

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению препарата
ЭСТУЛИК

Регистрационный номер: _____

Торговое название препарата: Эстулик

МНН: гуанфацин

Лекарственная форма: таблетки

Состав: каждая таблетка содержит 1 мг активного вещества гуанфацина (1,15 мг гуанфацина гидрохлорида). Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая, повидон, стеариновая кислота.

Описание: белые или желтовато-белые, круглые, плоские таблетки с фаской, с риской на одной стороне и с гравировкой стилизованной буквы E на другой стороне таблетки, без или почти без запаха.

Фармакотерапевтическая группа: гипотензивное средство центрального действия

КОД АТХ: C02A C02

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА**Фармакодинамика**

Гуанфацин является гипотензивным средством, действие которого основано на стимуляции центральных альфа-2-адренергических рецепторов, что приводит к снижению симпатического тонуса. Стимуляция периферических альфа-2-адренорецепторов вызывает брадикардию, что также может способствовать развитию гипотензивного эффекта. Препарат уменьшает общее периферическое сосудистое сопротивление, что ведет к снижению артериального давления (АД). Сердечный выброс не изменяется. Урежение частоты сердечных сокращений (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, атриовентрикулярной блокадой I степени, сахарным диабетом, подагрой или гиперлипидемией.

Фармакокинетика

После приема внутрь гуанфацин быстро и полностью всасывается в желудочно-кишечном тракте. 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). Объем распределения 6,3 л/кг. Максимальная концентрация препарата в плазме крови достигается через 1 - 4 часа 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 неизменном виде; остальное количество выводится в форме метаболитов. Период полувыведения составляет 17-18 часов (10-30 часов); длительный эффект препарата (более 24 часов) позволяет принимать его 1 раз в сутки.

Препарат проникает через плацентарный барьер и выделяется в грудное молоко.

Пожилые пациенты: возможно увеличение периода полувыведения, однако пожилые пациенты могут получать обычные дозы (см. также раздел "Способ применения и 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, так как гуанфацин

практически не выводится при диализе (выводится 2,4% всосавшейся дозы). (См. также раздел "Способ применения и дозы")

Нарушение функции печени: гуанфацин не кумулируется в организме. (См. также раздел "Способ применения и дозы")

ПОКАЗАНИЯ

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

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

Повышенная чувствительность к активному или любому из неактивных ингредиентов препарата, кардиогенный шок, коллапс, артериальная гипотензия, беременность (см. раздел «Беременность и период лактации»), период лактации, возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены), пациентам с непереносимостью лактозы, галактоземией или синдромом нарушения всасывания глюкозы/галактозы.

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

Беременность и период лактации

Ввиду отсутствия контролируемых клинических исследований у беременных препарат можно назначать во время 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.

СПОСОБ ПРИМЕНЕНИЯ И ДОЗЫ

Внутрь.

В большинстве случаев достаточное снижение АД достигается приемом одной дозы в сутки, начиная с 0,5 мг или 1 мг (1/2 - 1 таблетки) лежа в постели на ночь (из-за седативного побочного эффекта гуанфацина).

При необходимости дозу можно повышать по 0,5 - 1 мг (1/2 - 1 таблетки) в сутки 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:

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

Органы чувств: нарушения вкусовых ощущений, звон в ушах, конъюнктивит, ирит, нарушение зрения.

Сердечно-сосудистая система: выраженная брадикардия, усиленное сердцебиение, загрудинная боль, одышка.

Желудочно-кишечный тракт: диарея, затрудненное глотание, слюнотечение, тошнота, снижение аппетита, боль в животе, повышение активности «печеночных» ферментов.

Мочеполовая система: снижение либидо, импотенция, недержание мочи.

Опорно-двигательный аппарат: спазмы мышц, боль в суставах.

Кожные покровы: 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.

ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ С ДРУГИМИ ЛЕКАРСТВЕННЫМИ СРЕДСТВАМИ

Следует избегать совместное применение с альфа-2 антагонистами (фентоламином, иохимбином), так как они могут блокировать эффект препарата Эстулик.

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

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

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 вождения автомобилей

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.

ФОРМА ВЫПУСКА

Таблетки по 1 мг. По 10 таблеток в блистере из ПВХ/ПВДХ/ал. фольги. 2 блистера вместе с инструкцией по применению в картонной пачке.

УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ

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

СРОК ГОДНОСТИ

3 года. Не использовать после даты, обозначенной на упаковке.

УСЛОВИЯ ОТПУСКА ИЗ АПТЕК

По рецепту.

ПРОИЗВОДИТЕЛЬ

Препарат производится по лицензии фирмы: Новартис Фарма А.О., Базель, Швейцария
ОАО Фармацевтический завод ЭГИС, 1106 Будапешт, ул. Керестури, 30-38 ВЕНГРИЯ
Телефон: (36-1)265-5555, Факс: (36-1)265-5529

Претензии направлять по адресу:

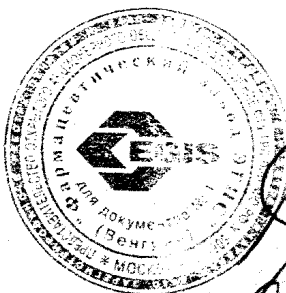
Представительство ОАО "Фармацевтический завод ЭГИС" (Венгрия) г. Москва
121108, г. Москва, ул. Ивана Франко д. 8, телефон: (495) 363-39-66

И.о. Директора



А.Н.Васильев

Представитель фирмы:



Е.В. Творогова