Тенолол



Полезные ссылки:

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

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Кардиоселективный бета$_1$-адреноблокатор без внутренней симпатомиметической активности. Оказывает антигипертензивное, антиангинальное и антиаритмическое действие.

Уменьшает стимулирующее влияние на сердце симпатической иннервации и циркулирующих в крови катехоламинов. Обладает отрицательным хроно-, дромо-, батмо- и инотропным действием: уменьшает ЧСС, угнетает проводимость и возбудимость, снижает сократимость миокарда. ОПСС в начале применения бета-адреноблокаторов (в первые 24 ч после перорального приема) увеличивается (в результате рециркулярного возрастания активности α-адренорецепторов и устранения стимуляции β_2-адренорецепторов), через 1-3 дня возвращается к исходному, а при длительном применении снижается.

Гипотензивный эффект связан с уменьшением минутного объема крови, снижением активности ренин-ангиотензиновой системы (имеет большее значение для больных с исходной гиперсекрецией ренина), чувствительности барорецепторов дуги аорты (не происходит усиления их активности в ответ на снижение АД) и влиянием на ЦНС; проявляется снижением как систолического, так и диастолического АД, уменьшением ударного объема и минутного объема. В средних терапевтических дозах не оказывает влияния на тонус периферических артерий.

Антиангинальный эффект определяется снижением потребности миокарда в кислороде в результате уменьшения ЧСС (удлинение диастолы и улучшение перфузии миокарда) и сократимости, а также снижением чувствительности миокарда к воздействию симпатической иннервации. Уменьшение ЧСС происходит в покое и при физической нагрузке. 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 синусного и эктопического водителей ритма и замедлением AV проводимости. Угнетение проведения импульсов отмечается преимущественно в антеградном и в меньшей степени в ретроградном направлениях через AV узел и по дополнительным путям.

В отличие от неселективных бета-адреноблокаторов, при применении в средних терапевтических дозах оказывает менее выраженное влияние на органы, содержащие β_2-адренорецепторы (поджелудочная железа, скелетные мышцы, гладкая мускулатура периферических артерий, бронхов и матки), и на углеводный обмен; выраженность атерогенного действия не отличается от действия пропранолола. В меньшей степени выражено отрицательное батмо-, хроно-, ино- и дромотропное действие. При применении в высоких дозах (более 100 мг/сут) вызывает блокаду обоих подтипов β-адренорецепторов.

Гипотензивное действие продолжается 24 ч, при регулярном приеме стабилизируется к концу 2 недели лечения. Отрицательное хронотропное действие проявляется через 1 ч после приема, достигает максимума спустя 2-4 ч и

продолжается до 24 ч.

Фармакокинетика

После приема внутрь абсорбция из ЖКТ составляет 50-60%, биодоступность - 40-50%. Практически не метаболизируется в организме. Плохо проникает через ГЭБ. Связывание с белками плазмы - 6-16%.

$T_{1/2}$ составляет 6-9 ч. Выводится главным образом почками в неизмененном виде. Нарушения функции почек сопровождаются главным образом увеличением $T_{1/2}$ и кумуляцией: при КК менее 35 мл/мин $T_{1/2}$ составляет 16-27 ч, при КК менее 15 мл/мин - более 27 ч, при анурии удлиняется до 144 ч. Выводится в ходе гемодиализа.

У пациентов пожилого возраста $T_{1/2}$ увеличивается.

Показания к применению:

Артериальная гипертензия, гипертонический криз, пролапс митрального клапана, гиперкинетический кардиальный синдром функционального генеза, нейроциркуляторная дистония по гипертоническому типу.

Лечение: ИБС, стенокардия (напряжения, покоя и нестабильная).

Лечение и профилактика: инфаркт миокарда (острая фаза при стабильных показателях гемодинамики, вторичная профилактика).

Аритмии (в т.ч. при общей анестезии, врожденном синдроме удлиненного интервала QT, инфаркте миокарда без признаков хронической сердечной недостаточности, тиреотоксикозе), синусовая тахикардия, пароксизмальная предсердная тахикардия, наджелудочковая и желудочковая экстрасистолия, наджелудочковая и желудочковая тахикардия, мерцательная тахиаритмия, трепетание предсердий.

Эссенциальный и старческий тремор, ажитация и тремор при абстинентном синдроме.

В составе комплексной терапии: гипертрофическая обтурационная кардиомиопатия, феохромоцитома (только вместе с альфа-адреноблокаторами), тиреотоксикоз; мигрень (профилактика).

Относится к болезням:

- Абстинентный синдром
- Анестезия
- Гипертензия
- Гипертонический криз
- Гипертония
- Желудочковая тахикардия
- Желудочковая экстрасистолия
- Инфаркт миокарда
- Кардиомиопатия
- Кардит
- Мигрень
- Миокардит
- Нейроциркуляторная дистония
- Пароксизм
- Сердечная недостаточность
- Синусит
- Синусовая тахикардия
- Стенокардия
- Тахикардия
- Тиреотоксикоз
- Тремор
- Феохромоцитома
- Экстрасистолия

Противопоказания:

AV-блокада II и III степени, синоатриальная блокада, СССУ, брадикардия, (ЧСС менее 40 уд./мин), артериальная гипотензия (в случае применения при инфаркте миокарда, систолическое АД менее 100 мм рт.ст.), кардиогенный шок, хроническая сердечная недостаточность IIБ-III стадии, острая сердечная недостаточность, стенокардия Принцметала, период лактации, одновременный прием ингибиторов МАО, повышенная чувствительность к атенололу.

Способ применения и дозы:

Устанавливают индивидуально. Обычная доза для взрослых - внутрь, в начале лечения составляет 25-50 мг 1 раз/сут. При необходимости дозу постепенно увеличивают. При нарушении функции почек пациентам с КК 15-35 мл/мин - по 50 мг/сут; при КК менее 15 мл/мин - по 50 мг через день.

Максимальная доза: взрослым при приеме внутрь - 200 мг/сут в 1 или 2 приема.

Побочное действие:

Со стороны сердечно-сосудистой системы: в отдельных случаях - брадикардия, артериальная гипотензия, нарушения AV-проводимости, появление симптомов сердечной недостаточности.

Со стороны пищеварительной системы: в начале терапии возможны тошнота, запоры, диарея, сухость во рту.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: в начале терапии возможны усталость, головокружение, депрессия, легкая головная боль, нарушения сна, ощущение холода и парестезии в конечностях, снижение реакционной способности пациента, уменьшение секреции слезной жидкости, конъюнктивит.

Со стороны эндокринной системы: снижение потенции, гипогликемические состояния у больных с сахарным диабетом.

Со стороны дыхательной системы: у предрасположенных пациентов - появление симптомов бронхиальной обструкции.

Аллергические реакции: кожный зуд.

Прочие: усиление потоотделения, покраснение кожи.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Атенолол проникает через плацентарный барьер, поэтому применение при беременности возможно только в том случае, если предполагаемая польза для матери превышает возможный риск для плода.

Атенолол выделяется с грудным молоком, поэтому при необходимости применения в период лактации рекомендуется прекратить грудное вскармливание.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении диуретиков усиливается антигипертензивное действие.

При одновременном применении средств для ингаляционного наркоза повышается риск усиления кардиодепрессивного действия и развития артериальной гипотензии.

Имеются сообщения о развитии брадикардии и артериальной гипотензии при одновременном применении алкурония хлорида.

При одновременном применении верапамила усиливается отрицательное инотропное действие, развивается брадикардия, брадиаритмия, выраженные нарушения проводимости; описаны случаи постуральной гипотензии, головокружения, левожелудочковой недостаточности, летаргии. Под влиянием верапамила фармакокинетические параметры атенолола существенно не меняются, хотя описан случай повышения AUC атенолола.

При одновременном применении дизопирамида повышается C_{ss}, уменьшается клиренс дизопирамида, возможно нарушение проводимости.

При одновременном применении дипиридамола описан случай развития брадикардии и затем асистолии (при проведении ЭКГ-теста с дипиридамолом у пациента, получающего атенолол).

При одновременном применении индометацина, напроксена и других НПВС возможно уменьшение антигипертензивного действия атенолола, что в определенной степени обусловлено нарушением (под влиянием НПВС) синтеза в почках и высвобождения в кровоток простагландинов PGA и PGE, которые оказывают сильный вазодилатирующий эффект на периферические артериолы.

При одновременном применении инсулина возможно повышение АД.

При одновременном применении клонидина возможен аддитивный гипотензивный эффект, седативное действие,

сухость во рту.

При одновременном применении кофеина возможно уменьшение эффективности атенолола.

При одновременном применении низатидина описан случай усиления кардиодепрессивного действия.

При одновременном применении нифедипина описаны случаи выраженной артериальной гипотензии и сердечной недостаточности, что может быть обусловлено усилением угнетающего влияния нифедипина на миокард.

При одновременном применении орлистата уменьшается антигипертензивное действие атенолола, что может привести к значительному повышению АД, развитию гипертонического криза.

При одновременном применении прениламина возможно увеличение интервала QT.

При одновременном применении хлорталидона усиливается антигипертензивное действие.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью следует применять при сахарном диабете, ХОБЛ (в т.ч. бронхиальная астма, эмфизема легких), метаболическом ацидозе, гипогликемии; аллергических реакциях в анамнезе, хронической сердечной недостаточности (компенсированной), облитерирующих заболеваниях периферических артерий (перемежающаяся хромота, синдром Рейно), феохромоцитоме, печеночной недостаточности, хронической почечной недостаточности, миастении, тиреотоксикозе, депрессии (в т.ч. в анамнезе), псориазе, при беременности, у пациентов пожилого возраста, в педиатрии (эффективность и безопасность не определены).

При применении атенолола возможно уменьшение продукции слезной жидкости, что имеет значение для пациентов, пользующихся контактными линзами.

Отмену атенолола после продолжительного курса лечения следует проводить постепенно под наблюдением врача.

При прекращении комбинированного применения атенолола и клонидина лечение клонидином продолжают еще несколько дней после отмены атенолола, в противном случае возможно возникновение выраженной артериальной гипертензии.

При необходимости проведения ингаляционного наркоза у пациентов, получающих атенолол, за несколько дней до проведения наркоза необходимо прекратить прием атенолола или подобрать средство для наркоза с минимальным отрицательным инотропным действием.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

У пациентов, деятельность которых требует повышенной концентрации внимания, вопрос об амбулаторном применении атенолола следует решать только после оценки индивидуальной реакции.

При нарушениях функции почек

С осторожностью следует применять при хронической почечной недостаточности. При нарушении функции почек пациентам с КК 15-35 мл/мин - по 50 мг/сут; при КК менее 15 мл/мин - по 50 мг через день.

При нарушениях функции печени

С осторожностью следует применять при печеночной недостаточности.

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью следует применять у пациентов пожилого возраста.

Применение в детском возрасте

С осторожностью следует применять в педиатрии (эффективность и безопасность не определены).

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