если беременность наступила на фоне лечения каберголином, следует рассмотреть целесообразность отмены препарата, также учитывая соотношение потенциальной пользы от применения препарата для женщины и возможного риска для плода.

Поскольку каберголин подавляет лактацию, препарат не следует назначать матерям, желающим кормить грудью. Во время лечения каберголином следует прекратить грудное вскармливание.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Не рекомендуется одновременное применение с алкалоидами спорыньи и их производными (при длительной терапии каберголином).

При одновременном применении антагонисты допаминовых рецепторов (производные фенотиазина, бутирофенона, тиоксантена; метоклопрамида) могут ослабить действие каберголина.

Не рекомендуется одновременное применение каберголина с макролидами в связи с возможным повышением концентрации каберголина в плазме крови. Механизм взаимодействия макролидов с каберголином достаточно не изучен, но, по всей видимости, объясняется способностью макролидов и каберголина конкурентно ингибировать систему цитохрома Р450.

Особые указания и меры предосторожности:

Перед назначением каберголина необходимо провести полное исследование функции гипофиза.

При увеличении дозы препарата пациенты должны находиться под наблюдением врача с целью установления наименьшей дозы, обеспечивающей терапевтический эффект. В период лечения рекомендуется регулярно (1 раз в месяц) определять концентрацию пролактина в сыворотке крови. Нормализация концентрации пролактина обычно наблюдается в течение 2-4 недель терапии каберголином.

После отмены каберголина обычно наблюдается рецидив гиперпролактинемии, однако у некоторых пациенток сохраняется стойкое снижение концентрации пролактина в течение нескольких месяцев. У большинства женщин овуляторные циклы сохраняются в течение не менее 6 месяцев после отмены каберголина.

Каберголин восстанавливает овуляцию и фертильность у женщин с гиперпролактинемическим гипогонадизмом. Поскольку беременность может наступить до восстановления менструации, рекомендуется проводить тесты на беременность не реже одного раза в 4 недели в течение периода аменореи, а после восстановления менструации - каждый раз, когда отмечается задержка менструации более чем на 3 дня.

Следует использовать барьерные методы контрацепции во время лечения каберголином, а также после отмены препарата до повторения ановуляции. Если беременность наступила во время лечения следует рассмотреть целесообразность отмены препарата. Женщины, у которых наступила беременность, должны находиться под наблюдением врача для своевременного выявления симптомов увеличения гипофиза (во время беременности возможно увеличение размеров уже существовавших опухолей гипофиза).

После длительного приема каберголина у пациентов наблюдались плевральный выпот/плевральный фиброз и вальвулопатия, поэтому каберголин следует применять с осторожностью пациентам с текущими проявлениями и/или клиническими симптомами нарушений функции сердца, в т.ч. в анамнезе.

Пациенткам с артериальной гипертензией, развившейся на фоне беременности (например, преэклампсия) и/или послеродовой артериальной гипертензией каберголин назначают только в тех случаях, когда потенциальная польза от применения препарата значительно превышает возможный риск.

Применение каберголина вызывает сонливость. У пациентов с болезнью Паркинсона применение агонистов допаминовых рецепторов может вызывать внезапное засыпание. В подобных случаях рекомендуется снизить дозу каберголина или прекратить терапию.

Исследования по применению каберголина у пациентов пожилого возраста с нарушениями, связанными с

гиперпролактинемией, не проводились.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения рекомендуется воздержаться от управления транспортными средствами и осуществления других видов деятельности, требующих повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции печени

С осторожностью следует назначать препарат при тяжелой печеночной недостаточности.

Применение в пожилом возрасте

Исследования по применению каберголина у пациентов пожилого возраста с нарушениями, связанными с гиперпролактинемией, не проводились.

Применение в детском возрасте

Противопоказан пациентам в возрасте до 16 лет (безопасность и эффективность у данной категории пациентов не установлена).

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°С.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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