Эстекор



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки белого цвета, круглые, двояковыпуклые, со скошенной кромкой, ровные с двух сторон.

	1 таб.
эсатенолол	12.5 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая - 100.5 мг, крахмал прежелатинизированный - 15 мг, кремния диоксид коллоидный - 1 мг, карбоксиметилкрахмал натрия - 9 мг, магния стеарат - 2 мг.

14 шт. - стрипы алюминиевые (2) - пачки картонные.

Таблетки белого цвета, круглые, двояковыпуклые, со скошенными краями и риской с одной стороны.

	1 таб.
эсатенолол	25 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая - 85.5 мг, крахмал прежелатинизированный - 15 мг, кремния диоксид коллоидный - 3 мг, карбоксиметилкрахмал натрия - 9 мг, магния стеарат - 2.5 мг.

14 шт. - стрипы алюминиевые (2) - пачки картонные.

Таблетки светло-оранжевого цвета, круглые, с риской с одной стороны.

	1 таб.
эсатенолол	50 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая - 110.7 мг, крахмал прежелатинизированный - 90 мг, кремния диоксид коллоидный - 2.5 мг, карбоксиметилкрахмал натрия - 10 мг, магния стеарат - 2.5 мг, натрия лаурилсульфат - 2.5 мг, крахмал - 1.5 мг, краситель солнечный закат желтый - 300 мкг.

14 шт. - стрипы алюминиевые (2) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Атенолол – это рацемическая смесь двух оптических форм изомеров R(+) и S(-), соотношение которых в рацемическом атенололе равно 1:1. S(-) атенолол – хирально очищенная форма атенолола.

S(-) атенолол – кардиоселективный β-адреноблокатор. Действие S(-)атенолола на эндокринную систему и метаболизм заключается в снижении активности ренин-ангиотензиновой системы и концентрации свободных жирных кислот в плазме крови. S(-) атенолол высоко гидрофилен, в отличие от других β-адреноблокаторов, проявляющих липофильные свойства. Это может являться причиной проявления низкой доли побочных эффектов со стороны ЦНС. Кроме того, селективный β-адреноблокатор S(-)атенолол в меньшей степени вызывает пролонгацию действия инсулина, которая является причиной гипогликемии, в отличие от неселективных β-блокаторов.

S(-) атенолол урежает частоту сердечных сокращений (ЧСС) и снижает сократимость миокарда, что позволяет снизить появление симптомов стенокардии.

Результаты клинических исследований показали, что только S(-) энантиомер способен блокировать β-рецептор, а R(+) энантимер не проявляет блокирующей активности в отношении рецепторов. Отсюда следует, что доза S(-) атенолола (25 мг) снижается в два раза в сравнении с рацемическим атенололом (50 мг).

Сравнительное исследование рацемического атенолола, S(-) атенолола и R(+) атенолола показало, что рацемический атенолол и S(-) атенолол в одинаковой степени снижают систолическое и диастолическое АД и ЧСС, в то время как и R(+) атенолол не вносил никаких изменений в эти параметры.

Гемодинамический эффект рацемического атенолола (100 мг) аналогичен по интенсивности S(-) атенололу в дозе меньшей в два раза (50 мг), в то время как R-изомер не вызывает каких-либо изменений показателей при дозировке 50 мг.

Сродство S(-) атенолола к β-адренорецепторам явно выше, чем у R(+) атенолола. Также было доказано, что только S(-) атенолол отвечает за отрицательный хроно- и инотропный эффекты, а R-изомер не влияет на эти параметры.

Фармакокинетика

S(-) атенолол хорошо абсорбируется после приема внутрь, метаболизируется при "первичном прохождении" через печень. Поскольку препарат гидрофилен, то при приеме внутрь абсорбция неполная, но быстрая. Значение C_{max} – 781.81 мг/мл, которая достигает своего значения через три часа (T_{Cmax}). $AUC_{0-\infty}$ - 4513.88 нг*ч/мл. $T_{1/2}$ – 4.02 ч.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия;

— профилактика приступов стенокардии (за исключением стенокардии Принцметала);

— нарушения сердечного ритма.

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Нарушения сердечного ритма
- Стенокардия

Противопоказания:

— повышенная чувствительность к S(-) Атенололу или рацемическому атенололу;

— кардиогенный шок;

— атриовентрикуляция (AV) блокада II-IIIст.;

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

— синдром слабости синусового узла;

— синоартриальная блокада;

— острая сердечная недостаточность (СН) или хроническая сердечная недостаточность (ХСН) в стадии декомпенсации;

— кардиомегалия без признаков ХСН;

— стенокардия Принцметала;

— артериальная гипотензия (в случае использования при инфаркте миокарда;

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

— различные нарушения периферического артериального кровообращения;

— одновременный прием ингибиторов моноаминооксидазы (МАО);

— беременность и период лактации.

С осторожностью: сахарный диабет, метаболический ацидоз, гипогликемия; аллергические реакции в анамнезе; хроническая обструктивная болезнь легких (в т.ч. бронхиальная астма, эмфизема легких); ХСН (компенсированная), облитерирующие заболевания периферических сосудов ("перемежающаяся" хромота, синдром Рейно); феохромоцитома, печеночная недостаточность, хроническая почечная недостаточность, миастения, тиреотоксикоз, депрессия (в т.ч. в анамнезе), псориаз, беременность, пожилой возраст, возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не определены).

Способ применения и дозы:

Способ применения и дозы

Внутрь, перед приемом пищи, не разжевывая и запивая небольшим количеством жидкости.

Артериальная гипертензия. Лечение начинают с 12,5 мг Эстекора 1 раз/сут. Для достижения стабильного гипотензивного эффекта требуется 1-2 недели приема. При недостаточной выраженности гипотензивного эффекта дозу повышают до 25 или 50 мг 1 раз/сут. Дальнейшее увеличение дозы не рекомендуется, так как оно не сопровождается усилением клинического эффекта.

Нарушения сердечного ритма и профилактика приступов стенокардии. Начальная доза составляет 12.5 мг/сут. Если в течение недели не достигается оптимальный терапевтический эффект, увеличивают дозу до 25 или 50 мг в сутки. Пациентам пожилого возраста и больным с нарушением выделительной функции почек необходима коррекция режима дозирования.

У **пожилых пациентов** начальная однократная доза – 12.5 мг (может быть увеличена под контролем АД, ЧСС).

Повышение суточной дозы свыше 50 мг не рекомендуется, так как терапевтичекий эффект не усиливается, а вероятность развития побочных эффектов возрастает.

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

Побочное действие:

Со стороны нервной системы: астения, слабость, головокружение, головная боль, сонливость или бессонница, кошмарные сновидения, депрессия, беспокойство, спутанность сознания или кратковременная потеря памяти, галлюцинации, снижение способности к концентрации внимания, снижение скорости реакции, парестезии в конечностях (у больных с "перемежающейся" хромотой и синдромом Рейно), васкулит, боль в груди.

Со стороны пищеварительной системы: сухость рта, тошнота, рвота, боль в животе, запоры или диарея, изменения вкуса.

Со стороны дыхательной системы: заложенность носа, затруднения дыхания при назначении в высоких дозах (утрата селективности) и/или у предрасположенных пациентов– ларинго- и бронхоспазм.

Со стороны эндокринной системы: гипергликемия (у больных инсулиннезависимым сахарным диабетом), гипогликемия (у больных, получающих инсулин), гипотиреоидное состояние.

Аллергические реацкии: зуд, сыпь, крапивница.

Со стороны кожных покровов: усиление потоотделения, гиперемия кожи, обострение симптомов псориаза, псориазоподобные кожные высыпания, обратимая алопеция.

Лабораторные показатели: тромбоцитопения (необычные кровотечения и кровоизлияния), агранулоцитоз, лейкопения, повышение активности «печеночных» ферментов, гипербилирубинемия.

Влияние на плод: внутриутробная задержка роста, гипогликемия, брадикардия.

Прочие: боль в спине, артралгия, ослабление либидо, снижение потенции, синдром "отмены" (усиление приступов стенокардии, повышение АД).

Частота побочных явлений возрастает при увеличении дозы препарата.

Передозировка:

Симптомы: выраженная брадикардия, головокружение, чрезмерное снижение АД, обморочные состояния, аритмия, желудочковая экстрасистолия, AV-блокада II-III ст., ХСН, цианоз ногтей, пальцев или ладоней, судороги, затруднение

дыхания, бронхоспазм.

Лечение: промывание желудка и назначение адсорбирующих лекарственных средств; при нарушении AVпроводимости и/или брадикардии – в/в введение 1-2 мг атропина, эпинефрина или постановка временного кардиостимулятора; при желудочковой экстрасистолии – лидокаин (препараты IA класса не применяются); при снижении АД – больной должен находиться в положении Тренделенбурга. Если нет признака 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; при бронхоспазме – ингаляционно или парантерально – бета-адреностимуляторы. Возможно проведение гемодиализа или гемоперфузии.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат противопоказан во время беременности и в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

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

Йодсодержащие рентгеноконтрастные лекарственные средства (ЛС) для в/в введения повышают риск развития анафилактических реакций.

Фенитоин при в/в введении, ЛС для ингаляционной общей анастезии (производные углеводородов) повышают выраженность кардиодепрессивного действия и вероятность снижения АД.

При одновременном назначении с инсулином и пероральными гипогликемическими лекарственными средствами маскирует симптомы развивающейся гипогликемии.

Снижает клиренс лидокаина и ксантинов (кроме дипрофиллина) и повышает их концентрацию в плазме крови, особенно у больных с исходно повышенным клиренсом теофиллина под воздействием курения.

Гипотензивный эффект ослабляют нестероидные противовоспалительные препараты (задержка Na+ и блокада синтеза Pg почками), глюкокортикостероиды и эстрогены (задержка Na+).

Сердечные гликозиды, метилдопа, резерпин и гуанфацин, блокаторы "медленных" кальциевых каналов (верапамил, дилтиазем), амиодарон и другие антиаритмические лекарственные средства повышают риск развития или усугубления сердечной недостаточности, брадикардии, AV-блокады или остановки сердца.

Диуретики, клонидин, симпатолитки, гидралазин, БМКк и другие гипотензивные средства могут привести к чрезмерному снижению АД.

Удлиняет действие недополяризующих миорелаксантов и антикоагулянтный эффект кумаринов.

Три- и тетрациклические антидепрессанты, антипсихотические лекарственные средства (нейролептики), этанол, седативные и снотворные средства усиливают угнетение ЦНС.

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

Негидрированные алкалоиды спорыньи повышают риск развития нарушений периферического кровообращения.

Особые указания и меры предосторожности:

Контроль за больными, принимающими Эстекор, должен включать наблюдение за ЧСС и АД (в начале лечения – ежедневно, затем – 1 раз в 3-4 мес), содержанием глюкозы в крови у больных сахарным диабетом (1 раз в 4-5 мес). У пожилых пациентов рекомендуется следить за фенкцией 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. Примерно у 20% больных стенокардией β-адреноблокаторы неэффективны. Основные причины – тяжелый коронарный атеросклероз с низким порогом ишемии (ЧСС менее 100 уд./мин) и повышенный конечно-диастолический объем левого желудочка (КДО ЛЖ), нарушающий субэндокардиальный кровоток.

У курильщиков эффективность бета-адреноблокаторов ниже.

Больные, пользующиеся контактными линзами, должны учитывать, что на фоне лечения возможно уменьшение продуцкции слезной жидкости.

При тиреотоксикозе Эстекор 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.

При одновременном приеме клонидина его прием может быть прекращен только через несколько дней после отмены Эстекора.

Возможно усиление выраженности аллергической реакции и отсутствие эффекта от обычных доз эпинефрина на фоне отягощенного аллергологического анамнеза.

За несколько дней перед проведением общей анестезии хлороформом или эфиром необходимо прекратить прием препарата. Если больной принял препарат перед операцией, ему следует подобрать лекарственное средство для общей анестезии с минимальным отрицательным инотропным действием. Реципрокную активацию n.vagus можно устранить в/в введением атропина (1-2 мг).

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

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

В случае появления у больных пожилого возраста нарастающей брадикардии (менее 50 уд./мин), артериальной гипотензии (систолическое АД ниже 100 мм рт.ст.), AV-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. Нельзя резко прерывать лечение из-за опасности развития тяжелых аритмий и инфаркта миокарда. Отмену производят постепенно, снижая дозу в течение 2 нед. и более (снижают дозу на 25% в 3-4 дня).

Следует отменять перед исследование содержания в крови и моче катехоламинов, норметанефрина и ванилилминдальной кислоты; титров антинуклеарных антител.

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Следует регулировать дозу препарата при заболеваниях почек.

При нарушениях функции почек

С осторожностью применять при хронической почечной недостаточности.

При нарушениях функции печени

С осторожностью применять при печеночной недостаточности.

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью применять пациентам пожилого возраста.

Применение в детском возрасте

С осторожностью применять у детей младше 18 лет.

Условия хранения:

В сухом защищенном от света месте при температуре не выше 25 ?С.

Хранить в недоступном для детей месте!

Не использовать по истечении срока годности.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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