

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**

Бромокриптин, 2,5 мг, таблетки

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: бромокриптин.

Каждая таблетка содержит бромокриптин (в виде мезилата) - 2,87 мг, что соответствует бромокриптину – 2,50 мг.

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: лактозы моногидрат (сахар молочный) (см. раздел 4.3).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки.

Круглые плоскоцилиндрические таблетки с риской и фаской белого или почти белого цвета.

Таблетку можно разделить на две равные дозы.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ**4.1. Показания к применению**

Акромегалия: в качестве дополнительного лекарственного средства, в особых случаях, как альтернатива хирургическому лечению или лучевой терапии.

Пролактиномы:

- консервативное лечение пролактинсекретирующих микро- и макроаденом гипофиза;
- предоперационная подготовка для уменьшения объема опухоли и облегчения ее удаления;
- послеоперационное лечение, если концентрация пролактина в плазме крови остается повышенной.

Подавление лактации по медицинским показаниям:

- предотвращение или подавление лактации в послеродовом периоде (например, при интранатальной гибели плода, мертворождении, ВИЧ-инфекции у матери), в том числе при начальной стадии послеродового мастита;
- предотвращение лактации после прерывания беременности.

Нарушения менструального цикла и бесплодие у женщин:

- ✓ пролактинзависимые заболевания и состояния, сопровождающиеся или не сопровождающиеся гиперпролактинемией:
- аменорея (сопровожающаяся или не сопровождающаяся гиперпролактинемией);
- недостаточность лютеиновой фазы;
- гиперпролактинемические состояния, вызванные лекарственными средствами (например, некоторыми психотропными или гипотензивными препаратами);
- ✓ женское бесплодие, не обусловленное гиперпролактинемией:
- синдром поликистозных яичников;
- ановуляторные циклы (в дополнение к применению антиэстрогенных средств, например, к кломифену).

Болезнь Паркинсона: все стадии идиопатической болезни Паркинсона и постэнцефалического паркинсонизма – в монотерапии или в комбинации с другими противопаркинсоническими препаратами.

Гиперпролактинемия у мужчин: пролактинзависимый гипогонадизм (олигоспермия, утрата либидо, импотенция).

4.2. Режим дозирования и способ применения

Как правило, лечение начинается с приема небольшой дозы, которую затем постепенно повышают до достижения оптимального эффекта.

Максимальная суточная доза - 30 мг.

Режим дозирования

Акромегалия

Начальная доза составляет по 1/2 таблетки 2,5 мг (1,25 мг) 2-3 раза в сутки, в дальнейшем, в зависимости от клинического эффекта и переносимости, суточную дозу препарата постепенно увеличивают до 10-20 мг (4-8 таблеток).

Максимальная суточная доза у детей и подростков в возрасте от 7 до 18 лет составляет 10 мг.

Пролактиномы

По 1/2 таблетки 2,5 мг (1,25 мг) 2-3 раза в сутки с постепенным увеличением и подбором дозы, необходимой для адекватного снижения концентрации пролактина в плазме крови. Максимальная рекомендуемая доза для детей и подростков в возрасте 7-12 лет составляет 5 мг/сутки, в возрасте 13-18 лет - 10 мг/сутки.

Подавление лактации по медицинским показаниям

В первый день применяют по 1/2 таблетки 2,5 мг (1,25 мг) 2 раза (во время приема пищи за завтраком и ужином), затем в течение 14-ти дней - по 1 таблетке (2,5 мг) 2 раза в сутки. Лечение следует начинать через несколько часов после родов или аборта, но не ранее 4 часов - после стабилизации жизненно важных функций. Через 2-3 суток после отмены препарата иногда возникает незначительная секреция молока. Ее устраняют возобновлением приема препарата в той же дозе в течение еще одной недели.

Начинающийся послеродовой мастит

Применяют по той же схеме, что и при подавлении лактации. При необходимости возможно дополнительное применение антибиотиков.

Нарушения менструального цикла и бесплодие у женщин

По 1/2 таблетки 2,5 мг (1,25 мг) 2-3 раза в сутки; если эффект недостаточен, дозу препарата постепенно увеличивают до 5-7,5 мг (2-3 таблетки) в сутки до нормализации менструального цикла и/или восстановления овуляции. Для профилактики рецидивов лечение можно продолжать в течение нескольких менструальных циклов.

Болезнь Паркинсона

Лечение начинают низкими дозами, которые медленно повышают до достижения максимального терапевтического эффекта. Обычно пациент принимает начальную дозу препарата (1,25 мг, т.е. 1/2 таблетки 2,5 мг) перед сном, в течение 1 недели. Затем дозу препарата Бромокриптин следует медленно повышать до достижения минимальной эффективной дозы для каждого пациента. Суточную дозу следует повышать на 2,5 мг с интервалом в 1 неделю. Суточную дозу делят на 2-3 приема. Адекватный терапевтический результат можно достичь в течение 6-8 недель лечения. Если этого не происходит, суточную дозу можно повышать далее - каждую неделю на 2,5 мг/сутки.

Максимальная суточная доза бромокриптина при монотерапии или в составе комбинированной терапии не должна превышать 30 мг. Длительная терапия высокими дозами бромокриптина более 20 мг/сут в течение 6 месяцев может привести к плевропульмональным фиброзным изменениям.

Если при подборе дозы препарата Бромокриптин отмечается развитие нежелательных реакций, то суточную дозу необходимо временно снизить и поддерживать на таком низком уровне, по крайней мере, 1 неделю. При уменьшении нежелательных реакций суточная доза препарата может быть вновь повышена.

У пациентов с двигательными нарушениями на фоне применения леводопы, рекомендуется до начала терапии препаратом Бромокриптин снизить дозу леводопы.

После достижения удовлетворительного клинического эффекта при лечении препаратом Бромокриптин можно продолжать дальнейшее постепенное снижение дозы леводопы.

У некоторых пациентов, принимающих бромокриптин, возможна полная отмена леводопы.

Гиперпролактинемия у мужчин

По 1/2 таблетки (1,25 мг) 2-3 раза в сутки, постепенно увеличивая дозу на 1,25 мг до 5-10 мг (2 - 4 таблетки) с интервалом 2-3 недели.

Особые группы пациентов

Пациенты пожилого возраста

Учитывая высокую частоту снижения функции печени, почек или сердца; наличие сопутствующих заболеваний и применение сопутствующей лекарственной терапии, применять препарат Бромокриптин у пациентов пожилого возраста следует с осторожностью. Начинать и проводить терапию препаратом необходимо в наименьшей эффективной дозе.

Пациенты с нарушением функции почек

Исследования эффективности и безопасности бромокриптина у пациентов с почечной недостаточностью не проводились. Поскольку бромокриптин и его метаболиты почти полностью выводятся через кишечник, коррекции его дозы у пациентов с почечной недостаточностью не требуется.

Пациенты с нарушением функции печени

Исследования эффективности и безопасности бромокриптина у пациентов с печеночной недостаточностью не проводились. Поскольку выведение бромокриптина при печеночной недостаточности замедляется, может потребоваться коррекция дозы. При печеночной недостаточности тяжелой степени применение бромокриптина противопоказано.

Дети

Безопасность и эффективность у детей до 7 лет не изучалась, поэтому применение препарата Бромокриптин в этой возрастной группе противопоказано (см. раздел 4.3).

Способ применения

Внутрь. Препарат Бромокриптин следует всегда принимать во время приема пищи.

4.3. Противопоказания

- гиперчувствительность к бромокриптину или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1, или к другим алкалоидам спорыньи;
- неконтролируемая артериальная гипертензия;
- артериальная гипертензия во время беременности и в послеродовом периоде;
- гестозы второй половины беременности (в том числе преэклампсия, эклампсия);

- послеродовой период у женщин с тяжелыми сердечно-сосудистыми заболеваниями в анамнезе;
- ишемическая болезнь сердца и другие тяжелые заболевания сердечно-сосудистой системы;
- цереброваскулярные заболевания в анамнезе;
- облитерирующий эндартериит; синдром Рейно; височный артериит;
- язвенные заболевания желудочно-кишечного тракта и желудочно-кишечные кровотечения;
- печеночная недостаточность тяжелой степени;
- сепсис;
- тяжелые психические расстройства (в том числе в анамнезе);
- злоупотребление табакокурением;
- одновременное применение с метилэргометрином и другими алкалоидами спорыньи, умеренными или мощными ингибиторами системы цитохрома P450 (например, итраконазолом, вориконазолом, кларитромицином);
- детский возраст до 7 лет (эффективность и безопасность бромокриптина у детей младше 7 лет не подтверждена);
- редкие наследственные формы непереносимости лактозы, дефицит лактазы, глюкозо-галактозная мальабсорбция (т.к. в составе препарата содержится лактоза).

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

С осторожностью

- применение у детей старше 7 лет и подростков моложе 18 лет;
- применение у пациентов старше 65 лет;
- у пациентов с сердечно-сосудистыми заболеваниями (например, с артериальной гипертензией, аритмиями, наличием инфаркта миокарда в анамнезе);
- болезнь Паркинсона (при длительном лечении высокими дозами препарата);
- нарушение функции печени;
- тяжелая почечная недостаточность;
- послеродовой период;
- беременность (у пациенток с аденомой гипофиза).

Особую осторожность следует соблюдать при применении препарата Бромокриптин в послеродовом периоде у пациенток с артериальной гипертензией, принимавших недавно

сосудосуживающие препараты (симпатомиметики или алкалоиды спорыньи, например, эргометрин или метилэргометрин).

Особые указания

В период терапии бромокриптином пациенту необходимо контролировать АД, особенно в начале лечения и через определенные промежутки времени. В случае повышения АД, появления вазоспастических симптомов или симптомов тромбоза, тяжелой прогрессирующей или постоянной головной боли (с или без нарушения зрения) или других нарушений со стороны нервной системы следует немедленно прекратить прием препарата и обратиться к врачу.

В первые дни приема препарата может отмечаться артериальная гипотензия, что приводит к снижению концентрации внимания.

Сообщалось о случаях желудочно-кишечных кровотечений или язв желудка на фоне терапии бромокриптином. Необходимо тщательное наблюдение за пациентами с язвенной болезнью и кровотечениями из ЖКТ в анамнезе.

Терапия агонистами дофамина, такими как бромокриптин, может вызвать нарушение импульсного контроля поведения (игромания, гиперсексуальность, компульсивный шопинг, траты денег или переедание). У таких пациентов следует рассмотреть возможность снижения дозы или уменьшения длительности терапии. Необходимо информировать пациентов и их родственников о возможном появлении расстройств контроля поведения на фоне терапии бромокриптином.

На фоне длительного приема высоких доз бромокриптина у пациентов с болезнью Паркинсона, в некоторых случаях наблюдались плевральный выпот, плевральный, легочный и забрюшинный фиброз, констриктивный перикардит. Возникновение фиброзных изменений не исключено при применении бромокриптина и по другим показаниям. Терапия бромокриптином у пациентов с болезнью Паркинсона и наличием в анамнезе фиброзных изменений противопоказана. Необходимы тщательное обследование и мониторинг пациентов с плеврорегочными нарушениями неясной этиологии, следует рассмотреть вопрос о прекращении терапии бромокриптином. Для ранней диагностики ретроперитонеального фиброза на обратимой начальной стадии процесса врачу рекомендуется отслеживать проявление таких симптомов, как боль в спине, отек нижних конечностей, нарушение функции почек. Прием бромокриптина следует отменить при подтвержденных фибротических изменениях в забрюшинном пространстве или при подозрении на их наличие. Наблюдаемые фиброзные изменения в легких и плевре могут быть связаны с фиброзным утолщением клапанов сердца, что имеет место при терапии другими производными алкалоида спорыньи.

Применение при пролактинсекретирующих аденомах

Так как у пациентов с макроаденомами гипофиза могут отмечаться признаки гипопитуитаризма в результате сдавления или разрушения ткани гипофиза, перед назначением бромокриптина следует провести полное обследование функции гипофиза и провести соответствующую заместительную терапию. Необходим тщательный контроль размеров опухоли. При увеличении опухоли следует рассмотреть возможность хирургических методов лечения. Необходимо тщательное наблюдение за состоянием беременных пациенток, получавших ранее бромокриптин по поводу пролактинсекретирующих аденом гипофиза, так как во время беременности возможно увеличение размеров опухоли. У пациенток, имеющих клинические проявления роста пролактиномы (локальная головная боль, боль в лицевой области), терапия бромокриптином должна быть возобновлена. В этом случае лечение часто приводит к уменьшению размеров опухоли и быстрой положительной динамике со стороны дефектов полей зрения. В тяжелых случаях, при развитии компрессии зрительного или других черепно-мозговых нервов, может потребоваться проведение экстренного хирургического вмешательства на гипофизе. Известным осложнением макропролактином является выпадение полей зрения. Эффективная терапия бромокриптином снижает гиперпролактинемию и устраняет нарушение полей зрения. Тем не менее, у некоторых пациентов возможны вторичные изменения полей зрения, несмотря на нормализацию концентрации пролактина и уменьшение размеров опухоли. Это может быть связано со смещением зрительного перекреста вниз, за счет освобождения объема в области турецкого седла. В этом случае снижение дозы бромокриптина, приводящее к росту концентрации пролактина и увеличение, в некоторой степени, размеров опухоли, может способствовать устранению дефектов полей зрения.

Для раннего выявления вторичных выпадений полей зрения, вызванных пространственным выпячиванием зрительного перекреста в полость турецкого седла и фармакологическим действием данной дозы бромокриптина, показан мониторинг полей зрения у пациентов с макропролактиномой.

У пациентов с акромегалией возможно развитие «холодового» спазма сосудов.

Сообщалось о случаях цереброспинальной жидкостной ринореи у некоторых пациентов с пролактинсекретирующими аденомами, принимающих бромокриптин. Имеющиеся данные свидетельствуют о том, что это связано с уменьшением объема инвазивных опухолей.

Пациентам с вторичной надпочечниковой недостаточностью необходимо проведение заместительной терапии глюкокортикостероидами и минералокортикостероидами.

Следует соблюдать осторожность при лечении пациентов с почечной недостаточностью

тяжелой степени.

На фоне приема бромокриптина регистрировались случаи сонливости и внезапного засыпания, особенно у пациентов с болезнью Паркинсона. Сообщалось об очень редких внезапных приступах сна во время повседневной деятельности, без предупреждающих симптомов. Пациенты должны быть проинформированы об этом. При появлении сонливости или внезапных приступах сна следует рассмотреть возможность снижения дозы бромокриптина или прекращения терапии.

Лечение бромокриптином может восстановить репродуктивный потенциал женщины. Поэтому женщинам репродуктивного возраста, для которых беременность нежелательна, необходимо применять надежный метод контрацепции и регулярно (не менее чем 1 раз в 4 недели) проводить тест на беременность в периоде аменореи. Женщинам с патологией, не связанной с гиперпролактинемией, бромокриптин следует принимать в самой минимальной эффективной терапевтической дозе, необходимой для купирования симптомов. Это важно для предотвращения снижения концентрации пролактина в плазме ниже нормы, приводящего к нарушению функции желтого тела.

Применение бромокриптина для предотвращения или подавления лактации в послеродовом периоде не должно быть рутинным (в случае начинающегося послеродового мастита применение препарата целесообразно при неэффективности спазмолитиков, анальгетиков, ношения удобного поддерживающего белья и т.д.).

В редких случаях на фоне приема бромокриптина в послеродовом периоде сообщалось о тяжелых нежелательных реакциях (артериальная гипертензия, инфаркт миокарда, судороги, инсульт или психотические нарушения). У некоторых женщин судорожному приступу или инсульту предшествовала сильная головная боль и/или преходящие нарушения зрения. Хотя причинно-следственная связь этих состояний с приемом бромокриптина не установлена, необходим регулярный контроль АД. Особую осторожность в послеродовом периоде следует соблюдать у женщин с артериальной гипертензией, недавно получавших симпатомиметики или алкалоиды спорыньи (метилэргометрин или эргометрин). Их совместное применение в послеродовом периоде противопоказано.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Бромокриптин является одновременно и субстратом, и ингибитором системы цитохрома P450 (изофермента CYP3A4). Одновременное применение бромокриптина с умеренными или мощными ингибиторами изофермента CYP3A4 (итраконазолом, вориконазолом,

флуконазолом, кларитромицином, эритромицином, индинавиром, нелфинавиром, ритонавиром, грейпфрутовым соком) может увеличить концентрацию бромокриптина в плазме крови. Данных о взаимодействии бромокриптина и слабых ингибиторов CYP3A4 нет.

Одновременное применение *октреотида* и бромокриптина у пациентов с акромегалией сопровождается увеличением концентрации последнего в плазме крови.

Следует соблюдать осторожность при одновременном применении бромокриптина с лекарственными препаратами с узким терапевтическим индексом (например, *амиодароном*, *имипрамином*, *тербинафином*) ввиду возможного удлинения интервала QT.

Одновременное применение бромокриптина с метилэргометрином или другими алкалоидами спорыньи может увеличить стимулирующее действие на рецепторы дофамина и выраженность нежелательных дофаминергических эффектов, таких как головная боль, тошнота и рвота.

Одновременное применение с *симпатомиметиками* может привести к повышению АД и сильной головной боли.

При одновременном применении с *суматриптаном* может увеличиться риск вазоспастической реакции вследствие аддитивного действия.

Терапевтическая эффективность бромокриптина, связанная со стимуляцией центральных дофаминовых рецепторов, может снижаться при одновременном приеме *антагонистов дофаминовых рецепторов*, таких как *нейролептики* (*фенотиазины*, *бутирофеноны* и *тиоксантены*), а также *метоклопрамида* и *домперидона*.

Одновременное применение бромокриптина с *гипотензивными препаратами* может привести к более выраженному снижению АД.

Бромокриптин можно применять или в монотерапии, или в сочетании с другими противопаркинсоническими средствами (как на ранних, так и на поздних стадиях болезни). Комбинация с *леводопой* приводит к усилению противопаркинсонического действия, что нередко дает возможность уменьшить дозу леводопы. Применение бромокриптина у пациентов, получающих лечение леводопой, особенно показано при ослаблении лечебного эффекта леводопы или при развитии таких осложнений, как патологические непроизвольные движения (хорео-атетоидная дискинезия и/или болезненная дистония), синдром истощения эффекта к концу действия дозы леводопы, феномен «включения-выключения» («on-off»).

Переносимость бромокриптина может снижаться на фоне приема *этанола* (*алкоголя*).

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

Лечение бромокриптином при наступлении беременности следует прекратить, за исключением случаев, когда потенциальный эффект лечения превышает возможный риск для плода (при больших и быстрорастущих опухолях гипофиза). После отмены препарата риск прерывания беременности не возрастает. Клинический опыт показывает, что применение бромокриптина в период беременности не оказывает отрицательного влияния на ее течение или исход.

При отмене бромокриптина у беременных женщин с аденомой гипофиза следует проводить тщательное наблюдение за пациентками на протяжении всего срока беременности. В случае появления признаков выраженного увеличения пролактиномы, например, головной боли или сужения полей зрения, лечение бромокриптином может быть возобновлено или проведено оперативное вмешательство.

Лактация

Бромокриптин снижает секрецию молока, поэтому не рекомендуется его применение в период грудного вскармливания.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

Пациентам, принимающим бромокриптин, следует соблюдать особую осторожность при управлении транспортными средствами или работе с механизмами, так как на фоне терапии, особенно в течение первых дней, может развиваться артериальная гипотензия, приводящая к снижению концентрации внимания. В период приема бромокриптина отмечались сонливость и эпизоды внезапного засыпания, особенно у пациентов с болезнью Паркинсона. Эпизоды внезапного засыпания на фоне дневного бодрствования, возникающие без предшествующей сонливости, отмечались крайне редко. Перед назначением бромокриптина врачу следует проинформировать пациента об указанных факторах риска и рекомендовать воздержаться от управления транспортными средствами и механизмами, а также от занятий другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания и быстроты реакций.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме нежелательных реакций

Частота нежелательных реакций приведена в следующей градации согласно классификации Всемирной организации здравоохранения: очень часто ($\geq 1/10$); часто ($\geq 1/100$, но $< 1/10$);

нечасто ($\geq 1/1000$, но $< 1/100$); редко ($\geq 1/10\,000$, но $< 1/1000$); очень редко ($< 1/10\,000$), частота неизвестна (на основании имеющихся данных оценить невозможно).

Психические нарушения

Нечасто – подавленное настроение, спутанность сознания, психомоторное возбуждение, галлюцинации;

Редко – психоз.

Нарушения со стороны нервной системы

Часто – головная боль, головокружение, сонливость;

Нечасто – дискинезия;

Редко – парестезия, бессонница;

Очень редко – эпизоды внезапного засыпания.

Нарушения со стороны органа зрения

Редко – снижение остроты зрения, «затуманивание» зрения.

Нарушения со стороны органа слуха и лабиринта

Редко – звон или шум в ушах.

Нарушения со стороны сердца

Редко – брадикардия, тахикардия, аритмия, перикардит, констриктивный перикардит;

Очень редко – фиброз створок клапанов сердца; *частота неизвестна* – учащение приступов стенокардии.

Нарушения со стороны сосудов

Нечасто – снижение АД, ортостатическая гипотензия (очень редко приводящая к обмороку);

Очень редко – обратимая бледность пальцев верхних и нижних конечностей (особенно у пациентов с синдромом Рейно в анамнезе).

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения

Часто – заложенность носа;

Редко – одышка, плеврит, плевральный выпот, плевральный фиброз, фиброз легких.

Желудочно-кишечные нарушения

Часто – тошнота, рвота, запор; *нечасто* – сухость во рту;

Редко – боль в животе, диарея, язвенные поражения желудка и кишечника, желудочно-кишечные кровотечения, ретроперитонеальный фиброз.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей

Нечасто – аллергический дерматит, алопеция.

Нарушения со стороны мышечной, скелетной и соединительной ткани

Нечасто – спазм мышц.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей

Нечасто – недержание мочи.

Общие нарушения и реакции в месте введения

Редко – периферические отеки;

Очень редко – возникновение в случае резкой отмены препарата синдрома, напоминающего злокачественный нейролептический синдром.

Очень редко (при применении бромокриптина для подавления лактации в послеродовом периоде) отмечалось повышение АД, инфаркт миокарда, инсульт, судороги или нарушения психики; при применении высоких доз бромокриптина для лечения болезни Паркинсона – возможно развитие патологического влечения к азартным играм; повышение либидо, гиперсексуальность (как правило, обратимых после снижения дозы или отмены препарата).

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза – риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств – членов Евразийского экономического союза.

Российская Федерация

109074, г. Москва, Славянская площадь, д. 4, стр. 1

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения (Росздравнадзор)

Телефоны: +7 (495) 698-45-38, +7 (499) 578-02-30

Факс: +7 (495) 698-15-73

E-mail: pharm@roszdravnadzor.ru

www.roszdravnadzor.ru/people

4.9. Передозировка

Симптомы

Тошнота, рвота, головокружение, снижение АД, ортостатическая гипотензия, тахикардия, сонливость, апатия, вялость, галлюцинации. При случайном приеме бромокриптина внутрь детьми (отдельные сообщения) отмечалось развитие рвоты, лихорадки и сонливости. Улучшение состояния происходило спонтанно или через несколько часов после проведения соответствующей терапии.

Лечение

Промывание желудка, прием активированного угля; проведение симптоматической терапии. Для купирования рвоты или галлюцинаций может быть назначен метоклопрамид.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: дофаминовых рецепторов агонист

Код АТХ: N04BC01

Механизм действия и фармакодинамические эффекты

Бромокриптин является производным спорыньи, агонистом (D2) рецепторов дофамина. Снижает секрецию пролактина в передней доле гипофиза и не влияет на выработку и высвобождение других гормонов гипофиза, за исключением пациентов с акромегалией, у которых бромокриптин снижает концентрацию гормона роста.

В послеродовом периоде пролактин необходим для начала и поддержания лактации. В другие периоды жизни увеличение секреции пролактина приводит к патологической лактации (галакторее) и/или нарушениям овуляции и менструального цикла.

Бромокриптин, являясь специфическим ингибитором секреции пролактина, может применяться для предупреждения или подавления физиологической лактации, а также для лечения патологических состояний, вызванных гиперсекрецией пролактина. При аменорее и/или ановуляторных менструальных циклах (сопровождающихся или не сопровождающихся галактореей), бромокриптин нормализует функцию яичников, восстанавливая эндокринную регуляцию на уровне яичники - гипофиз. Бромокриптин не нарушает послеродовую инволюцию матки и не увеличивает риска тромбоэмболий. При синдроме поликистозных яичников препарат уменьшает выраженность клинических проявлений. Бромокриптин прекращает рост или уменьшает размер пролактинсекретирующих аденом (пролактином).

У пациентов с акромегалией, помимо снижения концентрации гормона роста и пролактина в плазме крови, бромокриптин благотворно влияет на клинические проявления и толерантность к глюкозе.

При болезни Паркинсона, характеризующейся недостатком дофамина в некоторых структурах головного мозга, бромокриптин применяется в более высоких дозах, чем для лечения эндокринных заболеваний. Бромокриптин стимулирует рецепторы дофамина, способствуя восстановлению нейрохимического баланса в этих структурах. Применение бромокриптина уменьшает выраженность тремора, ригидности, акинезии и нарушения походки на всех стадиях заболевания. Терапевтический эффект обычно сохраняется на

протяжении многих лет (хорошие результаты отмечались при длительности терапии до 8 лет). Бромокриптин можно назначать в качестве монотерапии или в комбинации с другими противопаркинсоническими средствами в начале и на более поздних стадиях заболевания. Комбинация с леводопой приводит к увеличению антипаркинсонического эффекта, что позволяет снизить дозу леводопы. Бромокриптин уменьшает выраженность депрессии у пациентов с болезнью Паркинсона. Это обусловлено присущими ему антидепрессивными свойствами, подтвержденными в контролируемых клинических исследованиях у пациентов с эндогенной или психогенной депрессией без болезни Паркинсона.

Пролактинснижающий эффект начинается через 1-2 ч после приема препарата внутрь, достигая максимума через 5-10 ч (снижение концентрации пролактина составляет около 80 %), и сохраняется приблизительно на этом уровне в течение 8-12 ч.

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

Абсорбция после приема внутрь составляет 25-30 %. Максимальная концентрация в плазме крови достигается в течение 1-3 ч. После приема внутрь бромокриптина в дозе 5 мг максимальная концентрация в плазме крови составляет 0,465 нг/мл. Одновременный прием пищи не оказывает существенное влияние на фармакокинетику бромокриптина, однако для лучшей переносимости со стороны желудочно-кишечного тракта (ЖКТ) рекомендуется принимать его во время еды.

Распределение

Связь бромокриптина с белками плазмы крови составляет 96 %.

Биотрансформация

Бромокриптин почти полностью метаболизируется в печени при «первичном прохождении» с образованием целого ряда неактивных метаболитов. Основным путем метаболизма бромокриптина является гидроксилирование пролинового кольца в составе циклопептида. Бромокриптин имеет высокое сродство к изоферменту CYP3A. Ингибиторы и/или потенциальные субстраты CYP3A4 могут замедлять метаболизм бромокриптина и повышать его концентрацию в плазме крови. Бромокриптин является сильным ингибитором изофермента CYP3A4. Однако, в связи с низкими терапевтическими концентрациями свободного бромокриптина, не ожидается значительного изменения метаболизма одновременно применяемых препаратов, клиренс которых осуществляется при участии CYP3A4. Влияние на метаболизм бромокриптина ферментов микросомального окисления печени, таких как изоферменты CYP2D6, CYP2C8, CYP2C19, не было изучено.

Элиминация

Выведение неизмененного бромокриптина из плазмы крови двухфазно: период полувыведения составляет около 3-4 ч для бромокриптина и 50 ч – для метаболитов. Бромокриптин и его метаболиты почти полностью выводятся через кишечник, только 6 % выводится почками.

Раса и пол

Влияние расы и пола на фармакокинетику бромокриптина и его метаболитов не изучалось.

Лица пожилого возраста

Влияние возраста на фармакокинетику бромокриптина не изучалось.

Почечная недостаточность

Фармакокинетика бромокриптина у пациентов с нарушением функции почек не изучалась.

Печеночная недостаточность

Фармакокинетика бромокриптина у пациентов с нарушением функции печени не изучалась.

У пациентов с нарушением функции печени скорость выведения бромокриптина может замедляться, а концентрация в плазме крови - повышаться, что требует коррекции дозы.

Дети

Нет данных, фармакокинетика бромокриптина не изучалась.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

- лактозы моногидрат (сахар молочный);
- целлюлоза микрокристаллическая (МКЦ-101 Премиум);
- крахмал картофельный;
- повидон-K25;
- карбоксиметилкрахмал натрия;
- магния стеарат.

6.2. Несовместимость

Не применимо.

6.3. Срок годности (срок хранения)

3 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

В защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

По 10, 30 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной либо пленки поливинилхлоридной/поливинилиденхлоридной и фольги алюминиевой печатной

лакированной.

Или по 10, 30 таблеток в контурную ячейковую упаковку из материала комбинированного на основе фольги (трехслойный материал, включающий алюминиевую фольгу, пленку из ориентированного полиамида, поливинилхлоридную пленку), и фольги алюминиевой печатной лакированной.

Или по 10, 20, 30, 40, 50 или 100 таблеток в банку стеклянную из коричневого стекла класса 3, укупоренную крышкой полимерной с влагопоглотителем и кольцом контроля первого вскрытия.

1, 2, 3, 4, 5, 6, 8 или 10 контурных ячейковых упаковок, или одну банку вместе с инструкцией по применению помещают в картонную упаковку (пачку).

6.6. Особые меры предосторожности при уничтожении использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата и другие манипуляции с препаратом

Особые требования отсутствуют.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация

ООО «Озон»

445351, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Песочная, д. 11.

Тел.: +79874599991, +79874599992

E-mail: ozon@ozon-pharm.ru

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

ООО «Озон»

445351, Самарская обл., г.о. Жигулевск, г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.

Тел.: +79874599991, +79874599992

E-mail: ozon@ozon-pharm.ru

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

Дата первой регистрации:

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата Бромокриптин, доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-коммуникационной сети «Интернет».