Артезин

Код АТХ:

- C02CA04

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Доксазозин

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН]
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Таблетки белого или белого с кремоватым оттенком цвета, плоскоцилиндрические с фаской.

	1 таб.
доксазозина мезилат	1.22 мг,
что соответствует содержанию доксазозина	1 мг

Вспомогательные вещества: крахмал картофельный, лактоза, целлюлоза микрокристаллическая, повидон (коллидон 25), кремния диоксид коллоидный (аэросил), натрия лаурилсульфат, магния стеарат.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.

Таблетки белого или белого с кремоватым оттенком цвета, плоскоцилиндрической формы.

	1 таб.
доксазозина мезилат	2.44 мг
в пересчете на доксазозин 2 мг	

Вспомогательные вещества: крахмал картофельный, лактоза, целлюлоза микрокристаллическая, повидон, кремния диоксид коллоидный (аэросил), натрия лаурилсульфат (натрия додецилсульфат), магния стеарат.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Вегетотропные средства
- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Селективный конкурентный блокатор постсинаптических α_1-адренорецепторов. За счет снижения тонуса мышц сосудов доксазозин уменьшает ОПСС, что приводит к снижению АД.

После однократного приема препарата максимальное снижение АД отмечается в течение 2-6 ч. Гипотензивный эффект сохраняется в течение 24 ч.

В период лечения препаратом Артезин у больных артериальной гипертензией отсутствуют различия величин АД в положении стоя и лежа. Эффективен при артериальной гипертензии, в т.ч. сопровождающейся метаболическими нарушениями (ожирение, снижение толерантности к глюкозе). Снижает риск развития ИБС.

Применение препарата у пациентов с нормальным АД не сопровождается снижением АД.

При длительном применении Артезина у больных не наблюдается изменения толерантности к терапевтическому антигипертензивному эффекту.

В период лечения Артезином наблюдается снижение уровня триглицеридов и общего холестерина в плазме крови. Одновременно отмечается рост (на 4-13%) коэффициента ЛПВП/общий холестерин.

При длительном применении препарата наблюдается регрессия гипертрофии левого желудочка, подавление агрегации тромбоцитов и повышение содержания в тканях активного плазминогена.

В связи с тем, что доксазозин блокирует α_1-адренорецепторы, расположенные в строме и капсуле предстательной железы и в шейке мочевого пузыря, происходит снижение сопротивления и давления в мочеиспускательном канале, уменьшение сопротивления внутреннего сфинктера, что в свою очередь приводит к значительному улучшению показателей уродинамики и уменьшению симптомов доброкачественной гиперплазии предстательной железы. Препарат эффективен у 66-71% больных, стабильный клинический эффект развивается через 1-2 недели лечения, максимальное действие – через 14 недель. Эффект сохраняется в течение длительного времени.

Фармакокинетика

Всасывание и распределение

После приема внутрь в терапевтических дозах доксазозин хорошо всасывается из ЖКТ. Абсорбция - 80-90%. Одновременный прием пищи замедляет абсорбцию на 1 ч. Время достижения C_{max} – 3 ч, при вечернем приеме - 5 ч. Биодоступность – 60-70% (за счет пресистемного метаболизма).

Связывание с белками плазмы крови – около 98%.

Метаболизм

Быстро метаболизируется в печени путем о-деметилирования и гидроксилирования.

Выведение

Выведение из плазмы крови происходит в 2 фазы с конечным $T_{1/2}$ - 19-22 ч, что позволяет назначать препарат 1 раз/сут.

Выводится через кишечник, преимущественно в виде метаболитов до 65%, с мочой - 5% (в неизмененном виде).

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Исследования фармакокинетики доксазозина у пациентов пожилого возраста и у пациентов с заболеваниями почек не выявили существенных фармакокинетических особенностей.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия (как в монотерапии, так и в комбинации с другими антигипертензивными средствами /тиазидные диуретики, бета-адреноблокаторы, блокаторы медленных кальциевых каналов или ингибиторы АПФ/);

— доброкачественная гиперплазия предстательной железы (как при наличии артериальной гипертензии, так и при нормальном АД).

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гиперплазия предстательной железы
- Гипертензия

Противопоказания:

— возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены) - для таблеток 2 мг и 4 мг;

— повышенная чувствительность к доксазозину, производным хиназолона или другим компонентам препарата.

С *осторожностью* следует применять препарат при аортальном и митральном стенозах, ортостатической гипотензии, нарушениях функции печени, пациентам в возрасте до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены) для таблеток 1 мг.

Способ применения и дозы:

Препарат назначают внутрь 1 раз/сут (утром или вечером), независимо от приема пищи, не разжевывая и запивая достаточным количеством воды.

При *артериальной гипертензии* начальная суточная доза составляет 1 мг перед сном.

После приема первой дозы пациент должен находиться в постели в течение 6-8 ч. Это необходимо в связи с возможностью развития "феномена первой дозы", особенно на фоне предшествующего приема диуретиков.

При недостаточности терапевтического эффекта через 1-2 недели суточную дозу можно увеличить до 2 мг. В последующем через каждые 1-2 недели можно увеличивать дозу на 2 мг. У большинства больных оптимальный терапевтический эффект достигается при суточной дозе 8 мг. Максимальная суточная доза – 16 мг.

После достижения стойкого терапевтического эффекта дозу обычно снижают (средняя терапевтическая доза при поддерживающей терапии обычно равна 2-4 мг/сут).

При *доброкачественной гиперплазии предстательной железы* Артезин назначают в начальной дозе 1 мг/сут. При необходимости дозу увеличивают до 2-4 мг/сут. Максимальная суточная доза - 8 мг.

Продолжительность лечения длительная и определяется лечащим врачом.

Побочное действие:

Артериальная гипертензия

В клинических исследованиях наиболее часто наблюдалась, особенно в начале лечения, ортостатическая гипотензия, которая в редких случаях может привести к обмороку.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: отеки, обморок.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: головокружение, головная боль, сонливость.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота.

Со стороны дыхательной системы: ринит.

Общие реакции: астения, утомляемость, недомогание.

Также отмечались следующие побочные эффекты у пациентов с артериальной гипертензией (причинно-следственная связь с приемом препарата не установлена): брадикардия, тахикардия, ощущение сердцебиения, боль в груди, стенокардия, инфаркт миокарда, нарушение мозгового кровообращения, аритмия.

Доброкачественная гиперплазия предстательной железы

У пациентов с доброкачественной гиперплазией предстательной железы те же побочные эффекты, что и у больных с артериальной гипертензией, а также:

Со стороны сердечно-сосудистой системы: снижение АД, ортостатическая гипертензия.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: сухость во рту, приапизм, гипестезия, парестезии, тремор, импотенция, бессонница, повышенная возбудимость.

Со стороны эндокринной системы: гинекомастия.

Со стороны пищеварительной системы: боли в животе, запор, диарея, диспепсия, метеоризм, потеря аппетита, тошнота, повышение активности печеночных трансаминаз, холестаз, желтуха, гепатит.

Со стороны органов кроветворения: лейкопения, пурпура, тромбоцитопения.

Со стороны костно-мышечной системы: артралгия, мышечные судороги, слабость в мышцах, миалгия.

Со стороны дыхательной системы: бронхоспазм, кашель, одышка, носовое кровотечение.

Дерматологические реакции: алопеция.

Со стороны органов чувств: нечеткость зрительного восприятия, шум в ушах.

Со стороны мочевыделительной системы: дизурия, гематурия, нарушение мочеиспускания, никтурия, полиурия, недержание мочи.

Аллергические реакции: кожная сыпь, крапивница.

Прочие: боль в спине, ощущение жара (приливы крови в коже лица).

Передозировка:

Симптомы: выраженное снижение АД, иногда сопровождающееся обмороками.

Лечение: больному необходимо придать горизонтальное положение с приподнятыми ногами. Проводят симптоматическую терапию. Гемодиализ неэффективен.

Применение при беременности и кормлении грудью:

До настоящего времени опыта применения препарата Артезин при беременности и в период грудного вскармливания у больных с артериальной гипертензией недостаточно. Поэтому, несмотря на отсутствие тератогенного и эмбриотоксического эффектов по данным экспериментальных исследований, Артезин можно назначать при беременности и в период грудного вскармливания только после тщательной оценки ожидаемой пользы терапии для матери и возможного риска для плода или грудного ребенка.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Доксазозин усиливает гипотензивный эффект антигипертензивных средств (при использовании в комбинациях требуется коррекция дозы).

Не отмечено неблагоприятного взаимодействия при одновременном применении доксазозина и тиазидных диуретиков, фуросемида, бета-адреноблокаторов, блокаторов медленных кальциевых каналов, ингибиторов АПФ, антибиотиков, пероральных гипогликемических средств, непрямых антикоагулянтов и урикозурических средств.

Препарат не влияет на степень связывания с белками плазмы дигоксина и фенитоина.

При одновременном применении с индукторами ферментов микросомального окисления в печени возможно снижение эффективности доксазозина, с ингибиторами – повышение.

Циметидин увеличивает AUC доксазозина.

НПВС (особенно индометацин), эстрогены и симпатомиметические средства могут снижать гипотензивное действие доксазозина.

Устраняя альфа-адреностимулирующие эффекты эпинефрина, доксазозин может приводить к развитию тахикардии и артериальной гипотензии.

Следует соблюдать осторожность при одновременном применении с ингибиторами фосфодиэстеразы (средства для лечения эректильной дисфункции), поскольку у некоторых пациентов возможно усиление гипотензивного действия.

Особые указания и меры предосторожности:

Особую осторожность следует проявлять при назначении препарата больным с нарушением функции печени, особенно в тех случаях, когда одновременно применяются препараты, способные отрицательно повлиять на функцию печени. В случаях ухудшения показателей функционального состояния печени препарат следует отменить.

С целью предотвращения ортостатических реакций больные должны избегать неожиданных и резких смен положения тела (переход из положения лежа в положение стоя).

Перед началом терапии необходимо исключить злокачественные опухоли предстательной железы.

Эффект первой дозы особенно выражен на фоне предшествующей терапии диуретиками и диеты с ограничением натрия.

Прием алкоголя способен усиливать нежелательные реакции.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В связи с тем, что препарат способен вызывать ортостатические реакции в начале лечения или в период повышения доз, больным целесообразно воздерживаться от всех потенциально опасных видов деятельности, в частности от управления автотранспортом и другими транспортными средствами и механизмами.

При нарушениях функции почек

Исследования фармакокинетики доксазозина у больных с заболеваниями почек не выявили существенных фармакокинетических различий.

При нарушениях функции печени

С *осторожностью* следует применять препарат при нарушениях функции печени.

Применение в детском возрасте

Противопоказание: возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены) - для таблеток 2 мг и 4 мг.

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить в сухом, защищенном от света и недоступном для детей месте при температуре не выше 25°С.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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