Инструкция по применению
Каберголин Таблетки 0,5 мг 8 шт



Характеристики

Форма выпуска: Таблетки
Страна: Россия
Производитель: МИР-ФАРМ
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Каберголин
Количество в упаковке: 8
Дозировка действующего вещества: 0,5 мг

Описание

Продолговатые плоскоцилиндрические таблетки белого или почти белого цвета, с фаской с двух сторон и риской с одной стороны.

Действующее вещество

Каберголин

Состав

Активное вещество: Каберголин 0,5 мг. Вспомогательные вещества: Лактоза безводная 75,9 мг, Лейцин 3,6 мг.

Форма выпуска

Таблетки

Фармакокинетика

Каберголин быстро всасывается из желудочно-кишечного тракта (ЖКТ). Максимальная концентрация в плазме достигается через 0,5-4 ч связывание с белками плазмы крови составляет 41-42%. Период полувыведения каберголина оцениваемый по скорости выведения почками составляет 63-68 ч у здоровых добровольцев и 79-115 ч у пациенток с гиперпролактинемией. Вследствие длительного периода полувыведения состояние равновесной концентрации достигается через 4 недели. Через 10 дней после приема препарата в моче п кале обнаруживаются соответственно около 18% и 72% от принятой дозы причем доля неизмененного препарата в моче составляет 2-3%. Основным продуктом метаболизма каберголина идентифицированным в моче является 6-аллил-8&beta,-карбокси-эрголин в концентрации до 4-6% от принятой дозы. Содержание в моче 3 дополнительных метаболитов не превышает 3% от принятой дозы. Установлено, что продукты метаболизма обладают значительно меньшим эффектом в отношении подавления секреции пролактина по сравнению с каберголином. Прием пищи не влияет на всасывание и распределение каберголина.

Показания

Предотвращение физиологической лактации после родов, подавление уже установившейся послеродовой лактации, лечение нарушений связанных с гиперпролактинемией включая аменорею олигоменорею ановуляцию галакторею, пролактинсекрстирующие аденомы гипофиза (микро - и макропролактиномы), идпоиатичсская гиперпролактинемия, синдром &quot,пустого&quot, турецкого седла в сочетании с гиперпролактинемией.

Способ применения и дозы

Внутрь во время еды. Предотвращение лактации: 1 мг однократно (2 таблетки по 0,5 мг) в течение первых 24 ч после родов. Подавление установившейся лактации: по 0,25 мг (1/2 таблетки) 2 раза в сутки через каждые 12 ч в течение двух дней (общая доза - 1 мг). С целью снижения риска ортостатической гииотензии у кормящих грудью матерей однократная доза каберголина не должна превышать 0,25 мг. Лечение нарушений связанных с гиперпролактинемией: рекомендуемая начальная доза составляет 05 мг в неделю в один прием (1 таблетка по 0,5 мг) или в два приема (по 1 /2 таблетки по 0,5 мг например в понедельник и четверг). Повышение недельной дозы должно проводиться постепенно — на 0,5 мг - с месячным интервалом до достижения оптимального терапевтического эффекта. Терапевтическая доза обычно составляет 1 мг в неделю, но может колебаться от 0,25 до 2 мг в неделю. Максимальная доза для пациенток с гиперпролактинемией не должна превышать 45 мг в неделю. В зависимости от переносимости недельную дозу можно принимать однократно или разделить на два и более приемов в неделю. Разделение недельной дозы па несколько приемов рекомендуется при назначении препарата в дозе более 1 мг в неделю. У пациентов с повышенной чувствительностью к дофаминергическим препаратам вероятность развития побочных явлений можно уменьшить начав терапию каберголином в более низкой дозе (например по 0,25 мг 1 раз в педелю) с последующим постепенным се увеличением до достижения терапевтической дозы. Для улучшения переносимости препарата при возникновении выраженных побочных явлений возможно временное снижение дозы с последующим постепенным ее увеличением (например увеличение на 0,25 мг в неделю каждые две недели). Пациенты с нарушениями функции печени и почек Информация представлена в разделах &quot,Противопоказания&quot, и &quot,Особые указания&quot,. Пожилые пациенты Учитывая показания к применению опыт применения каберголина у пожилых пациентов ограничен. Имеющиеся данные свидетельствуют об отсутствии специфического риска.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к каберголину или другим компонентам препарата а также любым алкалоидам спорыньи. Нарушения функции сердца и дыхания вследствие фиброзных изменений в легких перикарде клапанах сердца или забрюшинном пространстве 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 в начале терапии. Риск послеродового психоза. Период грудного вскармливания. Детский возраст до 16 лет (безопасность и эффективность препарата не установлены). Непереносимость лактозы дефицит лактазы глюкозо-галактозная мальабсорбция.

Применение при беременности и кормлении грудью

Поскольку контролируемых клинических исследовании с применением каберголина у беременных женщин не проводилось назначение препарата во время беременности возможно только в случаях крайней необходимости и тщательной оценкой соотношения ожидаемой пользы к возможному риску для женщины и плода. Если беременность наступила на фоне лечения каберголином прием препарата должен быть немедленно прекращен также с тщательной оценкой соотношения ожидаемой пользы к возможному риску для женщины и плода. По имеющимся данным применение каберголина в дозе 05-2 мг в неделю но поводу нарушений связанных с гиперпролактинемией не сопровождалось увеличением частоты выкидышей преждевременных родов многоплодной беременности и врожденных пороков развития. Сведений о выведении препарата с грудным молоком нет однако при отсутствии эффекта применения каберголина для предотвращения или подавления лактации матерям следует отказаться от грудного вскармливания. При нарушениях связанных с гиперпролактинемией каберголин противопоказан пациенткам планирующим грудное вскармливание.

Побочные действия

В ходе клинических исследований с применением Каберголина 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 каберголина в течение 6 мес в дозе 1-2 мг в неделю разделенной па 2 приема для лечения нарушении 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 каберголина. Побочные явления обычно были преходящими по степени тяжести — слабо или умеренно выраженными 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 (&gt,1 % и &lt,10 %) побочные действия представлены ниже. Со стороны сердечно-сосудистой системы: сердцебиение, стенокардия, при длительном применении каберголин обычно оказывает гипотензивное действие в некоторых случаях может иметь место ортостатическая артериальная гипотензия, возможно бессимптомное снижение АД в течение первых 3-4 дней после родов (сАД - более чем на 20 мм рт.ст. дАД - более чем 10 мм рт.ст.). Со стороны нервной системы: головокружение/вертиго тремор головная боль повышенная утомляемость сонливость депрессия астения парестезии обморок нервозность тревога бессонница нарушение концентрации внимания нарушение импульсного контроля (чрезмерная страсть к шопингу перееданию трате денег). Со стороны пищеварительной системы тошнота рвота боли в эпигастральной области боль в животе запор гастрит диспепсия сухость слизистой оболочки рта. диарея метеоризм зубная боль ощущение раздражения слизистой оболочки глотки. Со стороны дыхательной системы органов грудной метки и средостения: плеврит. Прочие: мастодиния дисменорея носовое кровотечение ринит &quot,приливы&quot, крови к коже лица транзиторная гемианопсия спазмы сосудов пальцев и судороги мышц нижних конечностей (как и другие производные спорыньи каберголин 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 каберголина отклонение от нормы стандартных лабораторных показателей отмечалось редко, у женщин с аменореей наблюдалось снижение содержания гемоглобина в течение первых нескольких месяцев после восстановления менструации. В постмаркетинговом исследовании зарегистрированы также следующие побочные действия связанные с приемом каберголина: алопеция повышение активности креатинфосфокиназы в крови мании диспноэ фиброз нарушения функции печени и 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 Тошнота рвота диспепсические расстройства ортостатическая гипотензия спутанность сознания психоз галлюцинации. Лечение Проведение вспомогательных мероприятий направленных на выведение невсосавшегося препарата (промывание желудка) и при необходимости поддержание АД. Возможно назначение антагонистов дофамина.

Взаимодействие с другими препаратами

Информация о взаимодействии каберголина и других алкалоидов спорыньи отсутствует поэтому одновременное применение этих лекарственных средств во время длительной терапии каберголином не рекомендуется. Поскольку каберголин оказывает терапевтическое действие путем прямой стимуляции дофаминовых рецепторов его нельзя назначать одновременно с препаратами действующими как антагонисты дофамина (фенотиазины бутирофеноны тиоксантены метоклопрамид и др.) т.к. они могут ослабить действие каберголина направленное на снижение концентрации пролактина. Как и другие производные спорыньи каберголин нельзя применять одновременно с антибиотиками-макролидами (например эритромицином) т.к. это может привести к увеличению системной биодоступности каберголина.

Особые указания

Перед назначением каберголина с целью лечения нарушений связанных с гиперпролактинемией необходимо провести полное обследование гипофиза. Кроме этого 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 каберголин 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 регургитацин крови сужения просвета клапанов или утолщения створок клапанов (см. раздел &quot,Противопоказания&quot,). Выло установлено, что скорость оседания эритроцитов возрастает при развитии плеврального выпота или фиброза. В случае обнаружения необъяснимого увеличения скорости оседания эритроцитов 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 каберголин 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 (см. раздел &quot,Противопоказания&quot,). 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 которые могут сопровождаться болью в боку или в области поясницы и отеками нижних конечностей любые припухлости или болезненность при дотрагивании в области живота ч то 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 (в 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 мес 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 наименьшей эффективной дозы обеспечивающей терапевтический эффект. После того как будет подобран эффективный режим дозирования рекомендуется проводить регулярное (1 раз в мес.) определение концентрации пролактина в плазме крови. Нормализация концентрации пролактина обычно наблюдается в течение 2-4 недель лечения. После отмены препарата каберголин обычно наблюдается рецидив гиперпролактинемии однако у некоторых пациенток отмечается стойкое снижение концентрации пролактина в течение нескольких месяцев. У большинства женщин овуляторные циклы сохраняются в течение не менее 6 мес. после отмены препарата каберголин. Каберголин 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 препаратом каберголин, а также после отмены препарата до повторения ановуляцни. Женщины у которых наступила беременность должны находиться иод наблюдением врача для своевременного выявления симптомов увеличения гипофиза поскольку во время беременности возможно увеличение размеров уже существовавших опухолей гипофиза. Каберголин 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 таким пациентам дозы 1 мг отмечалось увеличение AUC (площадь под кривой &quot, концентрация-время&quot,) по сравнению со здоровыми добровольцами и пациентами с менее выраженной печеночной Недостаточностью. Применение каберголина вызывает сонливость. У пациентов с болезнью Паркинсона применение агонистов дофаминовых рецепторов может вызвать внезапное засыпание. В подобных случаях рекомендуется снизить дозу препарата каберголин или прекратить терапию. Исследований по применению препарата у пациентов пожилого возраста с нарушениями связанными с гиперпролактинемией не проводилось. Безопасность и эффективность препарата у детей младше 16 лет не установлены. Влияние на способность управлять трансп. ср. и мех.: Пациенты принимающие препарат каберголин должны воздержаться от управления транспортными средствами и механизмами и другой потенциально опасной деятельности требующей концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Условия хранения

В защищенном от света месте при температуре не выше 25 С. Хранить в недоступном для детей месте.