Небиволол



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]

Фармакотерапевтическая группа:

- Вегетотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Кардиоселективный бета$_1$-адреноблокатор III поколения с вазодилатирующими свойствами. Активное вещество представляет собой рацемат, состоящий из двух энантиомеров: D-небиволола и L-небиволола. 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.

Небиволол снижает ЧСС и АД в состоянии покоя и при нагрузке, уменьшает конечное диастолическое давление левого желудочка, снижает ОПСС, улучшает диастолическую функцию сердца (снижает давление наполнения), увеличивает фракцию выброса; вызывает антиангинальный эффект у больных ИБС.

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

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

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.

Фармакокинетика

После приема внутрь небиволол быстро абсорбируется из ЖКТ. Прием пищи не влияет на абсорбцию. Биодоступность составляет в среднем 12% у лиц с быстрым метаболизмом (эффект "первого прохождения" через печень) и является почти полной у лиц с медленным метаболизмом.

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

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.

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%.

Показания к применению:

Артериальная гипертензия.

ИБС: профилактика приступов стенокардии напряжения.

Хроническая сердечная недостаточность (в составе комбинированной терапии).

Относится к болезням:

- Гипертензия
- Сердечная недостаточность
- Стенокардия

Противопоказания:

Острая сердечная недостаточность; хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации (требующая в/в введения препаратов, обладающих положительным 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; детский и подростковый возраст до 18 лет; повышенная чувствительность к небивололу.

Способ применения и дозы:

Взрослым для приема внутрь - 2.5-5 мг/сут утром. Оптимальный эффект развивается через 1-2 недели лечения, а в ряде случаев - через 4 недели. При необходимости суточную дозу увеличивают до 10 мг/сут.

Для пациентов в возрасте старше 65 лет начальная доза составляет 2.5 мг/сут. При необходимости суточную дозу можно увеличить до 5 мг.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: головная боль, головокружение, чувство усталости, парестезии, депрессия, снижение способности к концентрации внимания, сонливость, бессонница, кошмарные сновидения; очень редко - обморок, галлюцинации.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, запор, диарея, сухость во рту, метеоризм, рвота.

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

Со стороны кожи и подкожных тканей: кожная сыпь эритематозного характера, зуд; очень редко - усугубление течения псориаза.

Аллергические реакции: в отдельных случаях - ангионевротический отек.

Прочие: бронхоспазм, сухость глаз.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение при беременности возможно только по строгим показаниям (в связи с возможным развитием у новорожденных брадикардии, артериальной гипотензии, гипогликемии и паралича дыхания). Прием небиволола необходимо прекратить за 48-72 ч до родов. В тех случаях, когда это невозможно, следует обеспечивать строгое наблюдение за новорожденными в течение 48-72 ч после родов.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с антиаритмическими препаратами I класса, амиодароном возможно усиление отрицательного инотропного действия и угнетение AV-проводимости.

При одновременном применении с блокаторами кальциевых каналов (верапамилом и дилтиаземом) усиливается отрицательное инотропное действие и угнетение AV-проводимости.

При в/в введении верапамила на фоне приема небиволола существует угроза остановки сердца (одновременное применение противопоказано).

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 с симпатомиметиками подавляется фармакологическая активность небиволола.

При одновременном применении со средствами для наркоза возможно подавление рефлекторной тахикардии и повышение риска развития артериальной гипотензии.

При одновременном применении с трициклическими антидепрессантами, барбитуратами, производными фенотиазина возможно усиление антигипертензивного действия небиволола.

При одновременном применении с циметидином возможно повышение концентрации небиволола в плазме крови.

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 повышать риск развития брадикардии.

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

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью следует применять небиволол у пациентов с почечной недостаточностью, сахарным диабетом, гиперфункцией щитовидной железы, аллергическими заболеваниями в анамнезе, псориазом, ХОБЛ, AV-блокадой I степени, стенокардией Принцметала, а также у пациентов в возрасте старше 75 лет.

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

В начале лечения следует ежедневно контролировать АД и ЧСС.

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

Небиволол не оказывает влияния на уровень глюкозы у пациентов с сахарным диабетом, однако под действием небиволола могут оказаться замаскированными определенные признаки гипогликемии (тахикардия, учащенное сердцебиение), вызванные применением гипогликемических препаратов.

При необходимости применения небиволола у пациентов с псориазом следует тщательно оценить ожидаемую пользу терапии и возможный риск обострения псориаза.

Бета-адреноблокаторы следует с осторожностью применять при повышенной функции щитовидной железы в связи с тем, что под влиянием бета-адреноблокаторов тахикардия может нивелирована.

Небиволол может усиливать симптомы нарушения периферического кровообращения.

Пациенты, носящие контактные линзы, должны учитывать, что на фоне применения бета-адреноблокаторов возможно снижение продукции слезной жидкости.

При проведении хирургических вмешательств следует предупредить анестезиолога о том, что пациент принимает бета-адреноблокаторы.

Контроль содержания глюкозы в плазме крови следует проводить 1 раз в 4-5 мес (у больных сахарным диабетом).

Контроль лабораторных показателей функции почек следует проводить 1 раз в 4-5 мес (у пациентов пожилого возраста).

Применение у детей не рекомендуется.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Небиволол не влияет на скорость психомоторных реакций. На фоне приема небиволола иногда возможны головокружение и чувство усталости, поэтому пациентам, принимающим небиволол, следует воздерживаться от занятий потенциально опасными видами деятельности.

При нарушениях функции почек

С осторожностью применять у пациентов с почечной недостаточностью.

При нарушениях функции печени

Противопоказан при тяжелых нарушениях функции печени.

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью применять у пациентов в возрасте старше 65 лет. Контроль лабораторных показателей функции почек у пациентов пожилого возраста следует проводить 1 раз в 4-5 мес.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет.

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