Инструкция по применению
Достинекс Таблетки 0,5 мг 2 шт

Характеристики



Форма выпуска: Таблетки
Страна: Италия
Производитель: Пфайзер
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Каберголин
Количество в упаковке: 2
Дозировка действующего вещества: 0.5 мг
Срок годности: 24.0

Действующее вещество

Каберголин

Состав

1 таблетка содержит: Активные вещества: каберголин - 500 мкг.;Вспомогательные вещества: лактоза - 75.9 мг, лейцин - 3.6 мг.

Форма выпуска

Таблетки

Фармакокинетика

Всасывание и распределение;После приема внутрь каберголин быстро всасывается из ЖКТ. Cmax в плазме достигается через 0.5-4 ч. Связывание с белками плазмы крови составляет 41-42%. Css достигается через 4 недели терапии вследствие длительного T1/2.;Прием пищи не влияет на всасывание и распределение каберголина.; 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;T1/2, оцениваемый по скорости выведения почками составляет 63-68 ч у здоровых добровольцев и 79-115 ч у больных с гиперпролактинемией.;Через 10 дней после приема препарата в моче и кале обнаруживаются соответственно 18% и 72% от принятой дозы, причем доля неизмененного каберголина в моче составляет 2-3%.

Показания

— 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.

Способ применения и дозы

Принимают внутрь, во время еды.;Предотвращение лактации: 1 мг (2 таб.) однократно в первый день после родов.;Подавление установившейся лактации: 250 мкг (1/2 таб.) 2 раза/сут через каждые 12 ч в течение 2 дней (общая доза равна 1 мг). С целью снижения риска развития ортостатической гипотензии у кормящих грудью матерей однократная доза Достинекса не должна превышать 250 мкг.;Лечение нарушений, связанных с гиперпролактинемией: рекомендуемая начальная доза составляет 500 мкг 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 500 мкг с интервалом в 1 мес до достижения оптимального терапевтического эффекта. Терапевтическая доза, как правило, составляет 1 мг в неделю, но может колебаться в диапазоне от 250 мкг 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 мг в неделю.;У пациентов с повышенной чувствительностью к допаминергическим препаратам вероятность развития побочных явлений можно уменьшить, начав терапию Достинекс; в более низкой дозе (по 250 мкг 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 250 мкг в неделю каждые 2 недели.

Противопоказания

— повышенная чувствительность к каберголину или другим компонентам препарата, а также к любым алкалоидам спорыньи; — нарушения функции сердца и дыхания вследствие фиброзных изменений или наличие таких состояний в анамнезе; — при длительной терапии: анатомические признаки патологии клапанного аппарата сердца (такие как утолщение створки клапана, сужение просвета клапана, смешанная патология сужение и стеноз клапана), подтвержденные эхокардиографическим исследованием (ЭхоКГ), проведенным до начала терапии; — непереносимость лактозы, дефицит лактазы, глюкозо-галактозная мальабсорбция.;— детский и подростковый возраст до 16 лет (безопасность и эффективность применения не установлены).;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); — одновременное применение с препаратами, оказывающими гипотензивное действие (из-за риска развития ортостатической гипотензии).

Применение при беременности и кормлении грудью

Поскольку контролируемых клинических исследований с применением препарата Достинекс; у беременных женщин не проводилось, назначение препарата при беременности возможно только в случаях крайней необходимости, когда ожидаемая польза для матери превосходит потенциальный риск для плода.;Если беременность наступила на фоне лечения препаратом Достинекс;, следует рассмотреть целесообразность отмены препарата, также учитывая соотношение польза/риск.;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 препарата Достинекс; для предотвращения или подавления лактации следует отказаться от грудного вскармливания. При нарушениях, связанных с гиперпролактинемией, Достинекс; не следует назначать матерям, не желающим прекращать лактацию.

Побочные действия

В ходе клинических исследований с применением препарата Достинекс; для предотвращения физиологической лактации (1 мг однократно) и для подавления лактации (по 250 мкг каждые 12 ч в течение 2 дней) побочные реакции отмечались приблизительно у 14% женщин. При применении препарата Достинекс; в течение 6 месяцев в дозе 1-2 мг в неделю, разделенной на 2 приема, для лечения нарушений, связанных с гиперпролактинемией, частота побочных реакций составляла 68%. Побочные реакции возникали, в основном, в течение первых 2 недель терапии и в большинстве случаев исчезали по мере продолжения терапии или через несколько дней после отмены препарата Достинекс;. Побочные реакции 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 реакций лечение было прекращено примерно у 3% пациентов.;Наиболее частые побочные реакции 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 нервной системы: головокружение/вертиго, головная боль, повышенная утомляемость, сонливость, депрессия, астения, парестезии, обморок, нервозность, тревога, бессонница, нарушение концентрации внимания.;Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, боли в эпигастральной области, боль в животе, запор, гастрит, диспепсия, сухость слизистой оболочки полости рта, диарея, метеоризм, зубная боль, ощущение раздражения слизистой оболочки глотки.; 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), нарушение зрения, гриппоподобные симптомы, недомогание, периорбитальные и периферические отеки, анорексия, акне, кожный зуд, боль в суставах.;При длительной терапии с применением препарата Достинекс; 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, патологическое

пристрастие к азартным играм, гиперсексуальность. повышенное либидо, агрессивность, психотические расстройства, перикардит, приступы внезапного засыпания, снижение или увеличение массы тела, заложенность носа.

Передозировка

Симптомы (вероятнее, симптомы гиперстимуляции допаминовых рецепторов): тошнота, рвота, диспептические симптомы, ортостатическая артериальная гипотензия, спутанность сознания, психоз, галлюцинации.;Лечение: следует проводить мероприятия, направленные на выведение препарата (промывание желудка) и на поддержание АД. Рекомендуется назначение антагонистов допамина.

Взаимодействие с другими препаратами

Информация о взаимодействии каберголина и других алкалоидов спорыньи отсутствует, поэтому одновременное применение этих лекарственных средств во время длительной терапии препаратом Достинекс; не рекомендуется.;Поскольку каберголин оказывает терапевтическое действие путем прямой стимуляции допаминовых рецепторов, препарат нельзя назначать одновременно с препаратами, действующими как антагонисты допамина (в т.ч. фенотиазины, бутирофеноны, тиоксантены, метоклопрамид), т.к. они могут ослабить действие каберголина, направленное на снижение концентрации пролактина.;Как и другие производные спорыньи, каберголин нельзя применять одновременно с антибиотиками группы макролидов (например, с эритромицином), поскольку это может привести к увеличению системной биодоступности каберголина.

Особые указания

Перед назначением препарата Достинекс; с целью лечения нарушений, связанных с гиперпролактинемией, необходимо провести полное исследование функции гипофиза.;Кроме того, следует провести оценку состояния сердечно-сосудистой системы, включая ЭхоКГ с целью выявления нарушений функции клапанного аппарата, протекающих бессимптомно.;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 эрготониновыми агонистами дофамина. Поэтому Достинекс; не следует применять у пациентов с имеющимися признаками и/или клиническими симптомами нарушения функции сердца или дыхания, связанными с фиброзными изменениями или с такими состояниями в анамнезе. Следует отменить прием препарата в случае обнаружения признаков появления или ухудшения регургитации крови, сужения просвета клаланов или

утолщения створок клапанов.;Было установлено, что СОЭ возрастает при развитии плеврального выпота или фиброза. В случае обнаружения необъяснимого увеличения СОЭ рекомендуется выполнить рентгенографическое исследование грудной клетки. В постановке диагноза также может помочь исследование концентрации креатинина в плазме крови, оценка почечной функции. После прекращения приема препарата Достинекс; у пациентов с наличием плеврального выпота/плеврального фиброза или вальвулопатии отмечалось улучшение симптомов.;Неизвестно может ли каберголин ухудшать состояние пациентов с признаками регургитации крови. Каберголин не следует применять при выявлении фиброзных поражений клапанного аппарата сердца.;Фибротические нарушения могут развиваться бессимптомно. В связи с этим следует регулярно контролировать состояние пациентов, получающих длительную терапию каберголином и обращать особое внимание на следующие симптомы: -плевро-легочные нарушения: такие как одышка, затруднение дыхания, непроходящий кашель или боль в грудной клетке; -почечная недостаточность или обструкция сосудов мочеточников или органов брюшной полости, что может сопровождаться болью в боку или в области поясницы и отеками нижних конечностей, любые припухлости или болезненность при пальпации в области живота, что может свидетельствовать о развитии ретроперитонеального фиброза; -перикардиальный фиброз и фиброз створок клапанов сердца часто манифестируют сердечной недостаточностью. В связи с этим необходимо исключить фиброз створок клапанов сердца (и констриктивный перикардит) при появлении симптомов сердечной недостаточности.;Следует регулярно проводить мониторинг состояния пациента на предмет развития фибротических нарушений. Первый раз ЭхоКГ должна быть проведена через 3-6 месяцев после начала терапии. Затем данное исследование необходимо проводить в зависимости от клинической оценки состояния пациента, уделяя особое внимание симптомам, описанным выше, как минимум каждые 6-12 месяцев терапии.;Необходимость других методов мониторинга (например, физикальное обследование, включая аускультацию сердца, рентгенографию, компьютерную томографию) оценивается индивидуально для каждого пациента.;При увеличении дозы пациенты должны находиться под наблюдением врача с целью установления минимальной 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. Нормализация концентрации пролактина обычно наблюдается в течение 2-4 недель лечения.;После отмены препарата Достинекс; обычно наблюдается рецидив гиперпролактинемии, однако у некоторых пациенток отмечается стойкое подавление концентрации пролактина в течение нескольких месяцев. У большинства женщин овуляторные циклы сохраняются в течение не менее 6 месяцев после отмены препарата Достинекс;.;Достинекс; восстанавливает овуляцию

и фертильность у женщин с гиперпролактинемическим гипогонадизмом. Поскольку беременность может наступить до восстановления менструации, рекомендуется проводить тесты на беременность не реже 1 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 препаратом Достинекс;, 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 классификации Чайлд-Пью), которым показана длительная терапия препаратом. При однократном применении у таких пациентов препарата в дозе 1 мг отмечалось увеличение AUC по сравнению со здоровыми добровольцами и пациентами с менее выраженной печеночной недостаточностью.;Применение каберголина вызывает сонливость. У пациентов с болезнью Паркинсона применение агонистов допаминовых рецепторов может вызвать внезапное засыпание. В подобных случаях рекомендуется снизить дозу препарата Достинекс; 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 и подростков младше 16 лет не установлена.; Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами; Пациенты, принимающие препарат Достинекс;, должны воздержаться от управления транспортными средствами и механизмами и другой потенциально опасной деятельности, требующей концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Условия хранения

Беречь от детей