Бромокриптин



Код АТХ:

- N04BC01

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Бромокриптин

Полезные ссылки:

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

Фармакотерапевтическая группа:

- Интермедианты
- Нейротропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Стимулятор центральных и периферических допаминовых D_2-рецепторов, производное алкалоида спорыньи. Уменьшает секрецию пролактина, а также повышенную секрецию СТГ, не влияя на нормальные уровни других гормонов гипофиза. Подавляет физиологическую лактацию, способствует нормализации менструальной функции, уменьшает размеры и число кист в молочной железе (за счет устранения дисбаланса между прогестероном и эстрогенами). В дозах более высоких, чем требуются для подавления секреции пролактина, бромокриптин вызывает выраженную стимуляцию допаминовых рецепторов, в частности в области полосатого тела, черного ядра мозга, гипоталамуса и мезолимбической системы. Оказывает противопаркинсоническое действие, подавляет секрецию СТГ и АКТГ.

После приема разовой дозы снижение уровня пролактина в крови наступает через 2 ч, максимальный эффект - через 8 ч; противопаркинсонический эффект развивается через 30-90 мин, максимальный эффект - через 2 ч; снижение уровня СТГ происходит через 1-2 ч, максимальный эффект - через 4-8 недель терапии.

Фармакокинетика

После приема внутрь абсорбция бромокриптина из ЖКТ составляет 28%. Подвергается эффекту "первого прохождения" через печень. Биодоступность - 6%. Время достижения максимальной концентрации в плазме крови - 1-3 ч. $T_{1/2}$ двухфазный: 4-4.5 ч в α-фазе, 1 ч - в терминальной фазе.

Связывание с альбуминами плазмы - 90-96%.

Выводится преимущественно с калом - 85.6% и в незначительной степени с мочой - 2.5-5.5%.

Показания к применению:

Нарушения менструального цикла, женское бесплодие: пролактинзависимые заболевания и состояния, сопровождающиеся или не сопровождающиеся гиперпролактинемией (аменорея, сопровождающаяся и не сопровождающаяся галактореей; олигоменорея; недостаточность лютеиновой фазы; вторичная гиперпролактинемия, индуцированная лекарственными средствами); пролактиннезависимое женское бесплодие (синдром поликистоза яичников; ановуляторные циклы - в качестве дополнительной терапии к антиэстрогенам).

Предменструальный синдром: болезненность молочных желез; отеки, связанные с фазой цикла; метеоризм; нарушения настроения.

Гиперпролактинемия у мужчин: пролактинзависимый гипогонадизм (олигосперимия, потеря либидо, импотенция).

Пролактиномы: консервативное лечение пролактинсекретирующих микро- и макроаденом гипофиза; в предоперационном периоде для уменьшения размера опухоли и облегчения ее удаления; послеоперационное лечение, если уровень пролактина остается повышенным.

Подавление лактации: предотвращение или прекращение послеродовой лактации по медицинским показаниям - предотвращение лактации после аборта; послеродовое нагрубание молочных желез; начинающийся послеродовый мастит.

Доброкачественные заболевания молочных желез: масталгия в изолированном виде или в сочетании с предменструальным синдромом или доброкачественными узловыми или кистозными изменениями); доброкачественные узловые и/или кистозные изменения, особенно фиброзно-кистозная мастопатия.

Болезнь Паркинсона и синдром паркинсонизма, в т.ч. после энцефалита (в виде монотерапии или в комбинации с другими противопаркинсоническими средствами).

Относится к болезням:

- Аменорея
- Бесплодие
- Импотенция
- Мастит
- Мастопатия
- Метеоризм
- Опухоли
- Отеки
- Паркинсонизм
- Фиброз
- Фиброма
- Энцефалит

Противопоказания:

Эссенциальный и семейный тремор, хорея Гентингтона, тяжелые формы сердечно-сосудистых заболеваний, артериальная гипертензия, артериальная гипотензия, эндогенные психозы, артериальная гипертензия в послеродовом периоде, токсикоз беременности, повышенная чувствительность к алкалоидам спорыньи.

Способ применения и дозы:

Индивидуальный. Внутрь - в дозе 1.25-2.5 мг 2-3 раза/сут. При мужском гипогонадизме, пролактиноме, доброкачественных заболеваниях молочных желез, акромегалии дозу постепенно повышают до 5-20 мг/сут; при паркинсонизме - до 10-40 мг/сут. Если во время подбора дозы развиваются побочные реакции, суточную дозу следует уменьшить и поддерживать на таком уровне в течение недели; при исчезновении побочных явлений дозу можно вновь увеличить.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, сухость во рту, запор, диарея, нарушения функции печени.

Со стороны ЦНС: головокружение (обычно возникают на первой неделе лечения), головная боль, сонливость, психомоторное возбуждение, дискинезия, снижение остроты зрения, галлюцинации.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: ортостатическая гипотензия, аритмия; в отдельных случаях, при длительном применении - синдром Рейно (особенно у предрасположенных пациентов).

Аллергические реакции: кожная сыпь.

Прочие: заложенность носа, судороги в икроножных мышцах.

Применение при беременности и кормлении грудью:

При наступлении беременности бромокриптин рекомендуется отменить как можно раньше после зачатия, за исключением тех случаев, когда имеются медицинские показания для продолжения терапии.

Возможно применение в период лактации по показаниям. Следует иметь в виду, что бромокриптин выделяется с грудным молоком.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с бромокриптином уменьшается эффективность антипсихотических средств антагонистов допаминовых рецепторов.

При одновременном применении с производными бутирофенона, фенотиазина возможно уменьшение эффектов бромокриптина.

У пациентов, одновременно получающих бромокриптин и симпатомиметики, наблюдались случаи развития сильной головной боли, артериальной гипертензии, судорог, нарушений функции сердца, психоза.

При одновременном применении с домперидоном возможно уменьшение эффекта бромокриптина при его назначении с целью уменьшения уровня пролактина.

При одновременном применении с леводопой усиливается противопаркинсоническое действие; с антигипертензивными препаратами - усиливается гипотензивное действие.

При одновременном применении с эритромицином, джозамицином, другими макролидными антибиотиками, октреотидом возможно повышение концентрации бромокриптина в плазме крови; с этанолом - возможно усиление побочных эффектов бромокриптина.

Бромокриптин снижает эффективность пероральных контрацептивов.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применяют при паркинсонизме с признаками деменции, при одновременном проведении антигипертензивной терапии, у пациентов с эрозивно-язвенными поражениями ЖКТ, указаниями в анамнезе на кровотечение из ЖКТ.

Поскольку в первые дни лечения возможны гипотензивные реакции, состояние беспокойства, необходим регулярный контроль АД и состояния пациента.

Большинство побочных эффектов бромокриптина обычно уменьшается или исчезает при снижении дозы. В начале лечения рекомендуется назначить противорвотное средство за 1 ч до приема бромокриптина.

Женщинам с регулярным менструальным циклом, получающим бромокриптин длительно, показано регулярное (1 раз в год) гинекологическое обследование, желательно с цитологическим исследованием тканей шейки матки и эндометрия. После наступления менопаузы такое обследование проводят ежемесячно в течение полугода.

При аденоме гипофиза, которая сопровождается значительным увеличением размеров турецкого седла и нарушением полей зрения, бромокриптин назначают только в тех случаях, когда хирургическое лечение и лучевая терапия оказались неэффективными.

Лечение бромокриптином может восстанавливать нормальную репродуктивную функцию. Для предотвращения нежелательной беременности следует использовать надежные противозачаточные средства (за исключением гормональных контрацептивов).

При назначении бромокриптина по поводу мастопатии следует исключить наличие злокачественной опухоли.

При болезни Паркинсона и синдроме паркинсонизма комбинированное применение бромокриптина и леводопы приводит к повышению клинического эффекта, что позволяет уменьшить дозу леводопы вплоть до полной отмены. Это является особенно важным для больных, у которых на фоне лечения леводопой развиваются моторные нарушения, а также отсутствует стабильный терапевтический эффект.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения следует воздерживаться от потенциально опасных видов деятельности, требующих повышенного внимания и быстрых психомоторных реакций.

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