Невотенз



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки белого цвета, круглые, с одной стороны выпуклые с маркировкой "N5", с другой - с крестообразной риской с возвышающейся гранью на каждом из разделяемых секторов.

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

Вспомогательные вещества: кремния диоксид коллоидный - 0.65 мг, магния стеарат - 2 мг, кроскармеллоза натрия - 11.5 мг, макрогол 6000 - 20 мг, лактозы моногидрат - 192.4 мг.

7 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
7 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
7 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.
7 шт. - блистеры (8) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (5) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Кардиоселективный липофильный бета$_1$-адреноблокатор III 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 β_1-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 вида фармакологических действия:

— D-небиволол является конкурентным и высокоселективным блокатором β_1-адренорецепторов (сродство к β_1-адренорецепторам в 293 раза выше, чем к β_2-адренорецепторам).

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

Гипотензивный эффект развивается на 2-5-й день лечения, стабильное действие отмечается через 1 месяц. Антигипертензивный эффект сохраняется при длительном лечении.

Гипотензивное действие обусловлено также уменьшением активности ренин-ангиотензиновой системы (прямо не

коррелирует с изменением активности ренина в плазме крови).

Применение небиволола улучшает показатели системной и внутрисердечной гемодинамики. Небиволол урежает ЧСС и АД в покое и при физической нагрузке, уменьшает конечное диастолическое давление левого желудочка, снижает ОПСС, 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 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 небиволол быстро абсорбируются из ЖКТ. Прием пищи не влияет на абсорбцию, 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.

Распределение

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.

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

Метаболизм

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

Выведение

Через неделю 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: профилактика приступов стабильной стенокардии;

— хроническая сердечная недостаточность (в составе комбинированной терапии).

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Сердечная недостаточность
- Стенокардия

Противопоказания:

— выраженные нарушения функции печени;

— острая сердечная недостаточность;

— хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации (требующая применения препаратов, обладающих инотропным эффектом);

— кардиогенный шок;

— СССУ, включая синоатриальную блокаду;

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

— бронхоспазм и бронхиальная астма;

— феохромоцитома (без одновременного применения альфа-адреноблокаторов);

— депрессия;

— метаболический ацидоз;

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

— выраженная артериальная гипотензия;

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

— возраст до 18 лет;

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

— одновременный прием с флоктафенином, сультопридом;

— повышенная чувствительность к небивалолу и другим компонентам препарата.

С *осторожностью* следует применять препарат при выраженной почечной недостаточности (КК< 20 мл/мин), нарушениях функции печени, сахарном диабете, гипертиреозе, проведении десенсибилизирующей терапии, псориазе, AV-блокаде I степени, стенокардии Принцметала, ХОБЛ, у пациентов пожилого возраста (старше 65 лет).

Способ применения и дозы:

Невотенз следует принимать внутрь в одно и то же время суток независимо от приема пищи, не разжевывая и запивая достаточным количеством жидкости.

Артериальная гипертензия и ИБС

Средняя суточная доза составляет 5 мг 1 раз/сут. Оптимальный эффект становится выраженным через 1-2 недели лечения, а в ряде случаев - через 4 недели. Возможно применение препарата в виде монотерапии или в составе комбинированной терапии.

При необходимости суточную дозу можно увеличить до 10 мг (2 таб. по 5 мг в 1 прием). Максимальная суточная доза - 10 мг.

У **пациентов с почечной недостаточностью**, а также **у пациентов пациентов пожилого возраста (старше 65 лет)** начальная доза составляет 2.5 мг/сут (1/2 таб. по 5 мг). При необходимости дозу увеличивают до 5 мг.

При **выраженных нарушениях функции почек (КК < 20 мл/мин)** и у **пациентов с тяжелыми заболеваниями печени** максимальная суточная доза составляет 10 мг. Увеличение дозы у таких пациентов следует проводить с особой осторожностью.

Хроническая сердечная недостаточность

Лечение хронической сердечной недостаточности следует начинать с постепенного увеличения дозы до достижения индивидуальной оптимальной поддерживающей дозы.

Подбор дозы в начале лечения следует проводить по следующей схеме, выдерживая недельные интервалы и основываясь на переносимости этой дозы пациентом: Невотенз назначают в дозе 1.25 мг (1/4 таб.) 1 раз/сут, затем эту дозу можно увеличить сначала до 2.5-5 мг (1/2-1 таб.), а затем - до 10 мг (2 таб.) 1 раз/сут. 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 препарата Невотенз при терапии хронической сердечной недостаточности составляет 10 мг 1 раз/сут. Во время титрования рекомендуется регулярный контроль АД, ЧСС и симптомов выраженности хронической сердечной недостаточности.

Во время фазы титрования в случае ухудшения течения хронической сердечной недостаточности или

непереносимости препарата рекомендуется снизить дозу препарата Невотенз 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 при AV-блокаде).

Побочное действие:

Со стороны 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[1], выраженное снижение АД.

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.

Дерматологические реакции: алопеция, фотодерматоз, гипергидроз, обострение течения псориаза.

Аллергические реакции: кожный зуд, сыпь эритематозного характера, ангионевротический отек, гиперемия кожных покровов.

Прочие: нарушения зрения (сухость глаз), нарушение потенции.

[1] - Данный побочный эффект преимущественно возникает во время титрования дозы препарата

Передозировка:

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

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; в качестве последующих мер возможно введение 1-10 мг глюкагона.

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 и III степени 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 бета$_2$-адреномиметики.

При желудочковой экстрасистолии - лидокаин (нельзя вводить антиаритмические средства класса I A).

При судорогах - в/в диазепам.

Применение при беременности и кормлении грудью:

При беременности препарат назначают только по строгим показаниям, когда потенциальная польза для матери превышает 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.

В *экспериментальных исследованиях* на животных показано, что небиволол выделяется с грудным молоком. Нет данных о выведении небивалола с грудным молоком. Поэтому препарат Невотенз не рекомендуется женщинам в период кормления грудью. Если применение препарата в период лактации необходимо, то грудное вскармливание необходимо прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

В случае шока или артериальной гипотензии, вызванных приемом флоктафенина, бета-адреноблокаторы ослабляют компенсаторные механизмы сердечно-сосудистой системы.

При одновременном применении с сультопридом повышается риск развития желудочковой аритмии, особенно типа "пируэт".

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 средствами 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. 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 оказывал 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 оказывало влияния на фармакокинетические параметры небиволола.

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

Одновременный прием этанола, фуросемида или гидрохлоротиазида не влиял 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 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 необходимо, чтобы доза препарата обеспечивала ЧСС в покое в пределах 55-60 уд./мин, при нагрузке – не более 110 уд./мин.

Бета-адреноблокаторы могут вызывать брадикардию, поэтому дозу следует снизить, если ЧСС менее 50-55 уд./мин.

При решении вопроса о назначении препарата Невотенз пациентам с псориазом следует тщательно соотнести предполагаемую пользу от применения препарата и возможный риск обострения псориаза.

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

Небиволол не влияет на уровень глюкозы у пациентов с сахарным диабетом. Тем не менее, следует соблюдать осторожность при лечении этих пациентов, поскольку Невотенз может маскировать определенные симптомы гипогликемии (например, тахикардию), вызванные применением гипогликемических средств.

У больных сахарным диабетом контроль содержания глюкозы в плазме крови следует проводить 1 раз в 4-5 месяцев.

Бета-адреноблокаторы следует применять с осторожностью у пациентов с ХОБЛ, поскольку возможно усиление бронхоспазма.

При гиперфункции щитовидной железы препарат нивелирует тахикардию.

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

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

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

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Исследовательские работы показали, что небиволол не оказывает влияния на скорость психомоторных реакций. Пилотам летного состава с артериальной гипертензии 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 возможно развитие побочных эффектов, чаще всего - головокружение, из-за пониженного 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 повышении дозы.

При нарушениях функции почек

С *осторожностью* следует применять препарат при выраженной почечной недостаточности (КК< 20 мл/мин).

При нарушениях функции печени

С *осторожностью* следует применять препарат при нарушениях функции печени.

Противопоказан при выраженных нарушениях функции печени.

Применение в пожилом возрасте

С *осторожностью* следует применять препарат у пациентов пожилого возраста (старше 65 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°С.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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