Каберголин



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:

Форма выпуска, описание и состав

Таблетки белого или почти белого цвета, плоскоцилиндрические, продолговатые; с фаской с двух сторон и риской с одной стороны.

	1 таб.
каберголин	500 мкг

Вспомогательные вещества: лактоза безводная - 75.9 мг, лейцин - 3.6 мг.

2 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
2 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
2 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
2 шт. - упаковки ячейковые контурные (4) - пачки картонные.
8 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
8 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
8 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
8 шт. - упаковки ячейковые контурные (4) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (4) - пачки картонные.
2 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.
8 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Интермедианты

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Производное алкалоида спорыньи эрголина, агонист допаминовых D_2-рецепторов. Стимулируя указанные рецепторы гипофиза, вызывает выраженное и длительное угнетение секреции гормона передней доли - пролактина. Оказывает терапевтическое действие при гиперпролактинемии, уменьшая выраженность таких ее проявлений как нарушения менструального цикла (олигоменорея, аменорея), бесплодие, галакторея; импотенция, снижение либидо. Предотвращает и подавляет физиологическую лактацию.

В дозах более высоких, чем требуются для подавления секреции пролактина, каберголин вызывает центральный допаминергический эффект, обусловленный стимуляцией допаминовых D_2-рецепторов. Действие носит дозозависимый характер. Каберголин уменьшает суточную двигательную флуктуацию у пациентов с болезнью Паркинсона, которые получают лечение комбинацией леводопа/карбидопа. Каберголин обладает избирательной активностью без влияния на базальную секрецию других гормонов гипофиза и кортизола.

К фармакодинамическим эффектам каберголина, не связанным с терапевтической активностью, относится только снижение АД. При однократном приеме максимальный гипотензивный эффект отмечается в течение первых 6 ч и является дозозависимым.

Фармакокинетика

После приема внутрь каберголин быстро всасывается из ЖКТ. C_{max} в плазме крови достигается через 0.5-4 ч. Пища не оказывает влияния на всасывание или распределение каберголина. Фармакокинетика имеет линейный характер до дозы 7 мг/сут.

Связывание каберголина (при концентрации 0.1-10 нг/мл) с белками плазмы составляет 41-42%.

В моче обнаружены метаболиты каберголина: 6-аллил-8β-карбокси-эрголин в количестве 4-6% от принятой дозы, а также три других метаболита с общим содержанием менее 3%. Все метаболиты в значительно меньшей степени (по сравнению с каберголином) ингибируют секрецию пролактина. Каберголин обладает длительным $T_{1/2}$. $T_{1/2}$ у здоровых добровольцев составляет 63-68 ч, $T_{1/2}$ у пациенток с гиперпролактинемией составляет 79-115 ч. При таком $T_{1/2}$ равновесное состояние достигается через 4 недели. В моче и кале обнаружено, соответственно, 18% и 72% от принятой дозы. Содержание неизмененного каберголина в моче составляет 2-3%.

Показания к применению:

Гиперпролактинемия (макро- и микроаденомы гипофиза, идиопатическая гиперпролактинемия). Нарушения, связанные с гиперпролактинемией (включая такие функциональные расстройства как аменорея, олигоменорея, ановуляция, галакторея). Предотвращение или подавление физиологической лактации в послеродовом периоде.

Для лечения заболеваний и симптомов болезни Паркинсона, в качестве монотерапии у пациентов с впервые выявленными симптомами или в качестве комбинированной терапии, когда применение других препаратов не эффективно.

Относится к болезням:

- Аменорея
- Болезнь Паркинсона

Противопоказания:

Выраженные нарушения функции печени, беременность, преэклампсия, эклампсия, психоз в анамнезе, риск послеродового психоза, послеродовая гипертензия, период грудного вскармливания, неконтролируемая артериальная гипертензия, симптомы нарушения функции сердца и дыхания вследствие фиброзных изменений или наличие таких симптомов в анамнезе; поражение клапанов сердца вследствие длительной терапии каберголином, подтвержденное эхокардиографией; детский и подростковый возраст до 18 лет; повышенная чувствительность к каберголину и алкалоидам спорыньи.

Способ применения и дозы:

Предназначен для приема внутрь. Для предотвращения лактации - однократно в первый день после родов в дозе 1 мг. Для подавления уже имеющейся лактации - в течение двух дней по 250 мкг каждые 12 ч. При лечении гиперпролактинемии дозы подбирают индивидуально. Начальная доза обычно - 500 мкг в неделю, как правило, в один прием (иногда в виде двух разделенных доз). В дальнейшем при необходимости дозу постепенно повышают - на 500 мкг в неделю с интервалом 1 мес. Обычно терапевтическая доза составляет 1-2 мг в неделю, в ряде случаев она может быть повышена до 4.5 мг в неделю. Если недельная доза превышает 1 мг, то ее рекомендуется разделить на 2 приема. В некоторых случаях эффективна доза 250-500 мкг в неделю.

При паркинсонизме доза устанавливается индивидуально, в зависимости от схемы лечения, и составляет 0.5-3 мг 1 раз/сут.

Побочное действие:

Со стороны нервной системы: очень часто — головокружение, дискинезия; часто - галлюцинации, нарушения сна, спутанность сознания, головная боль, сонливость, депрессия; нечасто - гиперкинезия, бред, психотическое расстройство, внезапное наступление сна, обморок; редко - гемионопсия. Возможны избыточная сонливость в дневное время и эпизоды внезапного засыпания, особенно у пациентов с болезнью Паркинсона.

Со стороны пищеварительной системы: очень часто - тошнота; часто - запоры, диспепсия, гастрит, рвота; нечасто - нарушения функции печени, дискинезия желчевыводящих путей.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: очень часто - периферические отеки, сердечная вальвулопатия (в т.ч. регургитация) и связанные с ней нарушения (перикардит и перикардиальный выпот); часто - постуральная гипотензия, стенокардия, сердцебиение, покраснение лица; нечасто - спазм сосудов пальцев; редко - эритромелалгия.

Со стороны системы кроветворения: часто - снижение гемоглобина, гематокрита и/или эритроцитов (>15% по сравнению с исходным уровнем).

Со стороны половой системы: часто - повышение либидо.

Со стороны дыхательной системы: часто - одышка; нечасто - нарушения дыхания, дыхательная недостаточность; редко - плеврит, легочный фиброз, кровотечение из носа.

Дерматологические реакции: нечасто - сыпь, алопеция.

Со стороны костно-мышечной системы: нечасто - судороги икроножных мышц, увеличение КФК в крови.

Общие реакции: часто - астения, усталость, боль в груди, боли в пояснице; нечасто - реакции гиперчувствительности; редко - отеки, усталость.

Прочие: редко - фиброз, судороги в пальцах.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан при беременности и в период грудного вскармливания.

Каберголин восстанавливает овуляцию и фертильность у женщин с гиперпролактинемическим гипогонадизмом. Поскольку беременность может наступить до возобновления менструаций, тесты на беременность рекомендуется проводить в период аменореи, а после восстановления менструального цикла - во всех случаях их задержки более чем на 3 дня. Женщинам, которые не планируют беременность, рекомендуется применять негормональные средства контрацепции во время лечения каберголином и после его окончания. Женщинам, планирующим беременность, рекомендуется зачать не ранее чем через 1 месяц после отмены каберголина.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Не рекомендуется применять одновременно с антибиотиками макролидами (в т.ч. с эритромицином), т.к. увеличивается биодоступность каберголина и выраженность его побочных эффектов.

Механизм действия каберголина связан с прямой стимуляцией допаминовых рецепторов, поэтому его не следует применять в комбинации с антагонистами допаминовых рецепторов (фенотиазины, бутирофеноны, тиоксантены, метоклопрамид).

Не рекомендуется комбинация с алкалоидами спорыньи и их производными.

Учитывая фармакодинамику каберголина (гипотензивное действие), необходимо принимать во внимание взаимодействие с лекарственными средствами, снижающими АД.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применяют у пациентов с сердечно-сосудистыми заболеваниями, синдромом Рейно, язвенной болезнью желудка и двенадцатиперстной кишки, желудочно-кишечным кровотечением, нарушением функции почек,

тяжелой печеночной недостаточностью (рекомендуется применение в более низких дозах), серьезными психическими заболеваниями в анамнезе, а также на фоне лечения гипотензивными средствами.

Каберголин может вызывать симптоматическую артериальную гипотензию, особенно при совместном приеме с лекарственными средствами, снижающими АД. Рекомендуется регулярно измерять АД в первые 3-4 дня после начала лечения.

При длительном применении каберголина и других производных спорыньи, проявляющих активность по отношению к серотониновым 5-HT_{2B}-рецепторам, повышается риск развития фиброзных и серозно-воспалительных заболеваний, таких как: экссудативный плеврит, плевральный фиброз, легочный фиброз, перикардит, поражение одного и более клапанов сердца (аортальный, митральный, трехстворчатый), ретроперитонеальный фиброз. Отмена каберголина в случае развития указанной патологии приводила к улучшению признаков и симптомов.

Перед началом длительной терапии каберголином все пациенты должны пройти полное обследование для выявления поражения клапанов сердца, определения функционального состояния легких и почек для предотвращения ухудшения течения сопутствующих заболеваний.

При появлении новых клинических симптомов со стороны дыхательной системы рекомендуется рентгеноскопия легких. У пациентов с плевральным выпотом/фиброзом отмечалось повышение СОЭ, в связи с этим при повышенной СОЭ без явных клинических признаков также следует провести рентгенологическое обследование.

При длительной терапии каберголином возможно постепенное развитие фиброзных нарушений, поэтому в ходе лечения следует контролировать появление таких симптомов, как одышка, укорочение дыхания, кашель, боль в грудной клетке, боль в пояснице, отек нижних конечностей, признаки наличия ретроперитонеального фиброза, сердечная недостаточность.

После начала терапии каберголином с целью профилактики фиброзных нарушений следует контролировать состояние клапанов сердца и провести ЭКГ обследование в течение 3-6 мес. Далее частота контроля ЭКГ устанавливается врачом индивидуально для каждого пациента, но не реже чем 1 раз в 6-12 мес. В случае появления или ухудшения клапанной регургитации, сужения просвета или утолщения стенки клапана терапию каберголином следует прекратить.

Потребность пациента в других видах клинического обследования устанавливается врачом на индивидуальной основе.

Гиперпролактинемия в сочетании с аменореей и бесплодием могут быть связаны с опухолями гипофиза, поэтому до начала лечения каберголином необходимо выяснить причину гиперпролактинемии.

Рекомендуется проверять содержание пролактина в сыворотке крови каждый месяц, т.к. после достижения эффективного терапевтического режима нормальный уровень пролактина сохраняется в течение 2-4 недель. После отмены каберголина гиперпролактинемия обычно возникает вновь. Однако у некоторых пациентов наблюдается стойкое снижение концентрации пролактина в течение нескольких месяцев.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Каберголин снижает АД, что может нарушать скорость реакции у некоторых пациентов. Это необходимо учитывать пациентам, которые занимаются вождением транспортных средства и другой деятельностью, требующей высокой концентрации внимания и скорости психомоторных реакций.

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