Клофелин



Код АТХ:

- C02AC01

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Клонидин

Полезные ссылки:

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

Фармакотерапевтическая группа:

- Вегетотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антигипертензивное средство центрального действия. Механизм действия обусловлен стимуляцией постсинаптических α_2-адренорецепторов сосудодвигательного центра продолговатого мозга и уменьшает поток симпатической импульсации к сосудам и сердцу на пресинаптическом уровне. Гипотензивный эффект обусловлен снижением ОПСС, уменьшением ЧСС и сердечного выброса.

При быстром в/в введении возможно кратковременное повышение АД, обусловленное стимуляцией постсинаптических α_1-адренорецепторов сосудов. Увеличивает почечный кровоток; повышая тонус сосудов мозга, уменьшает мозговой кровоток; оказывает выраженное седативное действие.

Продолжительность терапевтического эффекта - 6-12 ч.

При закапывании в конъюнктивальный мешок происходит снижение внутриглазного давления вследствие местного адреностимулирующего действия, в результате которого уменьшается продукция внутриглазной жидкости и в некоторой степени улучшается ее отток, а также благодаря ослаблению симпатического тонуса, обусловленного центральным эффектов активного вещества, часть которого подверглась резорбции.

Фармакокинетика

При приеме внутрь хорошо абсорбируется из ЖКТ, C_{max} в плазме крови достигается через 2-4 ч. Связывание с белками - 20-40%. Метаболизируется в печени около 50% абсорбировавшейся дозы. $T_{1/2}$ при нормальной функции почек - 12-16 ч, при нарушении функции почек - до 41 ч. Выводится почками - 40-60% в неизмененном виде, через кишечник - 20%.

Показания к применению:

Для системного применения: артериальная гипертензия (в т.ч. симптоматическая гипертензия почечного генеза), гипертонический криз.

Для местного применения в офтальмологии: открытоугольная глаукома (в качестве монотерапии или в сочетании с другими препаратами, снижающими внутриглазное давление).

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Гипертонический криз
- Гипертония
- Глаукома

Противопоказания:

Артериальная гипотензия, выраженный атеросклероз сосудов головного мозга, облитерирующие заболевания периферических артерий, выраженная синусовая брадикардия, СССУ, AV-блокада II и III степени, кардиогенный шок, депрессия (в т.ч. в анамнезе), одновременное применение трициклических антидепрессантов, одновременное применение этанола и других средств, оказывающих угнетающее влияние на ЦНС, беременность, период лактации, повышенная чувствительность к клонидину.

Способ применения и дозы:

Устанавливают индивидуально. Начальная доза - по 37.5-75 мкг 3 раза/сут. При необходимости дозу постепенно увеличивают до средней суточной дозы 900 мкг. Курс лечения в среднем составляет 1-2 месяца.

При в/м или в/в введении разовая доза составляет 150 мкг.

Максимальные дозы: при приеме внутрь разовая доза - 300 мкг, суточная доза - 2.4 мг.

Для применения в офтальмологии: закапывают в конъюнктивальный мешок 2-4 раза/сут. Лечение начинают с назначения 0.25% раствора. В случае недостаточного снижения внутриглазного давления используют 0.5% раствор. При развитии побочных явлений, связанных с использованием 0.25% раствора, назначают 0.125% раствор.

Побочное действие:

Со стороны сердечно-сосудистой системы: редко - отеки, брадикардия; при в/в введении возможна ортостатическая гипотензия.

Со стороны пищеварительной системы: снижение желудочной секреции, сухость во рту; редко - запор.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: чувство усталости, сонливость, замедление скорости психических и двигательных реакций; редко - нервозность, беспокойство, депрессия, головокружение, парестезии.

Со стороны репродуктивной системы: редко - снижение либидо, импотенция.

Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд.

Прочие: заложенность носа.

Местные реакции: сухость конъюнктивы, зуд или жжение в глазах.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан при беременности, в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

У пациентов, получающих бета-адреноблокаторы, в случае внезапной отмены клонидина возможно резкое повышение АД. Полагают, что это связано с повышением содержания катехоламинов в циркулирующей крови и усилением их вазоконстрикторного действия.

При одновременном применении гормональных контрацептивов для приема внутрь возможно усиление седативного действия клонидина.

При одновременном применении трициклических антидепрессантов (в т.ч. имипрамина, кломипрамина, дезипрамина) уменьшается антигипертензивное действие клонидина.

При одновременном применении с клонидином возможно увеличение длительности действия векурония.

При одновременном применении с верапамилом имеется сообщение о развитии блокады сердца у пациента с артериальной гипертензией.

Полагают, что клонидин подавляет повышенную продукцию катехоламинов, возникающую вследствие гипогликемии, и, следовательно, симптомы гипогликемии (тахикардия, пальпитация, повышенное потоотделение), которые обусловлены влиянием катехоламинов. Кроме того, имеются сообщения о том, что клонидин повышает содержание глюкозы в крови, по-видимому, за счет уменьшения секреции инсулина. Это необходимо принимать во внимание при одновременном применении инсулина.

При переходе с приема клонидина на каптоприл антигипертензивное действие последнего развивается постепенно. В случае внезапной отмены клонидина у пациентов, получающих каптоприл, возможно резкое повышение АД.

Имеются сообщения об уменьшении эффективности леводопы и пирибедила у пациентов с болезнью Паркинсона.

При одновременном применении с празозином возможно изменение антигипертензивного действия клонидина.

При одновременном применении пропранолола, атенолола развивается аддитивный гипотензивный эффект, седативное действие, сухость во рту.

При одновременном применении с циклоспорином имеется сообщение о повышении концентрации циклоспорина в плазме крови.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применять после недавно перенесенного инфаркта миокарда, при хронической почечной недостаточности.

При внезапном прекращении терапии возможно развитие синдрома отмены: повышение АД, нервозность, головные боли, тремор, тошнота.

При проведении терапии клонидином в комбинации с бета-адреноблокаторами, во избежание нежелательного повышения АД в случае прекращения терапии, сначала необходимо постепенно закончить лечение бета-адреноблокаторами, а затем также путем медленного снижения дозы прекратить прием клонидина.

Для профилактики возникновения ортостатической гипотензии при в/в введении клонидина больной должен находиться в положении лежа во время введения и в течение 1.5-2 ч после введения.

При отсутствии эффекта в течение первых 1-2 дней препарат отменяют. Для уменьшения системного действия препарата после инстилляции необходимо на 1-2 мин прижать пальцем область слезного мешка.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения следует избегать потенциально опасных видов деятельности, требующих повышенного внимания и быстрых психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

С осторожностью применять при хронической почечной недостаточности.

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