Од-Неб



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки почти белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с крестообразной делительной риской на одной стороне.

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

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 83.45 мг, крахмал кукурузный - 18 мг, кроскармеллоза натрия - 5.4 мг, полисорбат 80 - 0.22 мг, гипромеллоза - 1.8 мг, кремния диоксид коллоидный - 0.23 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 30 мг, магния стеарат - 0.45 мг.

10 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Небиволол является липофильным, кардиоселективным бета$_1$-адреноблокатором третьего поколения с вазодилатирующими свойствами. Оказывает антигипертензивное, 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 релаксирующего фактора оксида азота.

Небиволол представляет собой рацемат, состоящий из двух энантиомеров: SRRR-небиволола (D-небиволола) и RSSS-небиволола (L-небиволола), сочетающий два 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 сосудорасширяющее действие за счет модуляции высвобождения эндотелиального релаксирующего фактора оксида азота из эндотелия сосудов. Антигипертензивный эффект развивается на 2-5 день лечения, стабильное действие отмечается через 1 месяц. Данный эффект сохраняется при длительном лечении. Антигипертензивное действие обусловлено также уменьшением активности ренин-ангиотензин-альдостероновой системы (прямо не коррелирует с изменением активности ренина в плазме крови).

Применение небиволола улучшает показатели системной и внутрисердечной гемодинамики. Небиволол урежает ЧСС в покое и при физической нагрузке, уменьшает конечное диастолическое давление левого желудочка, снижает ОПСС, улучшает диастолическую функцию сердца (снижает давление наполнения), увеличивает фракцию выброса, уменьшает массу миокарда и индекс массы миокарда.

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

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

Фармакокинетика

Всасывание и распределение

После приема внутрь небиволол быстро абсорбируется из ЖКТ. Прием пищи не оказывает влияние на всасывание, 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.

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.

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

Метаболизм и выведение

Небиволол активно метаболизируется, частично с образованием активных гидроксиметаболитов. Скорость метаболизма небиволола путем ароматического гидроксилирования генетически определена окислительным полиморфизмом и зависит от изофермента CYP 2D6.

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:

— тяжелые нарушения функции печени;

— острая сердечная недостаточность;

— кардиогенный шок;

— хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации (требующая проведения инотропной терапии);

— СССУ, включая синоатриальную блокаду;

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

— бронхоспазм и тяжелые формы бронхиальной астмы;

— феохромоцитома (без одновременного применения альфа-адреноблокаторов):

— депрессия;

— метаболический ацидоз;

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

— артериальная гипотензия;

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

— возраст до 18 лет;

— непереносимость лактозы, дефицит лактазы или глюкозо-галактозная мальабсорбция (препарат содержит лактозу);

— одновременный прием с флоктафенином, сультопридом;

— повышенная чувствительность к небивололу или одному из компонентов препарата.

С *осторожностью* следует применять препарат при выраженной почечной недостаточности (КК менее 20 мл/мин), нарушениях функции печени легкой и умеренной степени тяжести, сахарном диабете, гипертиреозе, проведении десенсибилизирующей терапии, псориазе, AV-блокаде I степени, стенокардии Принметала, хронической обструктивной болезни легких, у пациентов пожилого возраста (старше 65 лет).

Способ применения и дозы:

Препарат ОД-Неб 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 для лечения артериальной гипертензии и ИБС составляет 5 мг (1 таб.) 1 раз/сут. Оптимальный эффект становится выраженным через 1-2 недели лечения, а в ряде случаев - через 4 недели. Возможно применение препарата в монотерапии или в составе комбинированной терапии.

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

У **больных с почечной недостаточностью**, а также у **пациентов в возрасте 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 менее 20 мл/мин)** и у **пациентов с тяжелыми заболеваниями печени** максимальная суточная доза составляет 10 мг.

Увеличение дозы у таких пациентов надо проводить с особой осторожностью.

Хроническая сердечная недостаточность

Лечение хронической сердечной недостаточности должно начинаться с постепенного увеличения дозы до достижения индивидуальной оптимальной поддерживающей дозы.

Подбор дозы в начале лечения необходимо осуществлять по следующей схеме, выдерживая двухнедельные интервалы и основываясь на переносимости этой дозы пациентом: доза, составляющая 1.25 мг препарата ОД-Неб (1/4 таб. по 5 мг) 1 раз/сут, может быть увеличена сначала до 2.5-5 мг препарата ОД-Неб (1/2 таб. по 5 мг - 1 таб.), а затем - до 10 мг (2 таб. по 5 мг) 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 при терапии ХСН составляет 10 мг препарата ОД-Неб 1 раз/сут. Во время титрования рекомендуется регулярный контроль АД, ЧСС и симптомов выраженности ХСН.

Во время фазы титрации в случае ухудшения течения хронической сердечной недостаточности или непереносимости препарата рекомендуется снизить дозу препарата ОД-Неб или в случае необходимости немедленно прекратить его прием (в случае ярко выраженной артериальной гипотензии, ухудшении течения ХСН с острым отеком легких, в случае развития кардиогенного шока, симптоматической брадикардии или 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, спутанность сознания, обморок.

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, одышка, нарушения ритма сердца, синдром Рейно, периферические отеки, кардиалгия, усугубление течения ХСН[1].

Со стороны кожных покровов: кожный зуд, сыпь эритематозного характера.

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.

Аллергические реакции: ангионевротический отек, крапивница, аллергический васкулит.

Прочие: фотодерматоз, гипергидроз, обострение течения псориаза, сухость слизистой оболочки глаза.

[1] - данный побочный эффект преимущественно возникает во время титрации дозы препарата.

Передозировка:

Симптомы: тошнота, рвота, цианоз, выраженное снижение АД, выраженная брадикардия, бронхоспазм, AV-блокада, кардиогенный шок, острая сердечная недостаточность, потеря сознания, 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 вводят плазмозамещающие растворы и вазопрессоры.

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-III ст.) 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-адреномиметики. При желудочковой экстрасистолии - лидокаин (нельзя вводить антиаритмические средства IA класса).

Применение при беременности и кормлении грудью:

При беременности препарат назначают только по строгим показаниям, когда 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.

Нет данных о выделении небиволола в грудное молоко. Поэтому прием препарата ОД-Неб не рекомендуется женщинам в период кормления грудью. Если применение препарата ОД-Неб в период лактации необходимо, то грудное вскармливание следует прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Флоктафенин: в случае шока или артериальной гипотензии, вызванных притмом флоктафенина, бета-адреноблокаторы ослабляют компенсаторные механизмы сердечно сосудистой системы.

Сультоприд: повышение риска возникновения желудочковой аритмии, особенно по типу "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 CYP 2D6,* 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-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 ОД-Неб пациентам с псориазом следует тщательно соотнести предполагаемую пользу от применения препарата и возможный риск обострения течения псориаза.

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

Перед проведением хирургического вмешательства следует предупредить врача-анестезиолога о том, что пациент принимает небиволол.

ОД-Неб не влияет на концентрацию глюкозы в плазме крови у пациентов с сахарным диабетом. Тем не менее, следует соблюдать осторожность при лечении этих пациентов, поскольку небиволол может маскировать определенные симптомы гипогликемии (например, тахикардию), вызванные применением гипогликемических средств. Контроль концентрации глюкозы в плазме крови следует проводить 1 раз в 4-5 мес (у больных с сахарным диабетом).

Бета-адреноблокаторы следует применять с осторожностью у пациентов с ХОБЛ, поскольку может усилиться бронхоспазм.

При гиперфункции щитовидной железы препарат нивелирует тахикардию.

Бета-адреноблокаторы могут повышать чувствительность к аллергенам и тяжесть анафилактических реакций. Такие пациенты могут быть невосприимчивы к обычным дозам эпинефрина, применяющимся для их купирования.

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 гипертензией 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 достаточном контроле АД возможно повышение дозы на 2.5 мг. Рекомендуемая доза - 5 мг/сут. У некоторых пациентов могут возникать побочные эффекты, чаще всего головокружение, из-за сниженного 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 увеличении дозы.

При нарушениях функции почек

У больных с почечной недостаточностью 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 менее 20 мл/мин) максимальная суточная доза составляет 10 мг.

При нарушениях функции печени

У пациентов с тяжелыми заболеваниями печени максимальная суточная доза составляет 10 мг.

Противопоказано применение при выраженных нарушениях функции печени. С осторожностью следует применять при нарушениях функции печени легкой и умеренной степени тяжести.

Применение в пожилом возрасте

У пациентов в возрасте старше 65 лет начальная доза составляет 2.5 мг/сут (1/2 таб. по 5 мг). При необходимости дозу увеличивают до 5 мг.

Применение в детском возрасте

Противопоказан детям и подросткам до 18 лет.

Условия хранения:

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

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Od-Neb