# Небикор Адифарм



## Полезные ссылки:

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

## Форма выпуска:

***Таблетки*** круглые, двояковыпуклые, белого цвета с крестообразной риской.

| | **1 таб.** |
|---|---|
| небиволол (в форме гидрохлорида) | 5 мг |

*Вспомогательные вещества:* лактозы моногидрат, кросповидон, полоксамер, повидон, целлюлоза микрокристаллическая, магния стеарат.

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

## Фармакологические свойства:

***Фармакодинамика***

Небиволол является липофильным, кардиоселективным бета1-адреноблокатором третьего поколения с вазодилатирующими свойствами. Оказывает гипотензивное, антиангинальное и антиаритмическое действие. Снижает повышенное АД в покое, при физическом напряжении и стрессе. Конкурентно и избирательно блокирует синаптические и постсинаптические бета1-адренорецепторы, делая их недоступными для катехоламинов, модулирует высвобождение эндотелиального вазодилатирующего фактора оксида азота (NO). Небиволол представляет собой рацемат, состоящий из двух энантиомеров: SRRR- небиволола (D-небиволола) и RSSS-небиволола (L-небиволола), сочетающий два фармакологических действия:

— D-небиволол является конкурентным и высокоселективным блокатором бета1-адренорецепторов (сродство к бета1-адренорецепторам в 293 раза выше, чем к бета2-адренорецепторам).

— L-небиволол оказывает мягкое сосудорасширяющее действие за счет модуляции высвобождения релаксирующего фактора (NO) из эндотелия сосудов. Гипотензивный эффект развивается на 2-5 день лечения, стабильное действие отмечается через 1 месяц. Данный эффект сохраняется при длительном лечении. Гипотензивное действие обусловлено также уменьшением активности ренин-ангиотензин-альдостероновой системы (прямо не коррелирует с изменением активности ренина в плазме крови).

Применение небиволола улучшает показатели системной и внутрисердечной гемодинамики. Небиволол урежает частоту ЧСС и АД в покое и при физической нагрузке, уменьшает конечное диастолическое давление левого желудочка, снижает общее периферическое сосудистое сопротивление, улучшает диастолическую функцию сердца (снижает давление наполнения), увеличивает фракцию выброса.

Снижая потребность миокарда в кислороде (урежение ЧСС, снижение преднагрузки и постнагрузки), уменьшает количество и тяжесть приступов стенокардии и улучшает переносимость физической нагрузки. Антиаритмическое действие обусловлено подавлением автоматизма сердца (в т.ч. в патологическом очаге) и замедлением атриовентрикулярной (AV) проводимости.

***Фармакокинетика***

После приема внутрь небиволол быстро абсорбируется из желудочно-кишечного тракта. Прием пищи не влияет на всасывание препарата, поэтому небиволол можно принимать независимо от приема пищи.

Биодоступность составляет в среднем 12% у пациентов с «быстрым» метаболизмом и является почти полной у пациентов с «медленным» метаболизмом. Эффективность небиволола не зависит от скорости метаболизма. Клиренс в плазме крови у большинства пациентов (с «быстрым» метаболизмом) достигается в течение 24 ч, а для гидроксиметаболитов - через несколько суток. Концентрации в плазме крови 1-30 мкг/л пропорциональны дозе.

Связь с белками плазмы крови (преимущественно с альбумином) для D- небиволола составляет 98.1%, а для L-небиволола – 97.9%.

Небиволол активно метаболизируется, частично с образованием активных гидроксиметаболитов. Скорость метаболизма небиволола путем ароматического гидроксилирования генетически определена окислительным полиморфизмом и зависит от изофермента CYP2D6.

После введения 38% (количество неизмененного активного вещества составляет менее 0.5%) дозы выводится почками и 48% - через кишечник. У пациентов с «быстрым» метаболизмом значения $T_{1/2}$ энантиомеров небиволола из плазмы крови составляют в среднем 10 ч. У пациентов с «медленным» метаболизмом эти значения в 3-5 раз увеличиваются. У пациентов с «быстрым» метаболизмом значения $T_{1/2}$ гидроксиметаболитов обоих энантиомеров из плазмы крови составляют в среднем 24 ч, у пациентов с «медленным» метаболизмом эти значения приблизительно в 2 раза увеличиваются.

На фармакокинетику небиволола не влияет возраст и пол пациентов.

## Показания к применению:

Артериальная гипертензия; ИБС; хроническая сердечная недостаточность (в качестве дополнительного средства к стандартной терапии диуретиками, сердечными гликозидами, ингибиторами ангиотензин-превращающего фермента (АПФ), антагонистами рецепторов ангиотензина II).

## Относится к болезням:

- Ангина
- Гипертензия
- Сердечная недостаточность

## Противопоказания:

— повышенная чувствительность к небивололу или вспомогательным веществам;

— выраженные нарушения функции печени;

— острая сердечная недостаточность;

— кардиогенный шок;

— хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации (требующая проведения инотропной терапии);

— синдром слабости синусного узла, включая синоатриальную блокаду;

— AV блокада II и III степени (без искусственного водителя ритма);

— бронхоспазм и бронхиальная астма;

— депрессия;

— метаболический ацидоз;

— выраженная брадикардия (ЧСС менее 50 уд./мин);

— артериальная гипотензия;

— тяжелые выраженные нарушения периферического кровообращения («перемежающаяся» хромота, синдром Рейно);

— непереносимость лактозы, дефицит лактазы или глюкозо-галактозная мальсорбция (препарат содержит лактозу);

— феохромоцитома (без одновременного применения альфа-адреноблокаторов);

— возраст до 18 лет;

— период лактации;

— одновременный прием с флоктафенином, сультопридом.

*С осторожностью.* Выраженная почечная недостаточность (клиренс креатинина (КК) менее 20 мл/мин), нарушение функции печени, сахарный диабет, гипертиреоза, проведение десенсибилизирующей терапии, псориаз, AV блокада I степени, стенокардия Принцметала, хроническая обструктивная болезнь легких (ХОБЛ), пациенты пожилого возраста (старше 65 лет).

## Способ применения и дозы:

Таблетки принимают внутрь в одно и то же время суток независимо от приема пищи, таблетки можно делить пополам и на четыре одинаковые части (но не разжевывать) и запивать жидкостью.

*Артериальная гипертензия.* Средняя суточная доза составляет 5 мг (1 таблетка) в один прием. Оптимальный эффект становится выраженным через 1-2 недели лечения, а в ряде случаев - через 4 недели. Возможно применение препарата в монотерапии или в составе комбинированной терапии.

При необходимости суточную дозу можно увеличить до 10 мг (2 таблетки) за один прием. Максимальная суточная доза - 10 мг.

*У больных с почечной недостаточностью, а также у пациентов в возрасте старше 65 лет* начальная доза составляет 2.5 мг (1/2 таблетки) в один прием. При необходимости дозу увеличивают до 5 мг.

*При выраженных нарушениях функции почек (КК менее 20 мл/мин) и у пациентов с тяжелыми заболеваниями печени* максимальная суточная доза составляет 10 мг.

Увеличение дозы у таких пациентов надо проводить с особой осторожностью.

*Хроническая сердечная недостаточность.* Лечение должно начинаться с постепенного увеличения дозы до достижения индивидуальной оптимальной поддерживающей дозы. Подбор дозы в начале лечения необходимо осуществлять по следующей схеме, выдерживая недельные интервалы и основываясь на переносимости этой дозы пациентом: доза, составляющая 1.25 мг (1/4 таблетки) 1 раз в сут., может быть увеличена сначала до 2.5 мг - 5 мг (1/2 таблетки - 1 таблетка) в сут в один прием, а затем - до 10 мг (2 таблетки) в сут. в один прием. Пациент должен находиться под контролем врача в течение 2 ч после приема первой дозы препарата, а также после каждого последующего увеличения дозы. Каждое увеличение дозы должно осуществляться не менее чем через 2 недели. Максимально рекомендованная доза при терапии хронической сердечной недостаточности составляет 10 мг препарата в сут. в один прием. Во время титрования рекомендуется регулярный контроль АД, ЧСС и симптомов выраженности хронической сердечной недостаточности.

Во время фазы титрации в случае ухудшения течения хронической сердечной недостаточности или непереносимости препарата рекомендуется снизить дозу препарата или в случае необходимости немедленно прекратить его прием (в случае ярко выраженной артериальной гипотензии, ухудшении течения хронической сердечной недостаточности с острым отеком легких, в случае развития кардиогенного шока, симптоматической брадикардии или AV блокаде).

## Побочное действие:

*Со стороны центральной нервной системы:* головная боль, головокружение, повышенная утомляемость, парестезии, депрессия, снижение способности к концентрации внимания, сонливость, бессонница, «кошмарные» сновидения, галлюцинации, потеря сознания.

*Со стороны пищеварительной системы:* тошнота, запор, метеоризм, диарея, сухость слизистой оболочки полости рта.

*Со стороны сердечно-сосудистой системы:* брадикардия, сердечная недостаточность, AV блокада, ортостатическая гипотензия, нарушения периферического кровообращения (ощущение «холода» в конечностях, цианоз), одышка, нарушения ритма сердца, синдром Рейно, периферические отеки, кардиалгия, усугубление течения хронической сердечной недостаточности (возникает преимущественно во время титрации дозы препарата), выраженное снижение АД.

*Аллергические реакции со стороны кожных покровов:* кожный зуд, сыпь эритематозного характера, ангионевротический отек, гиперемия кожных покровов, алопеция.

*Со стороны дыхательной системы:* бронхоспазм (в т.ч. при отсутствии обструктивных заболеваний легких в анамнезе), бронхоспазм у пациентов с бронхиальной астмой или обструкцией дыхательных путей в анамнезе, ринит.

*Прочие:* фотодерматоз, гипергидроз, обострение течения псориаза, нарушения зрения (сухость глаз), нарушение потенции.

## Передозировка:

Данные о передозировке отсутствуют.

*Симптомы:* выраженное снижение АД, выраженная брадикардия, AV блокада, кардиогенный шок, острая сердечная недостаточность, остановка сердца, бронхоспазм, тошнота, рвота, цианоз, потеря сознания, кома.

*Лечение:* промывание желудка, прием активированного угля. В случае выраженного снижения АД необходимо придать пациенту горизонтальное положение с приподнятыми ногами, при необходимости в/в введении жидкости и вазопрессоров.

При выраженной брадикардии вводят в/в 0.5-2 мг атропина, при отсутствии положительного эффекта возможна постановка трансвенозного искусственного водителя ритма.

При AV блокаде (II-III ст.) рекомендуется в/в введение бета- адреномиметиков, при их неэффективности следует рассмотреть вопрос о постановке искусственного водителя ритма. При сердечной недостаточности лечение начинают с введения сердечных гликозидов и диуретиков, при отсутствии эффекта целесообразно введение допамина, добутамина или вазодилататоров. При бронхоспазме вводят в/в бета2-адреномиметики. При желудочковой экстрасистолии - лидокаин (нельзя вводить антиаритмические средства IA класса).

## Применение при беременности и кормлении грудью:

При беременности препарат назначают только по строгим показаниям в случае, если предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода (в связи с возможным развитием у новорожденного брадикардии, артериальной гипотензии, гипогликемии и паралича дыхания). Лечение необходимо прерывать за 48-72 ч до родов. В тех случаях, когда это невозможно, необходимо обеспечивать строгое наблюдение за новорожденным в течение 48-72 ч после родоразрешения.

Исследования на животных показали, что небиволол выделяется с грудным молоком. Нет данных о выделении небиволола в грудное молоко. Поэтому применение препарата не рекомендуется женщинам в период кормления грудью. Если прием препарата в период лактации необходим, то грудное вскармливание следует прекратить.

## Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

*Флоктафенин:* в случае шока или артериальной гипотензии, вызванных приёмом флоктафенина, бета-адреноблокаторы ослабляют компенсаторные механизмы сердечно-сосудистой системы.

*Сультоприд:* повышение риска возникновения желудочковой аритмии, особенно по типу «пируэт» (torsade des pointes).

При одновременном применении бета-адреноблокаторов с блокаторами «медленных» кальциевых каналов (БМКК) (верапамил и дилтиазем) усиливается отрицательное действие на сократимость миокарда и AV проводимость. Противопоказано в/в введение верапамила на фоне приема небиволола. При сочетании с гипотензивными средствами, нитроглицерином или БМКК может развиться выраженная артериальная гипотензия (особая осторожность необходима при сочетании с празозином).

При одновременном применении с антиаритмическими препаратами I класса и с амиодароном возможно усиление отрицательного инотропного действия и удлинение времени проведения возбуждения по предсердиям.

При одновременном применении небиволола с сердечными гликозидами не выявляется усиления влияния на замедление AV проводимости. Одновременное применение небиволола и препаратов для общей анестезии может вызывать подавление рефлекторной тахикардии и увеличивать риск развития артериальной гипотензии.

Клинически значимого взаимодействия небиволола и нестероидных противовоспалительных препаратов (НПВП) не установлено. Ацетилсалициловая кислота в качестве антиагрегантного средства может применяться одновременно с небивололом.

Одновременное применение трициклических антидепрессантов, барбитуратов и производных фенотиазина может усиливать гипотензивное действие небиволола.

*Фармакокинетическое взаимодействие*

При одновременном применении с препаратами, ингибирующими обратный захват серотонина, или другими средствами, биотрансформирующимися с участием изофермента CYP2D6, метаболизм небиволола замедляется. При

одновременном применении небиволол не оказывает влияния на фармакокинетические параметры дигоксина.

При одновременном применении с циметидином концентрация небиволола в плазме крови увеличивается (данные о влиянии на фармакологические эффекты препарата отсутствуют). Одновременное применение ранитидина не оказывает влияния на фармакокинетические параметры небиволола.

При одновременном применении небиволола с никардипином концентрации активных веществ в плазме крови несколько увеличиваются, однако это не имеет клинического значения.

Одновременный приём этанола, фуросемида или гидрохлоротиазида не влияет на фармакокинетику небиволола.

Не установлено клинически значимого взаимодействия небиволола и варфарина. При одновременном применении симпатомиметические средства подавляют активность небиволола.

## Особые указания и меры предосторожности:

Отмену бета-адреноблокаторов следует проводить постепенно, в течение 10 дней (до 2-х недель у пациентов с ИБС).

Контроль АД и ЧСС в начале приема препарата должен быть ежедневным. У пожилых пациентов необходим контроль функции почек (1 раз в 4-5 месяцев). При стенокардии напряжения доза препарата должна обеспечить ЧСС в покое в пределах 55-60 уд./мин, при нагрузке - не более 110 уд./мин. Бета-адреноблокаторы могут вызывать брадикардию: дозу следует снизить, если ЧСС менее 50-55 уд./мин. При решении вопроса о применении препарата Небикор пациентам с псориазом следует тщательно соотнести предполагаемую пользу и возможный риск обострения течения псориаза.

Пациенты, пользующиеся контактными линзами, должны учитывать, что на фоне применения бета-адреноблокаторов возможно снижение продукции слезной жидкости.

При проведении хирургических вмешательств следует предупредить врача- анестезиолога о том, что пациент принимает небиволол.

Небиволол не влияет на концентрацию глюкозы в плазме крови у пациентов с сахарным диабетом. Тем не менее, следует соблюдать осторожность при лечении этих пациентов, поскольку небиволол может замаскировать определённые симптомы гипогликемии (например, тахикардию), вызванные применением гипогликемических средств.

Контроль концентрации глюкозы в плазме крови следует проводить 1 раз в 4-5 месяцев (у больных с сахарным диабетом).

Бета-адреноблокаторы следует применять с осторожностью у пациентов с ХОБЛ, поскольку может усилиться бронхоспазм.

При гиперфункции щитовидной железы препарат маскирует тахикардию. Бета-адреноблокаторы могут повышать чувствительность к аллергенам и тяжесть анафилактических реакций.

Эффективность бета-адреноблокаторов у курильщиков ниже, чем у некурящих пациентов.

*Влияние на способность к управлению автомобилем и другими сложными механизмами*

Исследовательские работы показали, что небиволол не оказывает влияния на скорость психомоторных реакций. Пилотам летного состава с артериальной гипертензией I степени (допущенным к летной работе) препарат назначают в начальной дозе 2.5 мг. В дальнейшем (не ранее, чем через 2 недели) при хорошей переносимости лечения и недостаточном контроле АД возможно повышение дозы на 2.5 мг. Рекомендуемая доза - 5 мг/сут. У некоторых пациентов могут возникать побочные эффекты, чаще всего головокружение, из-за сниженного АД. При возникновении подобных эффектов пациенту не следует управлять транспортными средствами или заниматься потенциально опасными видами деятельности, требующими особого внимания и быстроты психомоторных реакций. Данные эффекты возникают чаще всего сразу после начала лечения или при увеличении дозы.

***При нарушениях функции почек***

С осторожностью: выраженная почечная недостаточность (клиренс креатинина (КК) менее 20 мл/мин).

***При нарушениях функции печени***

Противопоказан при выраженных нарушениях функции печени.

С осторожностью:нарушение функции печени.

***Применение в пожилом возрасте***

С осторожностью: пациенты пожилого возраста (старше 65 лет).

У пожилых пациентов необходим контроль функции почек (1 раз в 4-5 месяцев).

***Применение в детском возрасте***

Противопоказан в возрасте до 18 лет.

## Условия хранения:

Препарат хранить при температуре не выше 30°С. Хранить в недоступном для детей месте.

Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

## Срок годности:

3 года.

## Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

**Источник:** http://drugs.thead.ru/Nebikor_Adifarm