Атенолол



Код АТХ:

- C07AB03

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Атенолол

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 белого с сероватым или кремоватым оттенком цвета; допускается легкая "мраморность".

	1 таб.
атенолол	50 мг

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (5) - пачки картонные.

Таблетки белого или белого с сероватым или кремоватым оттенком цвета; допускается легкая "мраморность".

	1 таб.
атенолол	100 мг

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (5) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Вегетотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Оказывает антиангинальное, антигипертензивное и антиаритмическое действие. Не обладает мембраностабилизирующей и внутренней симпатомиметической активностью. Уменьшает стимулированное катехоламинами образование циклического аденозинмонофосфата (цАМФ) из аденозинтрифосфата (АТФ), снижает внутриклеточный ток Ca^{2+}. В первые 24 ч после перорального приема на фоне снижения сердечного выброса отмечается реактивное повышение общего периферического сопротивления сосудов, которое в течение 1-3 суток постепенно возвращается к исходному, а затем постепенно снижается. Гипотензивный эффект связан с уменьшением минутного объема крови, снижением активности ренин-ангиотензиновой системы, чувствительности барорецепторов и влиянием на центральную нервную систему. Гипотензивное действие проявляется как снижением систолического, так и диастолического артериального давления (АД), уменьшением ударного и минутного объемов

крови.

В средних терапевтических дозах не оказывает влияния на тонус периферических артерий. Гипотензивный эффект продолжается 24 ч, при регулярном применении стабилизируется к концу второй недели лечения.

Антиангинальный эффект определяется снижением потребности миокарда в кислороде в результате уменьшения частоты сердечных сокращений (удлинение диастолы и улучшение перфузии миокарда) и сократимости, а также снижением чувствительности миокарда к воздействию симпатической стимуляции. Урежает частоту сердечных сокращений (ЧСС) в покое и при физической нагрузке. За счет повышения конечного диастолического давления в левом желудочке и увеличения растяжения мышечных волокон желудочков может повышать потребность в кислороде, особенно у больных с хронической сердечной недостаточностью.

Антиаритмическое действие проявляется подавлением синусовой тахикардии и связано с устранением аритмогенных симпатических влияний на проводящую систему сердца, уменьшением скорости распространения возбуждения через синоатриальный узел и удлинением рефрактерного периода. Угнетает проведение импульсов в антеградном и в меньшей степени в ретроградном направлениях через AV (атриовентрикулярный) узел и по дополнительным путям проведения.

Отрицательный хронотропный эффект проявляется через 1 ч после приема, достигает максимума спустя 2-4 ч, продолжается до 24 ч.

Уменьшает автоматизм синусового узла, уряжает ЧСС, замедляет AV проводимость, снижает сократимость миокарда, снижает потребность миокарда в кислороде. Уменьшает возбудимость миокарда. При применении в средних терапевтических дозах оказывает менее выраженное влияние на гладкую мускулатуру бронхов и периферических артерий, чем неселективные бета-адреноблокаторы.

Увеличивает выживаемость больных, перенесших инфаркт миокарда (снижает частоту развития желудочковых аритмий и приступов стенокардии).

Практически не ослабляет бронходилатирующее действие изопротеренола.

В отличие от неселективных бета-адреноблокаторов при назначении в средних терапевтических дозах оказывает менее выраженное влияние на органы, содержащие бета$_2$-адренорецепторы (поджелудочная железа, скелетные мышцы, гладкая мускулатура периферических артерий, бронхов и матки), и на углеводный обмен; выраженность атерогенного действия не отличается от действия пропранолола. В меньшей степени оказывает отрицательный батмо-, хроно-, ино- и дромотропный эффект. При применении в больших дозах (более 100 мг/сут.) оказывает блокирующий эффект на оба подтипа бета-адренорецепторов.

Фармакокинетика

Абсорбция из ЖКТ - быстрая, неполная (50-60%), биодоступность - 40-50%, TC_{max} крови - 2-4 ч. Плохо проникает через гематоэнцефаличекий барьер, проходит в незначительных количествах через плацентарный барьер и в грудное молоко. Связь с белками плазмы крови - 6-16%. Практически не метаболизируется в печени. $T_{1/2}$ - 6-9 ч (увеличивается у пациентов пожилого возраста). Выводится почками путем клубочковой фильтрации (85-100% в неизмененном виде). Нарушение функции почек сопровождается удлинением $T_{1/2}$ и кумуляцией: при КК ниже 35 мл/мин/1.73 м^2 $T_{1/2}$ составляет 16-27 ч, при КК ниже 15 мл/мин/1.73 м^2 - более 27 ч (необходимо уменьшение доз). Выводится в ходе гемодиализа.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия;

— профилактика приступов стенокардии (за исключением стенокардии Принцметала);

— нарушения сердечного ритма: синусовая тахикардия, профилактика наджелудочковой тахиаритмии, желудочковая экстрасистолия.

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Желудочковая экстрасистолия
- Нарушения сердечного ритма
- Синусит
- Синусовая тахикардия
- Стенокардия
- Тахикардия
- Экстрасистолия

Противопоказания:

— кардиогенный шок;

— атриовентрикулярная (AV) блокада II-III ст.;

— выраженная брадикардия (ЧСС менее 40 уд./мин.);

— синдром слабости синусового узла;

— синоаурикулярная блокада;

— острая или хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации;

— кардиомегалия без признаков сердечной недостаточности;

— стенокардия Принцметала;

— артериальная гипотензия (в случае использования при инфаркте миокарда;

— систолическое АД менее 100 мм рт.ст.);

— период лактации;

— одновременный прием ингибиторов моноаминооксидазы (МАО);

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

— повышенная чувствительность к препарату.

С осторожностью: сахарный диабет, метаболический ацидоз, гипогликемия, аллергические реакции в анамнезе, хроническая обструктивная болезнь легких (в т.ч. эмфизема легких), AV блокада I степени, хроническая сердечная недостаточность (компенсированная), облитерирующие заболевания периферических сосудов ("перемежающаяся" хромота, синдром Рейно), феохромоцитома, печеночная недостаточность, хроническая почечная недостаточность, миастения, тиреотоксикоз, депрессия (в т.ч. в анамнезе), псориаз, пожилой возраст, беременность.

Способ применения и дозы:

Назначают внутрь перед едой, не разжевывая, запивая небольшим количеством жидкости.

Артериальная гипертензия. Лечение начинают с 50 мг атенолола 1 раз в сутки. Для достижения стабильного гипотензивного эффекта требуется 1 -2 недели приема. При недостаточной выраженности гипотензивного эффекта дозу повышают до 100 мг в один прием. Дальнейшее увеличение дозы не рекомендуется, так как оно не сопровождается усилением клинического эффекта.

При ишемической болезни сердца, тахисистолических нарушениях сердечного ритма - 50 мг 1 раз в сутки.

Стенокардия. Начальная доза составляет 50 мг в сутки. Если в течение недели не достигается оптимальный терапевтический эффект, увеличивают дозу до 100 мг в сутки.

Пациентам пожилого возраста и больным с нарушениями выделительной функции почек необходима коррекция режима дозирования.

При наличии **почечной недостаточности** рекомендуют коррекцию дозы в зависимости от клиренса креатинина. У больных с почечной недостаточностью при значениях клиренса креатинина выше 35 мл/мин./1,73м^2 (нормальные значения составляют 100-150 мл/мин./1,73 м^2) значительной кумуляции атенолола не происходит. Рекомендуются следующие максимальные дозы для больных с почечной недостаточностью:

Клиренс креатинина (мл/мин/1.73 м^2)	$T_{1/2}$ атенолола (ч)	Максимальная доза
15-35	16-27	50 мг в сутки или 100 мг через день
менее 15	более 27	50 мг через день или 100 мг 1 раз в 4 дня

Больным, находящимся на гемодиализе, атенолол назначают по 25 или 50 мг/сутки сразу после проведения каждого диализа, что необходимо проводить в стационарных условиях, так как может иметь место снижение АД.

У **пожилых пациентов** начальная однократная доза - 25 мг (может быть увеличена под контролем АД, ЧСС).

Повышение суточной дозы свыше 100 мг не рекомендуется, так как терапевтический эффект не усиливается, а вероятность развития побочных эффектов возрастает.

Побочное действие:

Сердечно-сосудистая система: развитие (усугубление) симптомов хронической сердечной недостаточности (отечность лодыжек, стоп; одышка), нарушение атриовентрикулярной проводимости, аритмии, брадикардия, выраженное снижение АД, сердцебиение, ослабление сократимости миокарда, ортостатическая гипотензия, проявления ангиоспазма (похолодание нижних конечностей, синдром Рейно), васкулит, боль в груди.

ЦНС: головокружение, снижение способности к концентрации внимания, снижение скорости реакции, сонливость или бессонница, депрессия, галлюцинации, повышенная утомляемость, головная боль, слабость, "кошмарные" сновидения, беспокойство, спутанность сознания или кратковременная потеря памяти, парестезии в конечностях (у больных с "перемежающейся" хромотой и синдромом Рейно), мышечная слабость, судороги.

ЖКТ: сухость во рту, тошнота, рвота, понос, боль в животе, запор или диарея, изменение вкуса.

Дыхательная система: диспноэ, бронхоспазм, апноэ, заложенность носа.

Гематологические реакции: тромбоцитарная пурпура, анемия (апластическая), тромбоз.

Эндокринная система: снижение потенции, снижение либидо, гипергликемия (у больных с инсулиннезависимым сахарным диабетом), гипогликемия (у больных, получающих инсулин), гипотиреоидное состояние.

Кожные реакции: крапивница, дерматиты, кожный зуд, фоточувствительность, усиление потоотделения, гиперемия кожи, обострение течения псориаза, обратимая алопеция.

Органы чувств: нарушение зрения, уменьшение секреции слезной жидкости, сухость и болезненность глаз, конъюнктивит.

Влияние на плод: внутриутробная задержка роста, гипогликемия, брадикардия. Лабораторные показатели: агранулоцитоз, лейкопения, повышение активности "печеночных" ферментов, гипербилирубинемия, тромбоцитопения (необычные кровотечения и кровоизлияния).

Прочие: боль в спине, артрапгия, синдром "отмены" (тахикардия, учащение приступов стенокардии, повышение АД и т.д.).

Частота побочных явлений возрастает при увеличении дозы препарата.

Передозировка:

Симптомы: выраженная брадикардия, AV блокада II-III степени, нарастание симптомов сердечной недостаточности, чрезмерное снижение АД, затруднение дыхания, бронхоспазм, головокружение, обморок, аритмия, желудочковая экстрасистолия, цианоз ногтей пальцев или ладоней, судороги.

Лечение: промывание желудка и назначение адсорбирующих лекарственных средств; при возникновении бронхоспазма показано ингаляционное или внутривенное введение бета$_2$-адреномиметика сальбутамола. При нарушении AV проводимости, брадикардии - в/в введение 1-2 мг атропина, эпинефрина или постановка временного кардиостимулятора; при желудочковой экстрасистолии - лидокаин (препараты 1А класса не применяются); при снижении АД - больной должен находиться в положении Тренделенбурга. Если нет признаков отека легких - в/в плазмозамещающие растворы, при неэффективности - введение эпинефрина, допамина, добутамина; при хронической сердечной недостаточности - сердечные гликозиды, диуретики, глюкагон; при судорогах - в/в диазепам. Возможно проведение диализа.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Атенолол проникает через плацентарный барьер и обнаруживается в пуповинной крови. Исследований по применению атенолола в первом триместре не проводилось и, поэтому, нельзя исключить возможность повреждающего действия на плод. Для лечения артериальной гипертензии в третьем триместре беременности препарат применяется под тщательным врачебным контролем. Применение атенолола при беременности может быть причиной нарушения роста плода.

Назначать атенолол беременным или планирующим беременность женщинам, следует только в тех случаях, когда польза для матери превышает потенциальный риск для плода, особенно в первом и втором триместре беременности, так как бета-адреноблокаторы снижают уровень плацентарной перфузии, что может привести к внутриутробной

гибели плода или его незрелости и преждевременным родам. Кроме того, такие побочные эффекты, как гипогликемия и брадикардия, могут наблюдаться как у плода, так и у новорожденного.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении атенолола с инсулином, гипогликемическими средствами для приема внутрь - их гипогликемизирующее действие усиливается. При совместном применении с антигипертензивными средствами разных групп или нитратов происходит усиление гипотензивного действия. Одновременное применение атенолола и верапамила (или дилтиазема) может вызвать взаимное усиление кардиодепрессивного действия.

Гипотензивный эффект ослабляют эстрогены (задержка натрия) и нестероидные противовоспалительные препараты, глюкокортикостероиды. При одновременном применении атенолола и сердечных гликозидов повышается риск развития брадикардии и нарушения атриовентрикулярной проводимости.

При одновременном назначении атенолола с резерпином, метилдопой, клонидином, верапамилом возможно возникновение выраженной брадикардии.

Одновременное в/в введение верапамила и дилтиазема может спровоцировать остановку сердца; нифедипин может приводить к значительному снижению АД. При одновременном приеме атенолола с производными эрготамина, ксантина, эффективность его снижается.

При прекращении комбинированного применения атенолола и клонидина лечение клонидином продолжают еще несколько дней после отмены атенолола.

Одновременное применение с лидокаином, может уменьшить его выведение и повысить риск токсического действия лидокаина.

Применение совместно с производными фенотиазина, способствует повышению концентрации каждого из препаратов в сыворотке крови.

Фенитоин при в/в введении, лекарственные средства для общей анестезии (производные углеводородов) повышают выраженность кардиодепрессивного действия и вероятность снижения АД.

При совместном применении с эуфиллином и теофиллином, возможно взаимное подавление терапевтических эффектов.

Не рекомендуется одновременное применение с ингибиторами МАО вследствие значительного усиления гипотензивного действия, перерыв в лечении между приемом ингибиторов МАО и атенолола должен составлять не менее 14 дней.

Аллергены, используемые для иммунотерапии, или экстракты аллергенов для кожных проб повышают риск возникновения тяжелых системных аллергических реакций или анафилаксии.

Средства для ингаляционного наркоза (производные углеводородов) повышают риск угнетения функции миокарда и развития артериальной гипертензии. Амиодарон повышает риск развития брадикардии и угнетения AV проводимости. Циметидин увеличивает концентрацию в плазме крови (тормозит метаболизм). Йодсодержащие рентгеноконтрастные средства для в/в введения повышают риск развития анафилактических реакций.

Удлиняет действие недеполяризующих миорелаксантов и антикоагулянтный эффект кумаринов.

Три- и тетрациклические антидепрессанты, антипсихотические средства (нейролептики), этанол, седативные и снотворные средства усиливают угнетение центральной нервной системы.

Негидрированные алкалоиды спорыньи повышают риск развития нарушений периферического кровообращения.

Особые указания и меры предосторожности:

Контроль за больными, принимающими атенолол, должен включать наблюдение за ЧСС и АД (в начале лечения - ежедневно, затем 1 раз в 3-4 мес), содержанием глюкозы крови у больных сахарным диабетом (1 раз в 4-5 мес). У пожилых пациентов рекомендуется следить за функцией почек (1 раз в 4-5 мес).

Следует обучить больного методике подсчета ЧСС и проинструктировать о необходимости врачебной консультации при ЧСС менее 50 уд./мин. При тиреотоксикозе атенолол может маскировать определенные клинические признаки тиреотоксикоза (например, тахикардию). Резкая отмена у больных с тиреотоксикозом противопоказана, поскольку способна усилить симптоматику. При сахарном диабете может маскировать тахикардию, вызванную гипогликемией. В отличие от неселективных бета-адреноблокаторов практически не усиливает вызванную инсулином гипогликемию и не задерживает восстановление содержания глюкозы в крови до нормальной концентрации.

У больных с ишемической болезнью сердца (ИБС) резкая отмена бета-адреноблокаторов может вызывать увеличение

частоты или тяжести ангинальных приступов, поэтому прекращение приема атенолола у больных ИБС необходимо проводить постепенно.

По сравнению с неселективными бета-адреноблокаторами, кардиоселективные бета-адреноблокаторы обладают меньшим воздействием на функцию легких, тем не менее, при обструктивных заболеваниях дыхательных путей атенолол назначают только в случае абсолютных показаний. При необходимости их назначения в некоторых случаях можно рекомендовать применение бета$_2$-адреномиметиков.

Больным с бронхоспастическими заболеваниями можно назначать кардиоселективные адреноблокаторы в случае непереносимости и/или неэффективности других гипотензивных лекарственных средств, но при этом следует строго следить за дозировкой. Передозировка опасна развитием бронхоспазма.

Особое внимание необходимо в случаях, если требуется хирургическое вмешательство под наркозом у больных, принимающих атенолол. Прием препарата следует прекратить за 48 часов до вмешательства. В качестве анестетика следует выбирать препарат с возможно минимально отрицательным инотропным действием.

При одновременном применении атенолола и клонидина прием атенолола прекращают на несколько дней раньше клонидина с целью избежания симптома отмены последнего. Возможно усиление выраженности реакции повышенной чувствительности и отсутствие эффекта от обычных доз эпинефрина на фоне отягощенного аллергологического анамнеза.

Лекарственные средства, снижающие запасы катехоламинов (например, резерпин), могут усилить действие бета-адреноблокаторов, поэтому больные, принимающие такие сочетания лекарственных средств, должны находиться под постоянным наблюдением врача на предмет выявления выраженного снижения АД или брадикардии.

В случае появления у больных пожилого возраста нарастающей брадикардии (менее 50уд./мин), артериальной гипотензии (систолическое АД ниже 100 мм рт.ст,), атриовентри-кулярной блокады, бронхоспазма, желудочковых аритмий, тяжелых нарушений функции печени и почек необходимо уменьшить дозу или прекратить лечение.

Рекомендуется прекращать терапию при развитии депрессии, вызванной приемом бета-адреноблокаторов.

В случае необходимости внутривенного введения верапамила это следует делать через не менее 48 часов после приема атенолола.

При применении атенолола возможно уменьшение продукции слезной жидкости, что имеет значение у пациентов, пользующихся контактными линзами.

Нельзя резко прерывать лечение из-за опасности развития тяжелых аритмий и инфаркта миокарда. Отмену проводят постепенно, снижая дозу в течение 2 нед. и более (снижают дозу на 25% в 3-4 дня).

Следует отменять перед исследованием содержания в крови и моче катехоламинов, норметанефрина и ванилилминдальной кислоты; титров антинуклеарных шггител. У курильщиков эффективность бета-адрсноблокаторов ниже. Беременность и период кормления грудью.

Беременным следует назначать атенолол только в тех случаях, когда польза для матери превышает потенциальный риск для плода. Атенолол выделяется с грудным молоком, поэтому если в период кормления грудью препарат показан, то лучше на время прекратить грудное вскармливание.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения необходимо воздержаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Применять с осторожностью при хронической почечной недостаточности.

При нарушениях функции печени

Применять с осторожностью при печеночной недостаточности.

Применение в пожилом возрасте

Назначать с осторожностью пожилым пациентам.

Применение в детском возрасте

Противопоказан детям до 18 лет.

Условия хранения:

Список Б. В сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25°С. Хранить в местах, недоступных для детей.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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