Инструкция по применению
Достинекс Таблетки 0,5 мг 8 шт

Характеристики



Форма выпуска: Таблетки
Страна: Италия
Производитель: Пфайзер
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Каберголин
Количество в упаковке: 8
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-8&#946,-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&reg, 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&reg, следует назначать с осторожностью при следующих состояниях и/или заболеваниях: артериальная гипертензия, развившаяся на фоне беременности, например, преэклампсия или послеродовая артериальная гипертензия (Достинекс&reg, 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&reg, 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&reg,, 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&reg, для предотвращения или подавления лактации следует отказаться от грудного вскармливания. При нарушениях, связанных с гиперпролактинемией, Достинекс&reg, не следует назначать матерям, не желающим прекращать лактацию.

Побочные действия

В ходе клинических исследований с применением препарата Достинекс&reg, 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&reg, 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&reg,. 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&reg, 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&reg, 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&reg, 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&reg, 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&reg, 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 клапанов 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&reg, 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&reg, 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&reg,. Достинекс&reg, 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 &mdash, 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&reg,, 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&reg, 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&reg, 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&reg,, 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