Эстулик



Код АТХ:

- C02AC02

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Гуанфацин

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки белого или желтовато-белого цвета, круглые, плоские, с фаской, с риской на одной стороне и с гравировкой стилизованной буквы "E" на другой стороне; без или почти без запаха.

	1 таб.
гуанфацина гидрохлорид	1.15 мг,
что соответствует содержанию гуанфацина	1 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая, повидон, стеариновая кислота.

10 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Вегетотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Гуанфацин является гипотензивным средством, действие которого основано на стимуляции центральных α_2-адренорецепторов, что приводит к снижению симпатического тонуса. Стимуляция периферических α_2-адренорецепторов вызывает брадикардию, что также может способствовать развитию гипотензивного эффекта. Препарат уменьшает ОПСС, что ведет к снижению АД. Сердечный выброс не изменяется. Урежение ЧСС компенсируется повышением систолического объема. Механизмы регуляции АД в покое и при физической нагрузке не изменяются. Препарат не влияет на скорость клубочковой фильтрации. Он также снижает активность ренина плазмы и уровень норадреналина плазмы крови, однако, эти эффекты не коррелируют с величиной снижения АД.

Фармакологические свойства препарата позволяют предположить, что он может дать благоприятный эффект у пациентов с обструктивными заболеваниями дыхательных путей, сердечной или почечной недостаточностью, AV-блокадой I степени, сахарным диабетом, подагрой или гиперлипидемией.

Фармакокинетика

После приема внутрь гуанфацин быстро и полностью всасывается в ЖКТ. Его метаболизм первого прохождения через печень не имеет клинического значения. Биодоступность составляет 80%. Степень связывания с белками плазмы крови составляет 60-70% (50% - с эритроцитами). V_d - 6.3 л/кг. C_{max} препарата в плазме крови достигается через 1-4 ч после приема. Его фармакокинетика линейна. Метаболизируется в печени с образованием сульфатных и глюкуронидных конъюгатов. Через почки выводится 80% введенной дозы. Примерно 50% (40-75%) выводится в неизмененном виде; остальное количество выводится в форме метаболитов. $T_{1/2}$ составляет 17-18 ч (10-30 ч); длительный эффект препарата (более 24 ч) позволяет принимать его 1 раз/сут. Препарат проникает через плацентарный барьер и выделяется в грудное молоко.

Пожилые пациенты: возможно увеличение $T_{1/2}$, однако пожилые пациенты могут получать обычные дозы.

Нарушение функции почек: клиренс гуанфацина снижается, но вследствие повышения печеночного метаболизма необходимость в снижении дозы отсутствует. Пациенты находящиеся на гемодиализе не нуждаются в дополнительных дозах, т.к. гуанфацин практически не выводится при диализе (выводится 2.4% всосавшейся дозы).

Нарушение функции печени: гуанфацин не кумулируется в организме.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия, обычно в составе комбинированной терапии, при недостаточной эффективности других антигипертензивных средств или противопоказаниях к их применению.

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия

Противопоказания:

— пациентам с непереносимостью лактозы, галактоземией или синдромом нарушения всасывания глюкозы/галактозы;

— кардиогенный шок;

— коллапс;

— артериальная гипотензия;

— беременность;

— период лактации;

— возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены);

— повышенная чувствительность к активному или любому из неактивных ингредиентов препарата.

С *осторожностью*: AV-блокада II-IIIстепени, депрессия в анамнезе, хроническая печеночная недостаточность, выраженный атеросклероз сосудов головного мозга, облитерирующие заболевания периферических артерий, синусовая брадикардия, недавно перенесенный инфаркт миокарда.

Способ применения и дозы:

Внутрь.

В большинстве случаев достаточное снижение АД достигается приемом 1 дозы/сут, начиная с 0.5 мг или 1 мг (1/2-1 таб.) на ночь (из-за седативного побочного эффекта гуанфацина).

При необходимости дозу можно повышать по 0.5-1 мг (1/2-1 таб.)/сут с интервалами обычно не менее 2-3 недель до достижения желаемого снижения АД. Максимальная суточная доза составляет 3 мг.

Пожилые пациенты: коррекции дозы не требуется.

Нарушение функции почек: коррекция режима дозирования не требуется.

Нарушение функции печени: возможно применение обычных доз, т.к. кумуляции гуанфацина не наблюдается.

Нарушение функции почек и печени: может потребоваться снижение дозы. Необходимо тщательное медицинское наблюдение.

Дети в возрасте до 18 лет: эффективность и безопасность не установлены.

Побочное действие:

Частота и интенсивность нежелательных эффектов зависят от дозы.

Средняя доза 0.5-1 мг обычно хорошо переносится. Более высокие дозы могут вызывать побочные эффекты.

Чаще всего (10-15%) наблюдаются сухость во рту, седативный эффект, головокружение, запор, брадикардия.

Редко (3-10%) отмечаются головная боль, бессонница, слабость, ортостатическая гипотензия.

Очень редко (<3%) встречаются следующие нежелательные эффекты:

Со стороны ЦНС: амнезия, спутанность сознания, парестезии, парез, заторможенность, эйфория, слабость, тревожность, нервозность, замедление скорости психических и двигательных реакций, психомоторное возбуждение, тремор рук и пальцев, депрессия, сонливость.

Со стороны органов чувств: нарушения вкусовых ощущений, звон в ушах, конъюнктивит, ирит, нарушение зрения.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: выраженная брадикардия, усиленное сердцебиение, загрудинная боль, одышка.

Со стороны пищеварительной системы: диарея, затрудненное глотание, слюнотечение, тошнота, снижение аппетита, боль в животе, повышение активности печеночных ферментов.

Со стороны мочеполовой системы: снижение либидо, импотенция, недержание мочи.

Со стороны костно-мышечной системы: спазмы мышц, боль в суставах.

Со стороны кожных покровов: дерматит, кожный зуд,

Прочие: повышенное потоотделение, заложенность носа, ринит.

При длительном применении нежелательные эффекты имеют тенденцию к усилению.

Передозировка:

Симптомы: сонливость, нарушение сознания, выраженное снижение АД, брадикардия, коллапс.

Лечение: промывание желудка, активированный уголь, симптоматическое лечение, тщательное наблюдение за пациентом. Препарат практически не выводится при диализе.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Ввиду отсутствия контролируемых клинических исследований у беременных препарат можно назначать при беременности только по строгим показаниям с учетом соотношения польза/риск. Препарат не следует назначать беременным женщинам с острой токсемической гипертензией.

Поскольку гуанфацин выделяется в грудное молоко, его не следует назначать во время грудного вскармливания. При необходимости применения препарата рекомендуется прекратить кормление грудью.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Следует избегать совместного применения с альфа$_2$-адреноблокаторами (фентоламином, иохимбином), т.к. они могут блокировать эффект препарата Эстулик.

Гипотензивный эффект снижают НПВП (в результате подавления синтеза простагландинов и задержки натрия и жидкости в организме), эстрогены (вследствие задержки жидкости в организме), симпатомиметические средства.

Следует соблюдать осторожность при сочетании со следующими средствами: симпатомиметики (повышенный прессорный эффект); трициклические антидепрессанты; барбитураты и другие индукторы ферментов (из-за усиления печеночного метаболизма, снижается уровень гуанфацина в сыворотке крови и ослабляется его эффект); бета-адреноблокаторы (без внутренней симпатомиметической активности) повышают риск развития брадикардии; другие антигипертензивные средства (возможно усиление их эффекта); седативные, снотворные и нейролептики (могут усилить седативный эффект).

Клинические исследования показали, что гуанфацин не влияет на эффекты антикоагулянтов для приема внутрь.

Этанол и лекарственные средства, угнетающие ЦНС, усиливают депримирующий эффект.

Особые указания и меры предосторожности:

Во время лечения следует постоянно с периодичными интервалами времени контролировать АД.

После внезапного прекращения терапии (через 2-7 сут) возможно развитие синдрома отмены (признаки и симптомы симпатической гиперреактивности), поэтому прекращать прием препарата следует постепенно.

Во время лечения концентрации катехоламинов и ванилилминдальной кислоты в моче могут быть пониженными, но при внезапной отмене препарата могут повышаться. Содержание СТГ в плазме может временно повышаться в связи со стимуляцией секреции гормона, но при продолжительном применении препарата концентрация СТГ нормализуется. Может потребоваться контроль массы тела и диеты (особенно потребления соли). Если снижение АД не сохраняется в течение 24 ч, более эффективным может оказаться применение разделенных доз, но при этом повышается вероятность побочных эффектов.

Больной может не чувствовать симптомы гипертензии; важно принимать препарат даже при хорошем самочувствии.

Для снижения сонливости в дневное время необходимо принимать препарат перед сном.

Следует избегать употребления этанола, а также потенциально опасных видов деятельности, требующих повышенного внимания, быстрой психической и двигательной реакции.

Содержание лактозы в таблетке (91.15 мг) следует принимать во внимание при составлении диеты пациентам с непереносимостью лактозы, галактоземией или синдромом нарушения всасывания глюкозы/галактозы.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В начале курса лечения управление транспортными средствами и другими механизмами не рекомендуется из-за вероятного седативного эффекта и головокружения. В дальнейшем ограничения устанавливаются для каждого пациента индивидуально.

При нарушениях функции печени

С *осторожностью*: хроническая печеночная недостаточность.

Применение в пожилом возрасте

Пожилые пациенты: коррекции дозы не требуется.

Применение в детском возрасте

Дети в возрасте до 18 лет: эффективность и безопасность не установлены.

Условия хранения:

Хранить при температуре от 15° до 25°С. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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