Достинекс



Код АТХ:

- G02CB03

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, плоские, продолговатые; с маркировкой "P" и "U", разделенными насечкой, с одной стороны и "700" с короткими насечками сверху и снизу числа - с другой.

	1 таб.
каберголин	500 мкг

Вспомогательные вещества: лейцин, лактоза безводная.

2 шт. - флаконы темного стекла (1) - пачки картонные.
8 шт. - флаконы темного стекла (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Интермедианты

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Агонист допаминовых рецепторов. Каберголин - допаминергическое производное эрголина, характеризуется

выраженным и длительным пролактинснижающим действием. Механизм действия связан с прямой стимуляцией допаминовых D_2-рецепторов лактотропных клеток гипофиза. В дозах, превышающих таковые для снижения уровня пролактина в плазме крови, оказывает центральное допаминергическое действие, обусловленное стимуляцией допаминовых D_2-рецепторов.

Снижение уровня пролактина в плазме крови отмечается через 3 ч после приема Достинекса и сохраняется в течение 7-28 дней у здоровых добровольцев и пациенток с гиперпролактинемией и до 14-21 дня - у женщин в послеродовом периоде. Пролактинснижающее действие является дозозависимым как в отношении выраженности, так и длительности действия.

Каберголин обладает строго избирательным действием и, следовательно, не оказывает влияния на базальную секрецию других гормонов гипофиза, а также кортизола.

К фармакологическим воздействиям каберголина, не связанным с терапевтическим эффектом, относится снижение АД. При однократном применении препарата максимальный гипотензивный эффект отмечается в течение первых 6 ч и является дозозависимым.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь каберголин быстро абсорбируется из ЖКТ. C_{max} в плазме достигается через 0.5-4 ч. Прием пищи не влияет на абсорбцию и распределение каберголина.

Распределение

C_{ss} достигается через 4 недели терапии вследствие длительного $T_{1/2}$. Связывание с белками плазмы крови составляет 41-42%.

Метаболизм

Основным продуктом метаболизма каберголина, идентифицированным в моче, является 6-аллил-8β-карбокси-эрголин в концентрации до 4-6% от принятой дозы. Содержание в моче 3 дополнительных метаболитов не превышает 3% от принятой дозы. Продукты метаболизма обладают значительно меньшим эффектом в отношении подавления секреции пролактина по сравнению с каберголином.

Выведение

$T_{1/2}$, оцениваемый по скорости выделения с мочой, составляет 63-68 ч у здоровых добровольцев и 79-115 ч у больных с гиперпролактинемией.

Через 10 дней после применения препарата в моче и кале обнаруживаются соответственно 18% и 72% от принятой дозы, причем доля неизмененного препарата в моче составляет 2-3%.

Показания к применению:

— предотвращение физиологической послеродовой лактации;

— подавление установившейся послеродовой лактации;

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

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

Относится к болезням:

- Аменорея

Противопоказания:

— детский и подростковый возраст до 16 лет (безопасность и эффективность применения не установлены);

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

Достинекс следует назначать с *осторожностью* при следующих состояниях и/или заболеваниях:

— артериальная гипертензия, развившаяся на фоне беременности, например, преэклампсия или послеродовая артериальная гипертензия (Достинекс назначается только в тех случаях, когда потенциальная польза от применения препарата значительно превышает возможный риск);

— тяжелые сердечно-сосудистые заболевания, синдром Рейно;

— пептическая язва, желудочно-кишечные кровотечения;

— тяжелая печеночная недостаточность (рекомендуется применение более низких доз);

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

— симптомы нарушения функции сердца и дыхания вследствие фиброзных изменений или наличие таких состояний в анамнезе;

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

Способ применения и дозы:

Достинекс следует принимать внутрь, желательно во время приема пищи.

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

Для *подавления установившейся лактации* назначают по 0.25 мг (1/2 таб.) 2 раза/сут в течение 2 дней (общая доза равна 1 мг). С целью снижения риска развития ортостатической гипотензии у лактирующих пациенток однократная доза Достинекса не должна превышать 0.25 мг.

Для *лечения нарушений, связанных с гиперпролактинемией*, препарат назначают в дозе 0.5 мг в неделю в 1 (1 таб.) или 2 приема (по 1/2 таб., например, в понедельник и в четверг). Повышение недельной дозы следует проводить постепенно - на 0.5 мг с интервалом в 1 мес до достижения оптимального терапевтического эффекта. Средняя терапевтическая доза составляет 1 мг в неделю, но может колебаться в диапазоне от 0.25 мг до 2 мг в неделю. Максимальная доза для пациенток с гиперпролактинемией составляет 4.5 мг в неделю.

В зависимости от переносимости недельную дозу 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 г в неделю.

У пациентов с повышенной чувствительностью к допаминергическим препаратам вероятность развития побочных явлений можно уменьшить, начав терапию Достинексом в более низкой дозе (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 постепенным ее увеличением, например, на 0.25 мг в неделю каждые 2 недели.

Побочное действие:

В ходе клинических исследований с применением Достинекса для предотвращения физиологической лактации (1 мг однократно) и для подавления лактации (по 0.25 мг каждые 12 ч в течение 2 дней) побочные действия отмечались приблизительно у 14% женщин. При применении Достинекса в течение 6 месяцев в дозе 1-2 мг в неделю, разделенной на 2 приема, для лечения нарушений, связанных с гиперпролактинемией, частота побочных явлений составляла 68%. Побочные явления возникали, в основном, в течение первых 2 недель терапии и в большинстве случаев исчезали по мере продолжения терапии или через несколько дней после отмены Достинекса. Побочные явления обычно были преходящими, по степени тяжести - слабо или умеренно выражены и носили дозозависимый характер. По крайней мере, однократно, в ходе терапии тяжелые побочные явления отмечались у 14% пациентов; из-за побочных действий лечение было прекращено примерно у 3% пациентов.

Наиболее частые побочные действия представлены ниже:

Со стороны сердечно-сосудистой системы: сердцебиение; редко - ортостатическая гипотензия (при длительном применении препарат оказывает гипотензивное действие); 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 пищеварительной системы: тошнота, рвота, боли в эпигастральной области, боль в животе, запор, гастрит, диспепсия.

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

Прочие: мастодиния, носовое кровотечение, приливы крови к коже лица, транзиторная гемианопсия, спазмы сосудов

пальцев, судороги мышц нижних конечностей (как и другие производные спорыньи, Достинекс может оказывать сосудосуживающее действие).

При длительной терапии с применением Достинекса отклонение от нормы стандартных лабораторных показателей наблюдалось редко; у женщин с аменореей наблюдалось снижение уровня гемоглобина в течение первых нескольких месяцев после восстановления менструации.

В постмаркетинговом исследовании зарегистрированы следующие побочные реакции, связанные с применением каберголина: алопеция, повышение активности КФК в крови, мании, диспноэ, отеки, фиброз, нарушения функции печени, отклонения показателей функции печени, реакции повышенной чувствительности, сыпь, респираторные нарушения, дыхательная недостаточность, вальвулопатия.

Передозировка:

Симптомы: тошнота, рвота, диспептические расстройства, ортостатическая гипотензия, спутанность сознания/психоз или галлюцинации.

Лечение: следует проводить мероприятия, направленные на выведение препарата (промывание желудка) и на поддержание АД. Рекомендуется назначение антагонистов допамина.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Поскольку контролируемых клинических исследований с применением Достинекса у беременных женщин не проводилось, применение препарата при беременности возможно только в том случае, когда предполагаемая польза для матери превосходит потенциальный риск для плода.

Если беременность наступила на фоне лечения Достинексом, следует рассмотреть целесообразность отмены препарата, также учитывая соотношение польза/риск.

Наступления беременности следует избегать в течение, как минимум, 1 месяца после прекращения применения препарата, учитывая его длительный период полувыведения и наличие ограниченных данных о воздействии на плод. По имеющимся данным применение Достинекса 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.

Сведений о выделении препарата с грудным молоком нет, однако при отсутствии эффекта применения Достинекса для предотвращения или подавления лактации следует отказаться от грудного вскармливания. При нарушениях, связанных с гиперпролактинемией, Достинекс не следует назначать матерям, не желающим прекращать лактацию.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Отсутствует информация о взаимодействии каберголина и других алкалоидов спорыньи; тем не менее, одновременное использование этих лекарственных средств во время длительной терапии Достинексом не рекомендуется.

Поскольку Достинекс оказывает терапевтическое действие путем прямой стимуляции допаминовых рецепторов, препарат нельзя назначать одновременно с препаратами, действующими как антагонисты допамина (например, фенотиазины, бутирофеноны, тиоксантены, метоклопрамид), т.к. последние могут ослаблять пролактинснижающее действие Достинекса.

Как и другие производные спорыньи, Достинекс нельзя применять одновременно с антибиотиками группы макролидов (например, с эритромицином), поскольку это может привести к увеличению системной биодоступности каберголина.

Особые указания и меры предосторожности:

Перед назначением Достинекса с целью лечения нарушений, связанных с гиперпролактинемией, необходимо провести полное исследование функции гипофиза.

При увеличении дозы пациенты должны находиться под наблюдением врача с целью установления наименьшей эффективной дозы, обеспечивающей терапевтический эффект. После того, как будет подобран эффективный режим дозирования, рекомендуется проводить регулярное (1 раз в месяц) определение концентрации пролактина в сыворотке крови. Нормализация уровня пролактина обычно наблюдается в течение 2-4 недель лечения.

После отмены Достинекса обычно наблюдается рецидив гиперпролактинемии, однако у некоторых пациенток

отмечается стойкое подавление уровня пролактина в течение нескольких месяцев. У большинства женщин овуляторные циклы сохраняются в течение не менее 6 месяцев после отмены Достинекса.

Достинекс 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. Женщинам, желающим избежать беременности, следует использовать барьерные методы контрацепции во время лечения Достинексом, а также после отмены препарата до повторения ановуляции. Женщины, у которых наступила беременность, должны находиться под наблюдением врача для своевременного выявления симптомов увеличения гипофиза, поскольку во время беременности возможно увеличение размеров уже существовавших опухолей гипофиза.

Достинекс следует назначать в более низких дозах пациентам с тяжелой печеночной недостаточностью (класс С по шкале Чайлд-Пью), которым показана длительная терапия препаратом. При однократном применении таким пациентам дозы 1 мг отмечалось увеличение AUC по сравнению со здоровыми добровольцами и пациентами с менее выраженной печеночной недостаточностью.

Как и при применении других производных спорыньи, после длительного приема каберголина у пациентов наблюдались плевральный выпот/плевральный фиброз и вальвулопатия. В некоторых случаях пациенты получали предшествующую терапию эрготининовыми агонистами допамина. Поэтому Достинекс следует применять с осторожностью пациентам с имеющимися признаками и/или клиническими симптомами нарушения функции сердца или с такими состояниями в анамнезе. После прекращения приема Достинекса у пациентов с диагнозом плевральный выпот/плевральный фиброз и вальвулопатия отмечалось улучшение симптомов.

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

Исследований по применению препарата у пациентов пожилого возраста с нарушениями, связанными с гиперпролактинемией, не проводилось.

Использование в педиатрии

Безопасность и эффективность препарата у **детей младше 16 лет** не установлена.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Пациенты, принимающие Достинекс, у которых наблюдается сонливость, должны быть предупреждены о том, что им рекомендуется воздержаться от вождения автомобиля и от выполнения работы (например, с механизмами), при которой пониженное внимание могло бы создать для них или окружающих риск серьезных повреждений или смерти.

При нарушениях функции печени

С *осторожностью* применяют препарат при тяжелой печеночной недостаточности (рекомендуются более низкие дозы).

Применение в детском возрасте

Противопоказание: детский и подростковый возраст до 16 лет (безопасность и эффективность применения не установлены).

Условия хранения:

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/Dostineks