Обзидан



Код АТХ:

- C07AA05

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Пропранолол

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки 20 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.

Состав:

Одна таблетка содержит

Активное вещество: пропранолола гидрохлорида 40 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 48.1 мг, крахмал картофельный - 41.9 мг, тальк - 11.7 мг, натрия карбоксиметилкрахмал (тип А) - 3.8 мг, желатин - 2.3 мг, магния стеарат - 1.6 мг, кремния диоксид коллоидный - 0.6 мг.

Описание:

Таблетки белые, круглые, со скошенными краями, с риской на одной стороне, по одну сторону риски выдавлено "4", по другую - "0"; другая сторона таблетки гладкая.

Фармакотерапевтическая группа:

- Вегетотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Неселективный бета-адреноблокатор. Обладает антиангинальным, антигипертензивным и антиаритмическим действием. Неселективно блокируя β-адренорецепторы (75% β_1-адренорецепторы и 25% β_2–адренорецепторы), уменьшает стимулированное катехоламинами образование цАМФ из АТФ, в результате чего снижает внутриклеточное поступление кальция, оказывает отрицательное хроно-, дромо-, батмо- и инотропное действие (урежает ЧСС, угнетает проводимость и возбудимость, снижает сократимость миокарда).

В первые 24 ч применения препарата увеличивается ОПСС (в результате реципрокного возрастания активности α-адренорецепторов и устранения стимуляции β_2–адренорецепторов сосудов скелетной мускулатуры), но через 1–3 сут возвращается к исходному, а при длительном назначении снижается.

Антигипертензивный эффект препарата связан с уменьшением минутного объема сердца, уменьшением симпатической стимуляции периферических сосудов, снижением активности ренин-ангиотензиновой системы (имеет значение у больных с исходной гиперсекрецией ренина), снижением чувствительности барорецепторов дуги аорты (не происходит усиления их активности в ответ на снижение АД) и влиянием на ЦНС. Антигипертензивный эффект стабилизируется к концу 2 недель курсового назначения.

Антиангинальное действие обусловлено снижением потребности миокарда в кислороде (за счет отрицательного хронотропного и инотропного эффекта). Уменьшение ЧСС ведет к удлинению диастолы и улучшению перфузии миокарда. За счет повышения конечного диастолического давления в левом желудочке и увеличения растяжения мышечных волокон желудочков может повышать потребность в кислороде, особенно у больных с хронической сердечной недостаточностью.

Антиаритмический эффект обусловлен устранением аритмогенных факторов (тахикардии, повышенной активности симпатической нервной системы, увеличенного содержания цАМФ, артериальной гипертензии), уменьшением скорости спонтанного возбуждения синусового и эктопических водителей ритма и замедлением AV-проведения. Угнетение проведения импульсов отмечается преимущественно в антеградном и в меньшей степени в ретроградном направлениях через AV-узел и по дополнительным путям. За счет снижения потребности миокарда в кислороде происходит уменьшение выраженности ишемии миокарда, постинфарктная летальность может также уменьшаться благодаря антиаритмическому действию.

Способность предупреждать развитие головной боли сосудистого генеза обусловлена уменьшением выраженности расширения церебральных артерий вследствие блокады β–адренорецепторов сосудов, ингибированием вызываемых катехоламинами агрегации тромбоцитов и липолиза, снижением адгезивности тромбоцитов, предотвращением активации факторов свертывания крови во время высвобождения адреналина, стимуляцией поступления кислорода в ткани и уменьшением секреции ренина.

Уменьшение тремора на фоне применения пропранолола может быть обусловлено блокадой β_2-адренорецепторов.

Повышает атерогенные свойства крови. Усиливает сокращения матки (спонтанные и вызванные лекарственными средствами, стимулирующими миометрий). Повышает тонус бронхов.

Фармакокинетика

Всасывание. После приема внутрь всасывается быстро и достаточно полно (90%). C_{max} в плазме крови достигается через 1-1.5 ч. Биодоступность после однократного приема внутрь составляет 30-40% (эффект "первого прохождения" через печень, микросомальное окисление), при длительном приеме – увеличивается (образуются метаболиты, ингибирующие ферменты печени), ее величина зависит от характера пищи и интенсивности печеночного кровотока.

Распределение. Обладает высокой липофильностью, накапливается в ткани легких, головном мозге, почках, сердце. Проникает через гематоэнцефалический и плацентарный барьеры, в грудное молоко. Связь с белками плазмы крови - 90-95%. V_d - 3-5 л/кг.

Метаболизм. Биотрансформируется в печени путем глюкуронирования. Попадает с желчью в кишечник, деглюкуронизируется и реабсорбируется.

Выведение. Относительно быстро выводится из организма. $T_{1/2}$ - 3-5 ч, на фоне курсового введения может удлиняться до 12 ч. Выводится с мочой – 90%, в неизмененном виде – менее 1%. Не удаляется при гемодиализе.

Показания к применению:

Препарат рекомендован к применению при следующих заболеваниях:

— артериальная гипертензия;

— стенокардия напряжения;

— нестабильная стенокардия (за исключением стенокардии Принцметала);

— синусовая тахикардия (в т.ч. при гипертиреозе);

— наджелудочковая тахикардия;

— мерцательная тахиаритмия;

— наджелудочковая и желудочковая экстрасистолия;

— профилактика инфаркта миокарда (систолическое АД выше 100 мм рт.ст.);

— эссенциальный тремор;

— мигрень (профилактика приступов);

— в качестве симптоматической терапии тиреотоксикоза и тиреотоксического криза (при непереносимости тиреостатических лекарственных средств);

— симпато-адреналовые кризы на фоне диэнцефального синдрома.

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертония
- Инфаркт миокарда
- Мигрень
- Стенокардия
- Тахикардия
- Тиреотоксикоз
- Тиреотоксический криз
- Экстрасистолия
- Эссенциальный тремор

Противопоказания:

Препарат противопоказан при следующих заболеваниях:

— AV-блокада II и III степени;

— синоатриальная блокада;

— синусовая брадикардия;

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

— неконтролируемая хроническая сердечная недостаточность IIБ-III стадии;

— острая сердечная недостаточность;

— острый инфаркт миокарда (систолическое АД ниже 100 мм рт.ст.);

— кардиогенный шок;

— отек легких;

— синдром слабости синусового узла;

— стенокардия Принцметала;

— кардиомегалия (без признаков сердечной недостаточности);

— вазомоторный ринит;

— окклюзионные заболевания периферических сосудов (осложненные гангреной, симптомом перемежающейся хромоты или болью в покое);

— сахарный диабет;

— метаболический ацидоз (в т.ч. диабетический кетоацидоз);

— бронхиальная астма;

— склонность к бронхоспастическим реакциям;

— хроническая обструктивная болезнь легких (в т.ч. и в анамнезе);

— феохромоцитома (без одновременного использования альфа-адреноблокаторов);

— спастический колит;

— одновременный прием с антипсихотическими средствами и анксиолитиками (хлорпромазин, триоксазин и др.);

— одновременный прием с ингибиторами МАО;

— период лактации (грудного вскармливания);

— повышенная чувствительность к препарату.

С *осторожностью.* Следует назначать препарат при AV-блокаде I степени, печеночной и/или почечной недостаточности, гипертиреозе, миастении, хронической сердечной недостаточности I-IIA стадии, феохромоцитоме, псориазе, аллергических реакциях в анамнезе, синдроме Рейно, при беременности, пациентам пожилого возраста, детям и подросткам в возрасте до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).

Способ применения и дозы:

Таблетки следует принимать внутрь, до еды, не разжевывая и запивая небольшим количеством жидкости.

При артериальной гипертензии назначают по 40 мг 2 раза/сут. При недостаточной выраженности гипотензивного эффекта суточную дозу увеличивают до 120 мг (по 40 мг 3 раза/сут) или до 160 мг (по 80 мг 2 раза/сут). Максимальная суточная доза – 320 мг.

При стенокардии, нарушениях сердечного ритма начальная суточная доза составляет 60 мг (по 20 мг 3 раза/сут), затем суточную дозу увеличивают до 80-120 мг, разделяя ее на 2-3 приема. Максимальная суточная доза – 240 мг.

Для профилактики мигрени, а также при эссенциальном треморе препарат назначают в начальной дозе 120 мг (по 40 мг 3 раза/сут).

Для профилактики повторного инфаркта миокарда терапию Обзиданом следует начинать между 5-м и 21-м днем после перенесенного инфаркта миокарда. Препарат назначают в дозе 120 мг (по 40 мг 3 раза)/сут в течение 2-3 дней, а затем продолжают прием препарата по 80 мг 2 раза/сут. При необходимости можно назначать в суточной дозе 180-240 мг в 2-3 приема.

При гипертиреозе (симптоматическая терапия) Обзидан назначают по 40 мг 3-4 раза/сут.

При нарушении функции почек необходимо снизить первоначальную дозу или увеличить интервал между приемами препарата.

При нарушении функции печени необходимо снижение дозы препарата.

Побочное действие:

Со стороны сердечно-сосудистой системы: синусовая брадикардия, AV-блокада, сердечная недостаточность, сердцебиение, нарушение проводимости миокарда, аритмии, снижение АД, ортостатическая гипотензия, боль в груди, спазм периферических артерий, похолодание конечностей.

Со стороны пищеварительной системы: сухость во рту, тошнота, рвота, диарея, запор, боли в эпигастральной области, нарушение функции печени, изменение вкуса.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: редко – головная боль, бессонница, кошмарные сновидения, астенический синдром, снижение способности к быстрым психическим и двигательным реакциям, возбуждение, депрессия, парестезии, повышенная утомляемость, слабость, головокружение, сонливость, спутанность сознания или кратковременная потеря памяти, галлюцинации, тремор.

Со стороны дыхательной системы: ринит, заложенность носа, одышка, бронхоспазм, ларингоспазм.

Со стороны обмена веществ: гипогликемия (у больных сахарным диабетом типа 1), гипергликемия (у больных сахарным диабетом типа 2).

Со стороны органов чувств: сухость слизистой оболочки глаз (уменьшение секреции слезной жидкости), нарушение

остроты зрения, кератоконъюнктивит.

Со стороны половой системы: снижение либидо, снижение потенции.

Дерматологические реакции: алопеция, обострение течения псориаза, усиление потоотделения, гиперемия кожи, экзантема, псориазоподобные кожные реакции.

Со стороны эндокринной системы: снижение функции щитовидной железы.

Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд.

Со стороны лабораторных показателей: агранулоцитоз, лейкопения, тромбоцитопения; повышение активности печеночных трансаминаз и уровня билирубина.

Прочие: мышечная слабость, боль в спине или суставах, боль в грудной клетке, синдром отмены.

Передозировка:

Симптомы: брадикардия, головокружение или обморок, снижение АД, аритмии, затрудненное дыхание, цианоз ногтей пальцев или ладоней, судороги, остановка сердца (при в/в введении).

Лечение: промывание желудка, назначение активированного угля (при приеме внутрь); при нарушении AV-проводимости – в/в вводят 1-2 мг атропина, эпинефрина, при низкой эффективности осуществляют постановку временного кардиостимулятора; при желудочковой экстрасистолии - лидокаин (препараты IA класса не применяются); при артериальной гипотензии (больной должен находиться в положении лежа с опущенным головным концом кровати), если нет признаков отека легких, в/в вводят плазмозамещающие растворы, при неэффективности - эпинефрин, допамин, добутамин; при судорогах – в/в диазепам; при бронхоспазме - ингаляционно или парентерально бета-адреностимуляторы.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение Обзидана при беременности возможно только в том случае, когда предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода. При необходимости применения в этот период следует проводить тщательное наблюдение за состоянием плода, т.к. прием Обзидана при беременности может вызвать внутриутробную задержку роста, гипогликемию и брадикардию у плода. За 48-74 ч до родов Обзидан следует отменить.

Применение Обзидана противопоказано в период лактации. При необходимости его применения в этот период грудное вскармливание следует прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении Обзидана с ингибиторами МАО наблюдается значительное усиления гипотензивного действия, поэтому данная комбинация противопоказана; перерыв в лечении между приемом ингибиторов МАО и Обзидана должен составлять не менее 14 дней.

При одновременном применении с диуретиками, резерпином, гидралазином и другими антигипертензивными препаратами, а также этанолом гипотензивный эффект Обзидана усиливается.

Гипотензивный эффект Обзидана ослабляют ГКС, НПВС (задержка натрия и блокирование синтеза простагландина почками), эстрогены (задержка натрия) и ингибиторы МАО.

Обзидан при одновременном применении усиливает действие тиреостатических и утеротонизирующих препаратов; уменьшает действие антигистаминных препаратов.

При одновременном применении с Обзиданом амиодарона, верапамила и дилтиазема усиливается выраженность отрицательного хроно-, ино- и дромотропного действия.

При в/в введении йодосодержащих рентгеноконтрастных препаратов на фоне приема Обзидана повышается риск развития анафилактических реакций.

Фенитоин при в/в введении, средства для ингаляционного наркоза (производные углеводородов) при одновременном применении с Обзиданом повышают выраженность кардиодепрессивного действия и вероятность снижения АД.

Обзидан при одновременном применении изменяет эффективность инсулина и пероральных гипогликемических препаратов, маскирует симптомы развивающейся гипогликемии (тахикардия, повышение АД).

Сердечные гликозиды, метилдопа, резерпин и гуанфацин, антиаритмические препараты при одновременном приеме с Обзиданом повышают риск развития или усугубления брадикардии, AV-блокады, остановки сердца и сердечной недостаточности.

Нифедипин при одновременном применении с Обзиданом может приводить к значительному снижению АД.

Обзидан удлиняет действие недеполяризующих миорелаксантов и антикоагулянтный эффект кумаринов.

Три- и тетрациклические антидепрессанты, антипсихотические лекарственные средства (нейролептики), этанол, седативные и снотворные препараты при одновременном применении с Обзиданом усиливают угнетающее действие на ЦНС.

Негидрированные алкалоиды спорыньи при одновременном применении с Обзиданом повышают риск развития нарушений периферического кровообращения.

Применение Обзидана повышает вероятность развития тяжелых системных реакций (анафилаксии) на фоне введения аллергенов, используемых для иммунотерапии или для кожных проб.

Фармакокинетическое взаимодействие

Циметидин увеличивает биодоступность пропранолола.

Пропранолол повышает концентрацию лидокаина в плазме крови, снижает клиренс теофиллина.

При одновременном назначении пропранолола с производными фенотиазина концентрации обоих препаратов в плазме крови повышаются.

Пропранолол снижает клиренс ксантинов (кроме дифиллина).

Сульфасалазин увеличивает концентрацию пропранолола в плазме крови (тормозит метаболизм), рифампицин укорачивает период полувыведения пропранолола.

Особые указания и меры предосторожности:

При назначении Обзидана следует систематически контролировать ЧСС и АД (в начале лечения – ежедневно, затем 1 раз в 3-4 мес), ЭКГ.

У пожилых пациентов следует проводить контроль функции почек (1 раз в 4-5 мес).

В случае появления у пациентов пожилого возраста нарастающей брадикардии (менее 50 уд./мин), артериальной гипотензии (систолическое АД ниже 100 мм рт.ст.), AV-блокады, бронхоспазма, желудочковых аритмий, тяжелых нарушений функции печени и/или почек, необходимо уменьшить дозу препарата или прекратить лечение.

Следует обучить больного методике подсчета ЧСС и проинструктировать о необходимости врачебной консультации при ЧСС менее 50 уд./мин.

Рекомендуется прекратить терапию Обзиданом при развитии депрессии, вызванной его приемом.

Пациенты, пользующиеся контактными линзами, должны учитывать, что на фоне лечения Обзиданом возможно уменьшение продукции слезной жидкости.

Перед назначением Обзидана пациентам с сердечной недостаточностью (ранние стадии) необходимо применять сердечные гликозиды и/или диуретики.

Лечение ИБС и стойкой артериальной гипертензии должно быть длительным. Прием Обзидана возможен в течение нескольких лет.

Прекращение лечения осуществляют постепенно, под наблюдением врача, резкая отмена может усилить ишемию миокарда, болевой синдром при стенокардии, ухудшить толерантность к физической нагрузке. Отмену Обзидана проводят в течение 2 недель и более, постепенно снижая дозу (на 25% каждые 3-4 дня).

У больных сахарным диабетом применение препарата проводят под контролем содержания глюкозы крови (1 раз в 4-5 мес). При назначении Обзидана пациентам, получающим гипогликемические препараты, следует соблюдать осторожность, поскольку во время продолжительных перерывов в приеме пищи может развиться гипогликемия. Причем такие ее симптомы, как тахикардия или тремор будут маскироваться за счет действия Обзидана. Пациентов следует предупредить, что основным симптомом гипогликемии во время лечения Обзиданом является повышенное потоотделение.

С осторожностью следует назначать Обзидан совместно с гипогликемическими средствами (опасность возникновения гипогликемии на фоне терапии инсулином и гипергликемии – на фоне приема пероральных гипогликемических средств).

При тиреотоксикозе Обзидан может маскировать определенные клинические признаки гипертиреоза (например, тахикардию). Резкая отмена препарата у больных тиреотоксикозом противопоказана, поскольку способна усилить симптоматику.

При одновременном приеме клонидина его прием может быть прекращен только через несколько дней после отмены Обзидана.

При феохромоцитоме Обзидан назначают только в сочетании с альфа-адреноблокаторами.

Препараты, снижающие запасы катехоламинов (например, резерпин) могут усилить действие Обзидана, поэтому пациенты, принимающие сочетания данных препаратов, должны находиться под постоянным наблюдением врача на предмет выявления артериальной гипотензии и брадикардии.

На фоне лечения Обзиданом следует избегать в/в введения верапамила, дилтиазема.

За несколько дней перед проведением общего наркоза хлороформом или эфиром необходимо прекратить прием препарата (повышение риска угнетения функции миокарда и развития артериальной гипотензии).

Следует отменять препарат перед исследованием содержания в крови и моче катехоламинов, норметанефрина и виниламидальной кислоты; титров антинуклеарных антител.

У пациентов, злоупотребляющих курением, эффективность Обзидана снижается.

Во время лечения Обзиданом не рекомендуется принимать алкоголь (возможно резкое снижение АД).

В период приема Обзидана следует избегать использования натуральной лакрицы; пища, богатая белком, способна увеличить биодоступность пропранолола.

Эффективность и безопасность применения Обзидана у детей и подростков в возрасте до 18 лет не установлены.

В период лечения Обзиданом необходимо воздерживаться от вождения автотранспорта и занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в защищенном от света, недоступном для детей месте при температуре от 15° до 25°С.

Срок годности:

5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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