Небилет



Код АТХ:

- C07AB12

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Небиволол

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки почти белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с крестообразной насечкой для деления.

	1 таб.
небиволола гидрохлорид микронизированный	5.45 мг,
что соответствует содержанию небиволола	5 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 141.75 мг, крахмал кукурузный - 46 мг, натрия кроскармеллоза - 13.8 мг, гипромеллоза 15 мПа×с - 4.6 мг, полисорбат 80 - 0.46 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 16.1 мг, кремния диоксид коллоидный - 0.69 мг, магния стеарат - 1.15 мг.

7 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
7 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
7 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Вегетотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Кардиоселективный бета$_1$-адреноблокатор. Оказывает гипотензивное, антиангинальное и антиаритмическое действие. Снижает повышенное АД в покое, при физическом напряжении и стрессе. Конкурентно и избирательно блокирует постсинаптические β_1-адренорецепторы, делая их недоступными для катехоламинов, модулирует высвобождение эндотелиального вазодилатирующего фактора оксида азота (NO).

Небиволол представляет собой рацемат двух энантиомеров: SRRR-небиволола (D-небиволол) и RSSS-небиволола (L-небиволол), сочетающий два фармакологических действия:

— D-небиволол является конкурентным и высокоселективным блокатором β_1-адренорецепторов;

— L-небиволол оказывает мягкое сосудорасширяющее действие за счет модуляции высвобождения вазодилатирующего фактора (NO) из эндотелия сосудов.

Гипотензивное действие обусловлено также уменьшением активности ренин-ангиотензин-альдостероновой системы (РААС) (прямо не коррелирует с изменением активности ренина в плазме крови).

Устойчивое гипотензивное действие развивается через 1-2 недели регулярного приема препарата, а в ряде случаев - через 4 недели, стабильное действие отмечается через 1-2 месяца.

Снижая потребность миокарда в кислороде (урежение ЧСС и снижение преднагрузки и постнагрузки), уменьшает количество и тяжесть приступов стенокардии и повышает переносимость физической нагрузки.

Антиаритмическое действие обусловлено подавлением патологического автоматизма сердца (в т.ч. в патологическом очаге) и замедлением AV-проводимости.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь происходит быстрое всасывание обоих энантиомеров. Прием пищи не оказывает влияния на абсорбцию, поэтому небиволол можно принимать независимо от приема пищи. Биодоступность небиволола после приема внутрь составляет в среднем 12% у лиц с "быстрым" метаболизмом (эффект первого прохождения через печень) и является почти полной у лиц с "медленным" метаболизмом.

Распределение

В плазме крови оба энантиомера преимущественно связаны с альбумином. Связывание с белками плазмы для D-небиволола составляет 98.1%, а для L-небиволола - 97.9%.

Метаболизм

Метаболизируется путем ациклического и ароматического гидроксилирования и частичного N-деалкилирования. Образующиеся гидрокси- и аминопроизводные конъюгируют с глюкуроновой кислотой и выводятся в виде O- и N-глюкуронидов.

Выведение

Выводится почками (38%) и через кишечник (48%).

У лиц с "быстрым" метаболизмом $T_{1/2}$ гидроксиметаболитов - 24ч, энантиомеров небиволола - 10 ч; у лиц с "медленным" метаболизмом: гидроксиметаболитов - 48 ч, энантиомеров небиволола - 30-50 ч.

Выведение неизмененного небиволола с мочой составляет менее 0.5% от количества препарата, принятого внутрь.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия;

— ишемическая болезнь сердца: профилактика приступов стенокардии напряжения;

— хроническая сердечная недостаточность (в составе комбинированной терапии).

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия

- Гипертензия
- Ишемическая болезнь сердца
- Сердечная недостаточность
- Стенокардия

Противопоказания:

— острая сердечная недостаточность;

— хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации (требующая в/в введения препаратов, обладающих инотропным действием);

— выраженная артериальная гипотензия (систолическое АД менее 90 мм рт.ст.);

— СССУ, включая синоатриальную блокаду;

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

— брадикардия (ЧСС менее 60 уд./мин);

— кардиогенный шок;

— феохромоцитома (без одновременного применения альфа-адреноблокаторов);

— метаболический ацидоз;

— выраженные нарушения функции печени;

— бронхоспазм и бронхиальная астма в анамнезе;

— тяжелые облитерирующие заболевания периферических сосудов (перемежающаяся хромота, синдром Рейно);

— миастения;

— депрессия;

— непереносимость лактозы, дефицит лактазы и синдром мальабсорбции глюкозы/галактозы;

— детский и подростковый возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не изучены);

— повышенная чувствительность к небивололу или одному из компонентов препарата.

С *осторожностью* следует применять препарат при почечной недостаточности, сахарном диабете, гиперфункции щитовидной железы, аллергических заболеваниях в анамнезе, псориазе, хронической обструктивной болезни легких, AV-блокаде I степени, стенокардии Принцметала, а также пациентам в возрасте старше 75 лет.

Способ применения и дозы:

Таблетки принимают внутрь, 1 раз/сут, желательно всегда в одно и то же время суток, независимо от приема пищи, запивая достаточным количеством жидкости.

Средняя суточная доза для лечения *артериальной гипертензии и ИБС* составляет 2.5-5 мг (1/2-1 таб.). Небилет можно применять в монотерапии или в сочетании с другими средствами, снижающими АД.

У **больных с почечной недостаточностью,** а также у **пациентов в возрасте старше 65 лет** рекомендуемая начальная доза составляет 2.5 мг (1/2 таб.)/сут. При необходимости суточную дозу можно увеличить до максимальной 10 мг (2 таб. по 5 мг в 1 прием).

Лечение хронической сердечной недостаточности должно начинаться с медленного увеличения дозы до достижения индивидуальной оптимальной поддерживающей дозы. Подбор дозы в начале лечения необходимо осуществлять по следующей схеме, выдерживая при этом интервалы от 1 до 2 недель и основываясь на переносимости этой дозы пациентом: доза, составляющая 1.25 мг небиволола (1/4 таб. по 5 мг) 1 раз/сут может быть увеличена сначала до 2.5-5 мг (1/2 таб. по 5 мг или 1 таб. 5 мг), а затем - до 10 мг (2 таб. по 5 мг) 1 раз/сут.

Максимальная суточная доза составляет 10 мг 1 раз/сут.

В начале лечения и при каждом повышении дозы пациент должен не менее 2 ч находится под наблюдением врача, чтобы убедиться, что клиническое состояние остается стабильным (особенно, АД, ЧСС, нарушения проводимости, а также симптомы усугубления течения хронической сердечной недостаточности).

Правила деления таблеток

Для деления положите таблетку на твердую, ровную поверхность крестообразной насечкой вверх, надавите на таблетку обоими указательными пальцами. Для получения 1/4 таблетки повторите эти же действия с 1/2 таблетки.

Побочное действие:

Частота побочных эффектов: очень часто (>10%), часто (>1% и <10%), нечасто (>0.1% и <1%), редко (>0.01% и <0.1%), очень редко (<0.01%, включая отдельные сообщения).

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: часто - головная боль, головокружение, повышенная утомляемость, слабость, парестезии; нечасто - депрессия, кошмарные сновидения, спутанность сознания; очень редко **-** обморок, галлюцинации.

Со стороны пищеварительной системы: часто **-** тошнота, запор, диарея; нечасто - диспепсия, метеоризм, рвота.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: нечасто - брадикардия, острая сердечная недостаточность, AV-блокада, ортостатическая гипотензия, синдром Рейно.

Со стороны кожи и подкожных тканей: нечасто - кожная сыпь эритематозного характера, зуд; очень редко - усугубление течения псориаза; в отдельных случаях - ангионевротический отек.

Прочие: нечасто - бронхоспазм; редко **-** сухость глаз.

Передозировка:

Симптомы: выраженное снижение АД, тошнота, рвота, цианоз, синусовая брадикардия, AV-блокада, бронхоспазм, потеря сознания, кардиогенный шок, кома, остановка сердца.

Лечение: промывание желудка, прием активированного угля. В случае выраженного снижения АД необходимо придать пациенту горизонтальное положение с приподнятыми ногами, при необходимости в/в введение жидкости и вазопрессоров. При брадикардии следует вводить в/в 0.5-2 мг атропина при отсутствии положительного эффекта возможна постановка трансвенозного или внутрисердечного электростимулятора. При AV-блокаде (II-III ст.) рекомендуется в/в введение бета-адреностимуляторов, 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 применяют в/в стимуляторы β_2-адренорецепторов. При желудочковой эстрасистолии - лидокаин (нельзя вводить антиаритмические средства IA класса).

Применение при беременности и кормлении грудью:

При беременности препарат Небилет назначают только по жизненно важным показаниям, когда польза для матери превышает возможный риск для плода или новорожденного (в связи с возможным развитием у плода и новорожденного брадикардии, артериальной гипотензии, гипогликемии). Если лечение препаратом Небилет необходимо, то нужно проводить наблюдение за маточно-плацентарным кровотоком и ростом плода. Лечение необходимо прервать за 48-72 ч до родов. В тех случаях, когда это невозможно, необходимо установить строгое наблюдение за новорожденными в течение 48-72 ч после родоразрешения.

Небиволол выводится с грудным молоком. При необходимости приема препарата Небилет в период лактации, грудное вскармливание необходимо прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Фармакодинамическое взаимодействие

При одновременном применении бета-адреноблокаторов с блокаторами медленных кальциевых каналов (верапамил и дилтиазем) усиливается отрицательное действие на сократимость миокарда и AV-проводимость.

Противопоказано в/в введение верапамила на фоне применения небиволола.

При одновременном применении небиволола с гипотензивными средствами, нитроглицерином или блокаторами медленных кальциевых каналов может развиться выраженная артериальная гипотензия (особая осторожность необходима при сочетании с празозином).

При одновременном применении небиволола 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 выявлено 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 НПВП не установлено.

Одновременное применение небиволола с трициклическими антидепрессантами, барбитуратами и производными фенотиазина может усиливать гипотензивное действие небиволола.

Фармакокинетическое взаимодействие

При одновременном применении небиволола с препаратами, ингибирующими обратный захват серотонина, или другими средствами, биотрансформирующимися с участием изофермента CYP2D6, повышается концентрация небиволола в плазме крови, метаболизм небиволола замедляется, что может привести к риску возникновения брадикардии.

При одновременном применении с дигоксином небиволол не оказывает влияния на фармакокинетические параметры дигоксина.

При одновременном применении небиволола с циметидином концентрация небиволола в плазме крови увеличивается.

Одновременное применение небиволола и 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 прием небиволола и этанола, фуросемида или гидрохлоротиазида не влияет на фармакокинетику небиволола.

Не установлено клинически значимого взаимодействия небиволола и варфарина.

При совместном применении небиволола с инсулином и гипогликемическими средствами для приема внутрь могут маскироваться симптомы гипогликемии (тахикардия).

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 Небилет у пациентов с псориазом следует тщательно соотнести предполагаемую пользу от применения препарата 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 бета-адреноблокаторы.

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 препарат Небилет может маскировать определенные симптомы гипогликемии (например, тахикардию), вызванные применением гипогликемических средств для приема внутрь и инсулина. Контроль концентрации глюкозы в плазме крови следует проводить 1 раз в 4-5 мес (у больных с сахарным диабетом).

При гиперфункции щитовидной железы бета-адреноблокаторы могут маскировать тахикардию.

Бета-адреноблокаторы следует применять с осторожностью у пациентов с хронической обструктивной болезнью легких, поскольку может усилиться бронхоспазм.

Бета-адреноблокаторы могут повысить чувствительность к аллергенам и тяжесть анафилактических реакций.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Влияние препарата Небилет на способность к вождению транспортных средств и управлению механизмами специально не изучалось. Исследования фармакодинамики небиволола показали, что препарат Небилет не оказывает влияния на психомоторную функцию. В период лечения препаратом Небилет (при возникновении побочных эффектов) следует соблюдать осторожность при вождении транспортных средств и при занятиях потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

У больных с почечной недостаточностью начальная доза составляет 2.5 мг/сут.

При нарушениях функции печени

Противопоказан при выраженных нарушениях функции печени.

Применение в пожилом возрасте

С *осторожностью* следует применять препарат пациентам в возрасте старше 75 лет.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°C.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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