Вискалдикс



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки белого или почти белого цвета, круглые, плоские, с фаской, с дугообразной гравировкой "VISKAL" на одной стороне, без запаха или почти без запаха; допускается небольшая неровность поверхности таблеток.

	1 таб.
пиндолол	10 мг
клопамид	5 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, крахмал кукурузный, магния стеарат.

10 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Комбинированный антигипертензивный препарат, содержащий бета-адреноблокатор и тиазидный диуретик, что взаимно дополняет механизм антигипертензивного действия.

Пиндолол - неселективный бета-адреноблокатор с внутренней симпатомиметической активностью (ISA). Пиндолол частично возбуждает β_1- и β_2-адренорецепторы, особенно сильно влияет на β_2-адренорецепторы. Обладает мембраностабилизирующим действием, что не имеет клинического значения. У пациентов с преобладающей симпатической активностью пиндолол уменьшает ЧСС и сердечный выброс, однако лишь в незначительной степени уменьшает ЧСС в покое.

Относительно слабо подавляет вызванное физической нагрузкой увеличение ЧСС, снижает сократимость миокарда, а также незначительно замедляет AV-проводимость. Пиндолол повышает сопротивление дыхательных путей.

Как и другие бета-адреноблокаторы, пиндолол снижает АД, ЧСС и силу сердечных сокращений, что приводит к снижению потребления миокардом кислорода.

Путем снижения ЧСС и соответствующего удлинения диастолы пиндолол улучшает кровоснабжение и оксигенацию областей миокарда с нарушенным кровотоком. Благодаря такому действию пиндолол уменьшает частоту приступов стенокардии и повышает физическую активность.

В связи с частичным возбуждающим действием на β_2-адренорецепторы гладких мышц пиндолол имеет клинически значимый сосудорасширяющий эффект. При артериальной гипертензии препарат снижает повышенное ОПСС и таким образом поддерживает или даже улучшает кровоснабжение различных органов и тканей.

В целом пиндолол не оказывает нежелательного воздействия на содержание липопротеинов плазмы крови, даже при длительном применении.

Клопамид - сульфонамидный диуретик. Химическая структура клопамида отличается от структуры тиазидов. Однако он имеет тот же механизм действия, что и тиазидные препараты.

Клопамид - слабый диуретик. Подавляя абсорбцию ионов натрия и хлора в дистальных почечных канальцах, клопамид усиливает секрецию этих ионов и воды. Как и тиазиды, клопамид подавляет реабсорбцию натрия в кортикальном сегменте восходящего колена петли Генле и дистальных почечных канальцах. Однако он не имеет такого же эффекта в медуллярном сегменте и поэтому не влияет на осмотический градиент и концентрационную способность почек. В связи с этим, т.к. в этом сегменте нефрона выводится только 3-5% натрия, клопамид усиливает экскрецию натрия и воды в значительно меньшей степени и его диуретический эффект гораздо слабее, чем эффекты таких диуретиков (фуросемида и этакриновой кислоты). Особенно в начале курса лечения, клопамид может вызвать значительную потерю ионов натрия, степень которой может снизиться при длительной терапии. В отличие от других диуретиков, клопамид усиливает реабсорбцию ионов кальция.

Клопамид обладает диабетогенным потенциалом и повышает уровень мочевой кислоты, холестерина и триглицеридов в плазме крови. Однако клиническое значение его неблагоприятных метаболических эффектов существенно различно у разных пациентов.

На протяжении первых 2-3 недель приема препарата антигипертензивный эффект клопамида в основном связан со снижением объема внеклеточной жидкости благодаря экскреции ионов натрия, в результате этого снижается венозное давление, снижается сердечный выброс, это приводит к снижению АД. В дальнейшем при длительном приеме препарата сердечный выброс возвращается к исходному уровню, а ОПСС . Полагают, что это частично вызвано как расширением сосудов в связи с потерей жидкости из сосудистой стенки, так и выведением натрия, что по некоторым наблюдениям ослабляет сократительную реакцию гладкомышечных клеток на норэпинефрин.

Диурез и натрийурез начинаются через 1-2 ч после приема препарата и достигают максимума через 2-4 ч. В зависимости от дозы, эффект сохраняется 12-24 ч. Максимальный антигипертензивный эффект клопамида развивается примерно после 2-4 недель приема.

Активные вещества препарата Вискалдикс вызывают суммарный гипотензивный эффект.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь быстрая и почти полная (>95%) абсорбция и незначительный (13%) метаболизм при "первом прохождении" через печень обусловливают высокую (87%) биодоступность пиндолола. C_{max} активного вещества в плазме крови достигается через 1 ч после приема препарата внутрь. Пиндолол имеет линейную фармакокинетику в диапазоне доз 5-15 мг.

После приема внутрь абсорбция клопамида составляет около 90%. C_{max} в плазме крови достигается через 1.9-2.5 ч после приема внутрь.

Распределение

Связывание с белками плазмы составляет около 40%. V_d составляет 2-3 л/кг. Благодаря липофильным свойствам пиндолол может проникать через ГЭБ. Пиндолол проникает через плацентарный барьер и в небольших количествах выделяется с грудным молоком. Отношение концентраций вещества в крови пупочного канатика и в крови матери составляет 0.7. Отношение концентраций пиндолола в молоке и крови матери равно 1.6

Связывание клопамида с белками плазмы составляет около 45%. V_d составляет 1.5 л/кг.

Метаболизм

Пиндолол метаболизируется в печени с образованием неактивных метаболитов.

Главный путь метаболизма клопамида (42.5%) - гидроксилирование до неактивного производного.

Выведение

Конечный $T_{1/2}$ составляет примерно 3-4 ч. Примерно 30-40% введенной дозы выводится в неизмененном виде с мочой, 60-70% выводится почками и печенью в форме неактивных метаболитов. Общий клиренс пиндолола составляет 500 мл/мин.

$T_{1/2}$ клопамида - 10 ч. Клопамид выводится почками, 20-30% - в неизмененном виде.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия мягкой и умеренной степени тяжести (в качестве монотерапии или, при необходимости, в сочетании с другими антигипертензивными средствами).

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия

Противопоказания:

Вискалдикс

— тяжелые нарушения функции почек и/или печени;

— повышенная чувствительность к компонентам препарата;

— повышенная чувствительность к сульфонамидам.

Пиндолол

— хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации, резистентная к обычным методам лечения;

— легочное сердце;

— выраженная брадикардия;

— AV-блокада II и III степени;

— СССУ;

— кардиогенный шок;

— артериальная гипотензия;

— стенокардия Принцметала;

— бронхиальная астма;

— ХОБЛ;

— тяжелые нарушения периферического кровообращения, синдром Рейно;

— одновременный прием ингибиторов МАО;

— одновременное применение с парентеральными блокаторами медленных кальциевых каналов производными фенилалкиламина (верапамил) или бензотиазепина (дилтиазем).

Клопамид

— гипокалиемия, гипонатриемия, гипохлоремия, гипокальциемия;

— острый гломерулонефрит;

— болезнь Аддисона;

— порфирия;

— острый приступ подагры;

— непереносимость лактозы;

— беременность;

— период лактации (грудное вскармливание);

— возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).

С *осторожностью* следует применять препарат при феохромоцитоме, ИБС, AV-блокаде I степени, нарушениях периферического кровообращения, при сахарном диабете, брадикардии, заболеваниях соединительной ткани (в т.ч. СКВ), подагре.

Способ применения и дозы:

Дозу препарата устанавливают индивидуально.

Рекомендуемая начальная доза - по 1 таб. утром. Суточную дозу можно увеличить до 2 таб., а при необходимости и до 3 таб./сут, если после 1-2 недель приема препарата не достигается удовлетворительный гипотензивный эффект.

В случае необходимости отмены препарата, дозу следует снижать постепенно.

Пациентам пожилого возраста коррекции режима дозирования не требуется.

При **легком или умеренном нарушении функции печени и/или почек** коррекции дозы не требуется

Побочное действие:

Со стороны сердечно-сосудистой системы: брадикардия, ортостатическая гипотензия, сердечная недостаточность, сердцебиение, аритмии, синдром Рейно и боль в груди; очень редко - нарушения проводимости. Возможно усиление ранее существовавших нарушений периферического кровообращения, похолодание конечностей.

Со стороны ЦНС: утомляемость, головокружение, головная боль, нарушение сна; редко - депрессия, галлюцинации, бессонница и кошмарные сновидения.

Со стороны половой системы: нарушение половой функции, импотенция.

Со стороны дыхательной системы: очень редко - одышка при физической нагрузке; в отдельных случаях – бронхоспазм (даже при отсутствии обструктивного заболевания легких).

Со стороны пищеварительной системы: нарушения функции ЖКТ; в основном - тошнота, боль в животе, диарея, запор, сухость во рту.

Со стороны костно-мышечной системы: мышечные спазмы и тремор.

Со стороны обмена веществ: гипогликемия, гипергликемия (у больных инсулин независимым сахарным диабетом); снижение толерантности к глюкозе при сахарном диабете, замедление нормализации уровня глюкозы в крови, снижение уровня холестерина-ЛПВП и повышение уровня триглицеридов, гипокалиемия, гипомагниемия, гипонатриемия, гипохлоремия, гипокальциемия, гиперурикемия, острый приступ подагры.

Дерматологические реакции: редко - изменения кожи, эритема, псориазоподобное поражение кожи, обратимая алопеция.

Аллергические реакции: крапивница.

Со стороны системы кроветворения: отдельных случаях - тромбоцитопения, лейкопения.

Прочие: в единичных случаях описано появление антиядерных антител.

Вискалдикс обычно хорошо переносится. Прием препарата Вискалдикс следует прекратить, если один из перечисленных выше симптомов наблюдается постоянно и его связь с применением препарата нельзя однозначно отвергнуть.

Передозировка:

Пиндолол является одним из наименее токсичных бета-адреноблокаторов. Токсических симптомов не отмечено ни у одного пациента, принявшего препарат в разовой дозе 480 мг.

Симптомы: тошнота, рвота, диарея, жажда, гипокалиемия, мышечная слабость, брадикардия или тахикардия, снижение АД, гипогликемия, головокружение, бессонница, спутанность сознания.

Лечение: необходима интенсивная терапия и тщательное наблюдение за пациентом (параметры кровообращения и дыхания, функция почек, контроль глюкозы крови, электролитов сыворотки крови) в сочетании с обычной неспецифической терапией (как можно скорее удалить невсосавшийся препарат с помощью промывания желудка и приема активированного угля), парентеральным введением жидкости и электролитов.

При выраженном снижении АД и брадикардии - атропин в/в в дозе 0.5-1 мг (при необходимости можно вводить более высокие дозы); если желаемый эффект не достигнут, рекомендуется имплантация временного водителя ритма.

Для купирования конкурентного бета-адреноблокирующего действия можно провести инфузию изопреналина (0.5-5 мкг/мин, не более 30 мкг/мин) или добутамина (2.5-10 мкг/кг/мин, не более 40 мкг/кг/мин).

При недостаточности кровообращения можно применять средства, повышающие внутриклеточный уровень цАМФ посредством механизмов, не связанных с β-адренорецепторами: струйное в/в введение глюкагона в дозе 8-10 мг,

которое можно повторить через 1 ч и при необходимости продолжить путем инфузии со скоростью 1-3 мг/ч.

При бронхоспазме можно ввести в/в аминофиллин или стимулятор бета-адренорецепторов (например, изопреналин) путем медленной в/в инъекции или ингаляционно.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Вискалдикс противопоказан при беременности и в период грудного вскармливания (в связи с риском развития повышенной чувствительности к сульфонамидам у ребенка).

Данные клинических исследований пиндолола при беременности отсутствуют. В клинических исследованиях других бета-адреноблокаторов не выявлено фетотоксических эффектов пиндолола. За новорожденными, матери которых получали пиндолол, необходимо установить тщательное наблюдение на срок от 2 до 5 дней из-за возможности развития брадикардии и гипогликемии, предположительно связанной с блокадой β-адренорецепторов.

Пиндолол в небольших количествах выделяется с грудным молоком. Соотношение концентраций активного вещества в грудном молоке и в крови матери равно 1.6. Полагают, что пиндолол, поступающий таким путем в организм новорожденного, не представляет для него опасности.

Клопамид может проникать через плацентарный барьер и повышать концентрации мочевой кислоты и креатинина в амниотической жидкости. Изменения электролитного баланса матери также могут оказать вредное влияние на плод. Если мать принимала клопамид во второй половине беременности, у новорожденного может возникнуть перинатальная тромбоцитопения.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Противопоказана комбинация Вискалдикса с парентеральными блокаторами медленных кальциевых каналов производными фенилалкиламина (верапамил) или бензотиазепина (дилтиазем); с ингибиторами МАО (теоретически риск выраженного снижения АД сохраняется в течение 14 дней после отмены ингибитора МАО), с препаратами лития (снижается выведение лития почками).

Комбинации, при которых требуется осторожность

Для пиндолола и клопамида

С другими антигипертензивными средствами - из-за повышения риска артериальной гипотензии и/или брадикардии.

С гликозидами наперстянки - риск брадикардии, нарушений проводимости; пиндолол не влияет на положительный инотропный эффект препаратов наперстянки, однако гликозиды наперстянки могут усилить гипокалиемию и вызвать аритмию.

С пероральными гипогликемическими средствами и инсулином - хотя и с более низкой вероятностью, пиндолол, являющийся бета-адреноблокатором с ISA, может усиливать гипогликемический эффект гипогликемических средств, гипогликемию в таких случаях можно выявить только по повышенному потоотделению). Больные сахарным диабетом, получающие Вискалдикс, должны научиться распознавать гипогликемические эпизоды по возникновению повышенного потоотделения. Клопамид может ослабить эффекты гипогликемических средств для приема внутрь.

С системными НПВС, кортикостероидами, тетракозактидом - вследствие задержки натрия и воды возможно уменьшение антигипертензивного действия пиндолола и клопамида.

Со средствами, влияющими на ЦНС (например, снотворными, транквилизаторами, три- и тетрациклическими антидепрессантами, нейролептиками) и этанолом - риск артериальной гипотензии.

Для пиндолола

С нитратами – т.к. имеется риск артериальной гипотензии.

При одновременном применении с пиндололом клонидин и гуанфацин могут спровоцировать более тяжелые симптомы отмены, поэтому при таких комбинациях Вискалдикс следует отменять первым.

С антиаритмическими средствами, блокаторами медленных кальциевых каналов производными фенилалкиламина (верапамил) или бензотиазепина (дилтиазем), для приема внутрь, парасимпатомиметиками - риск артериальной гипотензии, брадикардии и AV-блокады.

С другими средствами, имеющими отрицательные инотропный, хронотропный и дромотропный эффекты - риск усиления этих эффектов.

С алкалоидами спорыньи - опасность нарушений периферического кровообращения.

При одновременном применении пиндолола с фенотиазинами и бета-адреноблокаторами – взаимное повышение концентраций в плазме крови.

Со средствами для общей анестезии - угнетение функции сердца.

С α- и β-симпатомиметиками - риск артериальной гипертензии, выраженной брадикардии, возможность остановки средца.

С производными ксантинов - взаимное ослабление эффектов; бета-адреноблокаторы могут уменьшить клиренс теофиллина.

С ингибиторами микросомальных ферментов печени (в т.ч. с циметидином) – возможно повышение концентраций бета-адреноблокаторов в плазме крови и усиление их эффектов вследствие изменения их печеночного метаболизма.

Индукторы микросомальных ферментов печени (рифампицин и барбитураты) могут уменьшать эффективность бета-адреноблокаторов вследствие снижения их концентраций в плазме крови.

С баклофеном - возможно усиление антигипертензивного действия.

С лидокаином – возможно повышение концентрации лидокаина в плазме крови, что увеличивает риск побочных эффектов со стороны сердца и ЦНС.

С йодосодержащими рентгеноконтрастными средствами - пиндолол может подавлять компенсаторную сердечно-сосудистую реакцию при возможном шоке и артериальной гипотензии, вызванных рентгеноконтрастными средствами; по возможности, следует прерывать курс приема пиндолола перед проведением процедуры; если введение пиндолола необходимо, во время проведения процедуры следует иметь средства для проведения реанимационных мероприятий.

С амифостином - повышается риск выраженной артериальной гипотензии.

С мефлохином - повышение риска выраженной брадикардии.

Этанол может усилить седативное действие бета-адреноблокаторов.

Для клопамида

Гипокалиемия, которая может возникать на фоне приема клопамида, усиливает эффекты периферических миорелаксантов.

Тиазидные диуретики (в т.ч. клопамид) могут уменьшать эффекты антикоагулянтов.

Колестирамни связывает клопамид и снижает его абсорбцию и эффективность.

На фоне применения клопамида возможно ослабление эффектов эпинефрина и норэпинефрина.

Клопамид может замедлять выведение хинидина.

При одновременном применении клопамида и фуросемида наблюдается суммация диуретического эффекта.

Особые указания и меры предосторожности:

У пациентов с хронической сердечной недостаточностью следует принять меры для достижения состояния компенсации до начала приема препарата Вискалдикс.

В острой стадии инфаркта миокарда или у пациентов с инфарктом миокарда в анамнезе следует тщательно следить за параметрами гемодинамики во время приема Вискалдикса.

Из-за наличия ISA у пиндолола Вискалдикс не оказывает существенного влияния на дыхательную систему у пациентов с обструктивными заболеваниями легких и предрасположенностью к бронхоспазму. Однако такие эффекты нельзя полностью исключить, как и в случае применения других бета-адреноблокаторов. Поэтому Вискалдикс противопоказан пациентам с бронхиальной астмой или другим обструктивным заболеванием легких. При возникновении бронхоконстрикции применение препарата Вискалдикс следует немедленно прекратить и провести соответствующую бронхорасширяющую терапию (β_2-агонисты, производные теофиллина).

Перед хирургическими операциями следует предупредить врача-анестезиолога о том, что пациент принимает Вискалдикс, т.к. возможно усиление кардиодепрессивного действия общих анестетиков (например, галотана). Если перед хирургической операцией или общей анестезией или по другой причине необходимо прервать прием препарата Вискалдикс, снижение дозы следует производить постепенно (в идеальном случае – в течение 1-2 недель) и при необходимости назначить его заменитель, поскольку резкая отмена препарата Вискалдикс (особенно у пациентов с ИБС) может ухудшить состояние пациента и спровоцировать приступ стенокардии или даже инфаркт миокарда (вследствие повышения активности бета-адренорецепторов).

Несмотря на то, что из-за наличия ISA нежелательное действие пиндолола на периферическое кровообращение менее выражено, чем действие других бета-адреноблокаторов без ISA, Вискалдикс не следует назначать пациентам с тяжелыми окклюзионными поражениями периферических сосудов и синдромом Рейно. Симптомы (парестезии и похолодание нижних конечностей) существующей (возможно, латентной) недостаточности периферического кровообращения могут обостриться во время приема препарата Вискалдикс.

В период лечения следует регулярно контролировать АД, уровень глюкозы и мочевой кислоты в крови, а также электролиты сыворотки крови. Может возникнуть необходимость в дополнительном введении калия.

Лечение пациентов с сахарным диабетом или находящихся на диете требует особой осторожности, т.к. пиндолол может вызывать гипогликемию и маскирует некоторые из ее симптомов (например, тахикардию), причем единственным признаком гипогликемии иногда остается повышенное потоотделение. При назначении препарата больным сахарным диабетом может потребоваться новая коррекция углеводного обмена.

У больных феохромоцитомой Вискалдикс всегда следует сочетать с альфа-адреноблокаторами.

Имеющиеся у пациента нарушения AV-проводимости могут прогрессировать до состояния AV-блокады. Поэтому необходима осторожность при назначении Вискалдикса пациентам с AV-блокадой I степени.

У пациентов, предрасположенных к анафилактическим реакциям на различные антигены, Вискалдикс может усилить анафилактические реакции. В этих случаях могут потребоваться более высокие дозы прессорных аминов.

Дозу препарата следует снизить, когда ЧСС в покое составляет менее 50-55 уд./мин и это сопровождается клиническими симптомами.

Бета-адреноблокаторы усиливают симптомы псориаза.

Спортсменов следует предупредить о том, что пиндолол может дать положительный результат при некоторых допинговых тестах.

Пациентам с непереносимостью лактозы назначение противопоказано, т.к. 1 таб. Вискалдикса содержит 96.8 мг лактозы.

Использование в педиатрии

Препарат противопоказан у **детей и подростков в возрасте до 18 лет**. Данных о применении препарата в педиатрии не имеется.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Препарат может оказать отрицательное влияние на способность пациента к управлению транспортными средствами или механизмами, особенно в начале курса лечения и при сопутствующем приеме алкоголя. Поэтому степень соответствующих ограничений определяется для каждого пациента индивидуально в зависимости от наблюдаемых побочных эффектов.

При нарушениях функции почек

Противопоказано применение при тяжелых нарушениях функции почек, при остром гломерулонефрите.

При **легком или умеренном нарушении функции почек** коррекции дозы не требуется

При нарушениях функции печени

Противопоказано применение при тяжелых нарушениях функции печени.

При **легком или умеренном нарушении функции печени** коррекции дозы не требуется

Применение в детском возрасте

Клопамид противопоказан к применению в возрасте до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).

Условия хранения:

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

Срок годности:

5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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