Небиволол-Сз



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Форма выпуска, описание и состав

Таблетки белого или почти белого цвета, круглые, плоскоцилиндрические, с фаской и крестообразной риской.

	1 таб.
небиволол (в форме гидрохлорида)	5 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат (сахар молочный) - 89.87 мг, крахмал прежелатинизированный (крахмал 1500) - 22.5 мг, кроскармеллоза натрия (примеллоза) - 9 мг, повидон (поливинилпирролидон среднемолекулярный) - 4.5 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 17.25 мг, кремния диоксид коллоидный (аэросил) - 0.38 мг, кальция стеарат - 1.5 мг.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (6) - пачки картонные.
14 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
14 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
14 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
14 шт. - упаковки ячейковые контурные (4) - пачки картонные.
30 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.
56 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.
60 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.
30 шт. - флаконы полимерные (1) - пачки картонные.
56 шт. - флаконы полимерные (1) - пачки картонные.
60 шт. - флаконы полимерные (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Кардиоселективный бета$_1$-адреноблокатор. Небиволол 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, моделирует высвобождение эндотелиального вазодилатирующего фактора оксида азота (NO).

Небиволол представляет собой рацемат двух энантиомеров: SRRR-небиволола (D-небиволол) и RSSS-небиволола (L-небиволол), сочетающий два вида 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 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, снижение преднагрузки и постнагрузки), небиволол уменьшает число 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 принятого внутрь небиволола составляет в среднем 12% у пациентов с "быстрым" метаболизмом (эффект "первого прохождения") и бывает почти полной - у пациентов с "медленным" метаболизмом.

Распределение

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

Метаболизм и выведение

Метаболизируется небиволол путем алициклического и ароматического гидроскилирования и частичного N-дезалкилирования. Образующиеся гидрокси- и аминопроизводные конъюгируют с глюкуроновой кислотой и выводятся в виде O- и N-глюкуронидов, почками (38%), через кишечник (48%). $T_{1/2}$ у пациентов с "быстрым" метаболизмом: гидроскиметаболитов - 24 ч, энантиомеров небиволола - 10 ч; у пациентов с "медленным" метаболизмом: гидроскиметаболитов - 48 ч, энантиомеров небиволола - 30-50 ч.

Выведение неизмененного небиволола почками составляет менее 0.5% от дозы препарата принятого внутрь.

Учитывая различия в скорости метаболизма, дозу препарата всегда следует подбирать индивидуально: пациентам с "медленным" метаболизмом требуется меньшая доза.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия;

— ИБС: профилактика приступов стенокардии напряжения;

— хроническая сердечная недостаточность (в составе комбинированной терапии).

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- ИБС
- Сердечная недостаточность
- Стенокардия

Противопоказания:

— повышенная чувствительность к действующему веществу или одному из компонентов препарата;

— острая сердечная недостаточность;

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

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

— СССУ, включая синоатриальную блокаду;

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

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

— кардиогенный шок;

— феохромоцитома (без одновременного применения альфа-адреноблокаторов);

— метаболический ацидоз;

— тяжелые нарушения функции печени;

— тяжелые формы бронхиальной астмы и хроническая обструктивная болезнь легких (ХОБЛ);

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

— миастения;

— депрессия;

— непереносимость лактозы, дефицит лактазы и синдром глюкозо-галактозной мальабсорбции;

— возраст до 18 лет (эффективность и безопасность в этой возрастной группе не изучены);

— одновременный прием с флоктафенином, сультопридом (см. раздел "Лекарственное взаимодействие").

С осторожностью

-почечная недостаточность;

-сахарный диабет;

-гиперфункция щитовидной железы;

-отягощенный аллергологический анамнез;

-проведение десенсибилизирующей терапии;

-псориаз;

-бронхиальная астма и ХОБЛ;

-AV-блокада I степени;

-стенокардия Принцметала;

-возраст старше 65 лет.

Способ применения и дозы:

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

Для *лечения артериальной гипертензии и ИБС* средняя суточная доза составляет 2.5 мг - 5 мг препарата Небиволол-СЗ (1/2 таблетки 5 мг - 1 таблетка 5 мг).

Небиволол-СЗ можно применять в качестве монотерапии или в сочетании с другими средствами, понижающими АД.

У **пациентов с почечной недостаточностью, а также у пациентов старше 65 лет**, рекомендованная начальная доза составляет 1/2 таблетки (1/2 таблетки 5 мг) препарата Небиволол-СЗ в сут. При необходимости суточную дозу можно увеличить до максимальной 10 мг (2 таблетки по 5 мг в один 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 ориентируясь на переносимость этой дозы пациентом: начальная доза - 1.25 мг (1/4 таблетки 5 мг с крестообразной риской) 1 раз/сут, может быть увеличена сначала до 2.5-5 мг препарата Небиволол-СЗ (1/2 таблетки 5 мг - 1 таблетка 5 мг), а затем - до 10 мг (2 таблетки 5 мг) 1 раз/сут.

Максимальная суточная доза составляет 10 мг (2 таблетки 5 мг) 1 раз/сут.

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

Не рекомендуется применение небиволола у **пациентов с тяжелой почечной и/или печеночной недостаточностью** в связи с отсутствием опыта применения.

Побочное действие:

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

Со стороны нервной системы: часто - головная боль, головокружение, повышенная утомляемость, слабость, парестезия; нечасто - депрессия, кошмарные сновидения, спутанность сознания, снижение способности к концентрации внимания, сонливость, бессонница; очень редко - обморок, галлюцинации.

Со стороны ЖКТ: часто - сухость слизистой оболочки полости рта, тошнота, запор, диарея; нечасто - диспепсия, метеоризм, рвота.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: нечасто - брадикардия, усугубление течения ХСН, острая сердечная недостаточность, замедление AV-проводимости, AV-блокада, выраженное снижение АД, ортостатическая гипотензия, нарушения ритма сердца, кардиалгия, обострение "перемежающейся" хромоты, периферические отеки, синдром Рейно.

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

Со стороны органа зрения: нечасто - нарушение зрения.

Со стороны дыхательной системы: часто - одышка; нечасто - бронхоспазм, ринит.

Со стороны репродуктивной системы: нечасто - эректильная дисфункция

Прочие нарушения: алопеция.

Передозировка:

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

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 экстрасистолии - лидокаин (нельзя вводить антиаритмические средства I А класса). При гипогликемии - в/в раствор декстрозы (глюкозы), при судорогах - диазепам.

Применение при беременности и кормлении грудью:

При беременности препарат Небиволол-СЗ 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 Небиволол-СЗ необходимо, то следует проводить наблюдение за маточно-плацентарным кровотоком и развитием и ростом плода. Лечение необходимо прервать за 48 - 72 часа до родов. В тех случаях, когда это невозможно, необходимо установить строгое наблюдение за новорожденными в течение 48 - 72 часов после родоразрешения.

Небиволол экскретируется с грудным молоком. При необходимости приема препарата Небиволол-СЗ в период лактации, грудное вскармливание необходимо прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Фармакодинамическое взаимодействие

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 применения небиволола.

При одновременном применении небиволола с гипотензивными средствами, нитроглицерином или БМКК может развиться тяжелая артериальная гипотензия (особая осторожность необходима при сочетании с празозином).

Одновременное применение баклофена и амифостина с гипотензивными препаратами может вызвать значительное падение АД, поэтому требуется коррекция дозы гипотензивных препаратов.

При одновременном применении небиволола с гипотензивными препаратами центрального действия (клонидин, гуанфацин, моксонидин, метилдопа, рилменидин) возможно ухудшение течения сердечной недостаточности за счет снижения симпатического тонуса (снижение ЧСС и сердечного выброса, симптомы вазодилатации).

В случае резкой отмены данных препаратов, особенно до отмены небиволола, возможно развитие "рикошетной" артериальной гипертензии.

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.

Противопоказано одновременное применения небиволола и флоктафенина, т.к. существует угроза выраженного снижения АД или шока.

Противопоказано одновременное применения небиволола и сультоприда, т.к. повышается риск развития желудочковой аритмии, особенно типа "пируэт".

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

При одновременном применении симпатомиметические средства подавляют активность 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.

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 пациентов пожилого возраста 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 Небиволол-СЗ 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 Небиволол-СЗ 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 пациентов 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.

У курильщиков эффективность бета-адреноблокаторов ниже по сравнению с не курящими пациентами.

Влияние на способность к управлению транспортными средствами и механизмами

В период лечения препаратом Небиволол-СЗ (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.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей, защищенном от света месте при температуре не выше 25°С.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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