Кристепин



Код АТХ:

- C02LA51

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Дигидроэргокристин
- Клопамид
- Резерпин

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Драже светло-фиолетового цвета; на изломе - ядро белого или почти белого цвета с оболочкой светло-фиолетового цвета.

	1 драже
клопамид	5 мг
дигидроэргокристина мезилат	580 мкг
резерпин	100 мкг

Вспомогательные вещества: лактоза, крахмал кукурузный, повидон 25, стеарин.

Состав оболочки: сахароза, тальк, титана диоксид, натрия карбоксиметилцеллюлоза 20, поливинилацетат, стеарин, краситель фиолетовый светлый С161, капол 1295 (воск белый + воск карнаубский).

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

Фармакотерапевтическая группа:

- Вегетотропные средства
- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Кристепин является комбинированным антигипертензивным препаратом, содержащим в своем составе 3 взаимодополняющих друг друга компонента.

Резерпин - симпатолитик, проникая в пресинаптические окончания постганглионарных симпатических волокон, высвобождает из везикул норэпинефрин с одновременным нарушением его обратного транспорта и усилением

процесса инактивации МАО. Вызывает истощение запасов нейромедиатора и стойкое снижение АД. Способствует снижению концентрации в нейронах дофамина, серотонина и других нейромедиаторов, оказывая антипсихотическое действие. Ослабляет влияние симпатической иннервации на сердечно-сосудистую систему, уменьшает ЧСС и ОПСС; сохраняет активность парасимпатической нервной системы; углубляет и усиливает физиологический сон, тормозит интерорецептивные рефлексы. Повышает перистальтику ЖКТ, увеличивает продукцию в желудке соляной кислоты; замедляет метаболические процессы в организме; урежает и углубляет дыхательные движения, вызывает миоз, гипотермию; снижает интенсивность обмена веществ. Оказывает положительное влияние на липидный и белковый обмен у больных артериальной гипертензией и коронарным атеросклерозом; увеличивает почечный кровоток, усиливает клубочковую фильтрацию.

Клопамид - сульфаниламидный диуретик средней силы действия, блокирует реабсорбцию ионов натрия на уровне кортикального сегмента петли Генле, выводит ионы натрия, калия, хлора и воду.

Дигидроэргокристин - дигидрированный алкалоид спорыньи, блокирует альфа-адренорецепторы, вызывает расширение сосудов, снижает общее периферическое сосудистое сопротивление.

Гипотензивный эффект препарата превосходит гипотензивный эффект каждого из компонентов в отдельности и действие любой комбинации из двух компонентов; начало действия — на 4-7 день, стойкий гипотензивный эффект достигается через 1-4 недели.

Фармакокинетика

Всасывание

Отдельные компоненты Кристепина всасываются после приема внутрь следующим образом: резерпин примерно на 30-40%, клопамид - около 90% и дигидроэргокристин - менее 25%. C_{max} в плазме крови достигается соответственно: для резерпина - 1-3 ч, для клопамида - около 2 ч, для дигидроэргокристина - около 1 ч.

Распределение

Отдельные компоненты Кристепина легко распространяются в организме (например, для дигидроэргокристина V_d составляет 52 л/кг). Связь с белками плазмы крови: для резерпина - не связывается, клопамид - около 46%, дигидроэргокристин - около 68%. Резерпин и дигидроэргокристин проникают через гематоэнцефалический барьер и через плацентарный.

Метаболизм

Резерпин и дигидроэргокристин интенсивно метаболизируются в печени до неактивных метаболитов. Клопамид не подвергается значительному метаболизму в печени.

Выведение

$T_{1/2}$ резерпина длительный и составляет в первой фазе - 4.5 ч, а во второй - около 271 ч. Путь выведения разный для отдельных компонентов: резерпин и дигидроэргокристин - неактивные метаболиты выводятся с мочой и калом, клопамид, в основном, почками.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия.

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия

Противопоказания:

— депрессия, болезнь Паркинсона, эпилепсия, сопутствующее проведение электросудорожной терапии;

— феохромоцитома, сопутствующее лечение ингибиторами моноаминооксидазы (МАО);

— язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки в фазе обострения, эрозивный гастрит, неспецифический язвенный колит;

— стенокардия, недавно перенесенный инфаркт миокарда, хроническая сердечная недостаточность, выраженная брадикардия, атриовентрикулярная блокада, внутрижелудочковая блокада;

— тяжелая почечная недостаточность (КК ниже 30 мл/мин), нефрит, уремия, нефросклероз;

— артериальная гипотензия, выраженный церебральный атеросклероз;

— тяжелые нарушения функции печени;

— болезнь Аддисона;

— гипокалиемия, гипонатриемия, гипохлоремия;

— гиперурикемия с клиническими проявлениями;

— закрытоугольная глаукома;

— нарушение кроветворения;

— беременность и период лактации;

— бронхиальная астма;

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

— повышенная чувствительность к любому из компонентов препарата.

С осторожностью: сахарный диабет, подагра, пожилой возраст.

Способ применения и дозы:

Внутрь, во время или сразу после еды, не разжевывая, запивая небольшим количеством жидкости.

Дозу устанавливают индивидуально. Рекомендуется начинать лечение с 1 драже 1 раз/сут , при необходимости (отсутствие удовлетворительного терапевтического эффекта) можно увеличить дозу препарата до 2 раз/сут (каждые 42 ч) по 1 драже, и только в исключительных случаях - до 3 раз/сут (каждые 8 ч) по 1 драже.

Максимальная суточная доза составляет 3 драже.

В связи с механизмом действия препарата, о возможном отсутствии эффективности препарата можно говорить не раньше, чем через 2 недели после начала приема, поэтому в этот период не следует без необходимости увеличивать начальную дозу.

При длительном лечении, в случае удовлетворительного терапевтического эффекта, рекомендуется прием 1 драже 1 раз/сут, а у некоторых больных дозу препарата можно уменьшить до 1 драже 1 раз через день. При каждом снижении дозы препарата необходим контроль АД. При проведении поддерживающей терапии не следует превышать дозы - 2 драже/сут .

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: диарея, сухость во рту, боли в животе, тошнота, рвота, обострение течения язвенной болезни, снижение аппетита; редко — изъязвления слизистой оболочки желудка и двенадцатиперстной кишки, желудочно-кишечные кровотечения при применении резерпина в дозе выше 1 мг/сут (количество, содержащееся в 10 таблетках Кристепин).

Со стороны сердечно-сосудистой системы: брадикардия, снижение АД, цереброваскулярные нарушения, ортостатическая гипотензия, боль в груди.

Со стороны ЦНС: головная боль, головокружение, сонливость, слабость, тревожность, нарушение концентрации внимания, бессонница, экстрапирамидные нарушения (тремор, ступор, синдром Паркинсона); так как в состав препарата входит резерпин, следует помнить о возможности появления депрессивных реакций (в том числе, тенденций к самоубийству) и депрессивного синдрома; такие симптомы появляются редко и только в случаях применения больших доз резерпина (более 1 мг/сутки, что соответствует содержанию резерпина более чем в 10 таблетках Кристепина).

Со стороны дыхательной системы: гиперемия и отек слизистой оболочки полости носа. Резерпин может вызывать симптомы бронхоспазма, однако такое действие появляется редко и, как правило, у больных с бронхиальной астмой или бронхообструктивным синдромом.

Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд.

Со стороны органов кроветворения: тромбоцитопения с симптомами геморрагического диатеза.

Лабораторные показатели: гипокалиемия, гипомагниемия, гипокальциемия, метаболический алкалоз, гиперурикемия, гипергликемия, незначительное увеличение содержания триглицеридов, холестерина.

Прочие: галакторея. При длительном применении в высоких дозах - парестезии, снижение либидо, снижение потенции, гинекомастия, нарушение мочеиспускания, спазм аккомодации, гиперемия конъюнктивы, гипотермия, мышечная слабость.

Передозировка:

Симптомы: тошнота, рвота, диарея, мышечная слабость, головокружение, головная боль, выраженное снижение АД, брадикардия, аритмии, депрессия, гипорефлексия спутанность сознания и кома.

Лечение: в качестве первой помощи, если больной в сознании, следует вызвать рвоту, сделать промывание желудка или дать активированный уголь. Проведение симптоматической терапии, направленной на поддержание функции сердечно-сосудистой системы, коррекцию водно-электролитного баланса.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Так как резерпин обладает тератогенным действием, применять препарат Кристепин при беременности не рекомендуется.

Кроме того, резерпин может вызвать опасные для плода артериальную гипотензию, брадикардию. У новорожденных резерпин может способствовать возникновению ринореи и отека слизистой оболочки носа, что ведет к затруднению дыхания и цианозу. Клопамид может вызывать тромбоцитопению у плода.

Препарат не следует применять в период лактации. Связано это, в основном, с проникновением в молоко резерпина и дигидроэргокристина.

Дигидроэргокристин может вызывать у новорожденных симптомы, напоминающие отравление спорыньей, а у матери тормозить/ослаблять лактацию.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Снижает эффективность пероральных гипогликемических лекарственных средств, трициклических антидепрессантов, антикоагулянтов.

Повышает концентрацию лития в плазме крови (замедляя его выведение). Ослабляет действие противоэпилептических лекарственных средств и леводопы, холиноблокаторов, уменьшает анальгсзирующий эффект морфина.

Усиливает действие барбитуратов, этанола, лекарственных средств для ингаляционной анестезии, антигистаминных лекарственных средств.

Усиливает действие адреномиметиков прямого действия.

Барбитураты, этанол, бета-адреноблокаторы, периферические вазодилататоры усиливают гипотензивное действие.

Глюкокортикостероиды, нестероидные противовоспалительные препараты, слабительные лекарственные средства уменьшают диуретический, гипотензивный эффекты, повышают риск развития гипокалиемии.

На фоне лечения ингибиторами МАО - усиление угнетающего действия на центральную нервную систему.

На фоне лечения препаратом ингибиторы МАО вызывают умеренную или тяжелую артериальную гипертензию, гиперрефлексию.

Антиаритмические средства - в случае гипокалиемии, которая может сопутствовать лечению, повышается риск токсического действия амиодарона, дизопирамида, хинидина; гипокалиемия ослабляет эффект лидокаина, мексилетина.

Не рекомендуется сочетание с допамином (усиление вазоконстрикторной реакции).

При совместном применении с дигоксином - повышается риск брадикардии; в случае гипокалиемии, которая может сопутствовать лечению, повышен риск усиления побочных реакций дигоксина.

Особые указания и меры предосторожности:

Поскольку эффект Кристепина развивается относительно медленно, дозировку не следует увеличивать чаще, чем 1 раз в неделю, в связи с возможностью появления выраженного снижения АД; необходимо соблюдать особую осторожность в случае совместного применения с другими антигипертензивными средствами; во время лечения периодически контролировать уровень АД для определения оптимального режима дозирования.

В период лечения может повышаться уровень глюкозы и мочевой кислоты в сыворотке крови, рекомендуется проводить периодический контроль этих параметров, особенно у больных с нарушенной толерантностью глюкозы и гиперурикемией. Необходим контроль функции почек, особенно у больных с хронической почечной недостаточностью.

В случае возникновения брадикардии в период лечения, дозу препарата необходимо уменьшить или отменить препарат.

Во время лечения-необходим контроль калия в сыворотке крови. У большинства больных дополнительного назначения препаратов калия не требуется, при условии, что диета содержит достаточное-количество продуктов, богатых калием (фрукты, овощи, рыба, нежирный сыр и т.д.).

Следует соблюдать осторожность у больных с бронхиальной астмой и бронхоспазмами, в случае обострения необходимо прекратить прием Кристепина. Не менее чем за 2 недели перед планируемым хирургическим вмешательством, следует прекратить прием препарата и заменить его другим антигипертензивным средством. Во время лечения не следует употреблять спиртные напитки.

Следует соответствующим образом модифицировать дозу Кристепина в случае одновременного применения других, взаимодействующих с ним лекарственных средств. За 7 дней до начала проведения электросудорожной терапии, следует отменить Кристепин.

Влияние на способность управлять автотранспортом и работать с механизмами

Кристепин может нарушать способность пациента к быстрым реакциям, особенно в начале лечения. В период лечения не следует управлять транспортными средствами и заниматься любыми видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Противопоказание:тяжелая почечная недостаточность (КК ниже 30 мл/мин), нефрит, уремия, нефросклероз.

При нарушениях функции печени

Противопоказание: тяжелые нарушения функции печени.

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью: пожилой возраст.

Применение в детском возрасте

Противопоказание: возраст до 18 лет (эффективность и безопасность применения не установлены).

Условия хранения:

Список Б. Хранить в сухом, защищенном от света месте, при температуре 10-25°С. Хранить в недоступном для детей месте.

Не использовать после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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