Корданум



Код АТХ:

- C07AB13

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Талинолол

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

Селективный блокатор β_1-адренорецепторов без внутренней симпатомиметической активности. В очень высоких дозах может блокировать β_2-адренорецепторы. Не обладает мембраностабилизирующими свойствами. Оказывает антиангинальное, антигипертензивное и антиаритмическое действие. Уменьшает стимулированное катехоламинами образование цАМФ из АТФ, снижает внутриклеточный ток кальция, уменьшает ЧСС, угнетает проводимость, снижает сократимость миокарда. В первые 24 ч после первого приема отмечается уменьшение минутного объема крови и реактивное повышение ОПСС, выраженность последнего в течение 1-3 сут постепенно снижается.

Антиангинальный эффект обусловлен уменьшением потребности миокарда в кислороде в результате урежения ЧСС и снижения сократимости. Уменьшение ЧСС приводит к удлинению диастолы и улучшению перфузии миокарда. 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.

Гипотензивный эффект обусловлен ингибированием пресинаптических бета-адренорецепторов терминалей нейронов, а также уменьшением активности ренин-ангиотензиновой системы; стабилизируется к концу 2 недели лечения.

Антиаритмический эффект определяется угнетением проведения импульсов в антеградном и в меньшей степени в ретроградном направлениях через AV узел и по дополнительным путям. Снижает концентрацию норэпинефрина, препятствует усилению синтеза ренина, прерывая взаимную активацию ренин-ангиотензин-альдостероновой и симпатоадреналовой систем. Снижает смертность и частоту рецидивов при остром инфаркте миокарда за счет уменьшения зоны некроза и частоты возникновения нарушений ритма.

При применении в средних терапевтических дозах оказывает менее выраженное влияние на гладкую мускулатуру бронхов и периферических артерий и на липидный обмен, чем неселективные бета-адреноблокаторы. Время

наступления эффекта - 2-4 ч, длительность - до 24 ч.

Фармакокинетика

После приема внутрь абсорбция из ЖКТ составляет 50-70%. Абсолютная биодоступность - 55±15%. После приема 50 мг талинолола C_{max} в плазме составляет 168±67 нг/мл и достигается через 3.2±0.8 ч. AUC - 1321±382 нг х ч/мл. Одновременный прием пищи замедляет скорость абсорбции и уменьшает уровень C_{max} в плазме. После в/в введения 30 мг талинолола C_{max} в плазме составляет 631±95 нг/мл, AUC - 1433±153 нг х ч/мл. Связывание с белками плазмы составляет 60%. V_d - 3.3±0.5 л/кг. Биотрансформируется незначительно (<1%).

$T_{1/2}$ после приема внутрь составляет 11.9±2.4 ч, после в/в введения - 10.6±3.3 ч. Около 60% неизмененного талинолола выводится с мочой, 40% - с желчью и калом.

Показания к применению:

ИБС, стенокардия, инфаркт миокарда (в т.ч. вторичная профилактика); артериальная гипертензия, гипертонический криз (гиперкинетический вариант); нарушения ритма (в т.ч. при общей анестезии, при пролапсе митрального клапана, врожденном синдроме удлиненного интервала QT, инфаркте миокарда без признаков сердечной недостаточности, тиреотоксикозе): синусовая тахикардия, пароксизмальная предсердная тахикардия, наджелудочковая и желудочковая экстрасистолия, наджелудочковая тахикардия; феохромоцитома (только вместе с альфа-адреноблокаторами); абстинентный синдром, мигрень (профилактика), тремор; гиперкинетический кардиальный синдром функционального генеза.

Относится к болезням:

- Абстинентный синдром
- Анестезия
- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Гипертонический криз
- Гипертония
- Желудочковая экстрасистолия
- Инфаркт миокарда
- Кардит
- Мигрень
- Миокардит
- Пароксизм
- Сердечная недостаточность
- Синусит
- Синусовая тахикардия
- Стенокардия
- Тахикардия
- Тиреотоксикоз
- Тремор
- Феохромоцитома
- Экстрасистолия

Противопоказания:

Кардиогенный шок, AV блокада II-III ст., выраженная брадикардия (ЧСС менее 40 уд./мин), СССУ, синоатриальная блокада, AV блокада II-III ст., острая сердечная недостаточность или декомпенсированная хроническая сердечная недостаточность, кардиомегалия без признаков сердечной недостаточности, острый инфаркт миокарда (осложненный брадикардией, артериальной гипотензией или левожелудочковой недостаточностью), стенокардия Принцметала, феохромоцитома (без одновременного применения альфа-адреноблокаторов), артериальная гипотензия (в случае применения при инфаркте миокарда, систолическое АД менее 100 мм рт.ст.), одновременный прием ингибиторов МАО (за исключением ингибиторов МАО типа В), период лактации, повышенная чувствительность к талинололу.

Способ применения и дозы:

Устанавливают индивидуально, в зависимости от показаний и тяжести течения заболевания. При приеме внутрь суточная доза составляет 50-300 мг, кратность приема - 1-2 раза/сут.

При в/в введении разовая доза - 10 мг, частота введения зависит от клинической ситуации.

Максимальные дозы: при приеме внутрь - 300 мг/сут, при в/в введении - 60 мг/сут.

Побочное действие:

Со стороны нервной системы: тревожность, слабость, головокружение, головная боль, сонливость или бессонница, кошмарные сновидения, депрессия, беспокойство, спутанность сознания, галлюцинации, ослабление способности к концентрации внимания, снижение скорости реакции, парестезии в конечностях (у больных с перемежающейся хромотой и синдромом Рейно), миастения (обычно усиление уже имевшейся), судороги.

Со стороны органов чувств: нарушение зрения, уменьшение секреции слезной жидкости, сухость и болезненность глаз, конъюнктивит.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: брадикардия, сердцебиение, нарушение проводимости миокарда, AV блокада (вплоть до остановки сердца), аритмии, ослабление сократимости миокарда, развитие (усугубление) хронической сердечной недостаточности, ортостатическая гипотензия, проявления ангиоспазма (похолодание нижних конечностей, синдром Рейно), боль в груди.

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

Со стороны дыхательной системы: заложенность носа, затруднение 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).

Дерматологические реакции: усиление потоотделения, гиперемия кожи, обострение симптомов псориаза, псориазоподобные кожные высыпания, обратимая алопеция.

Со стороны системы кроветворения: тромбоцитопения (необычные кровотечения и кровоизлияния), агранулоцитоз, лейкопения.

Прочие: боль в грудной клетке, ослабление либидо, снижение потенции, синдром отмены (усиление приступов стенокардии, повышение АД).

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение талинолола при беременности возможно только по жизненным показаниям.

Следует иметь в виду, что талинолол может вызывать у плода гипогликемию, брадикардию, внутриутробную задержку роста.

При необходимости применения талинолола в период лактации грудное вскармливание следует прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с антигипертензивными средствами усиливается гипотензивный эффект.

При одновременном применении возможно усиление действия гипогликемических, психотропных средств и этанола.

При одновременном применении усиливаются отрицательные хронотропный и дромотропный эффекты сердечных гликозидов; усиливаются кардиодепрессивные эффекты антиаритмических средств класса I A.

При одновременном применении с алкалоидами спорыньи (особенно негидрированными) повышается риск развития нарушений периферического кровообращения.

При одновременном применении с верапамилом, дилтиаземом (особенно в/в формы) возможно усиление кардиодепрессивного действия талинолола.

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

При одновременном применении с резерпином, метилдиоксифенилаланином возможно усиление брадикардии.

При одновременном применении с сульфасалазином отмечено значительное уменьшение концентрации талинолола в крови.

При одновременном применении с эритромицином возможно повышение концентрации талинолола в плазме крови.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применять при сахарном диабете (особенно лабильного течения), метаболическом ацидозе, ХОБЛ (в т.ч. при бронхиальной астме, эмфиземе легких); AV блокаде I степени, хронической сердечной недостаточности (компенсированная), облитерирующих заболеваниях периферических сосудов (перемежающаяся хромота, синдром Рейно); при печеночной недостаточности, хронической почечной недостаточности, при миастении, тиреотоксикозе, депрессии (в т.ч. в анамнезе), при псориазе, возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не определены), возраст старше 60 лет.

Лечение следует прекращать постепенно, в течение 1-2 недель, во избежание развития синдрома отмены.

При употреблении алкоголя на фоне терапии талинололом возможно замедление скорости психомоторных реакций, связанное со снижением АД.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

При применении талинолола, особенно в начале лечения и при смене препарата, возможно замедление скорости психомоторных реакций, связанное со снижением АД. Это следует учитывать пациентам, занимающимся потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания и быстроты психомоторных реакций.

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 в возрасте старше 60 лет.

Применение в детском возрасте

С осторожностью применять в возрасте до 18 лет (эффективность и безопасность не определены).

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