Вискен



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Пиндолол

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки круглые, белого или серовато-белого цвета, плоские, в виде диска с фаской, с гравировкой "VISKEN" на одной стороне, без запаха или со слабым характерным запахом; допускается небольшая неровность поверхности таблеток.

	1 таб.
пиндолол	5 мг

Вспомогательные вещества: маннитол, целлюлоза микрокристаллическая, тальк, повидон, магния стеарат.

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

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 в плазме крови, даже

при длительном применении.

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.

Распределение и метаболизм

Связывание с белками плазмы составляет около 40%. V_d составляет 2-3 л/кг. Благодаря липофильным свойствам пиндолол может проникать через ГЭБ. Пиндолол метаболизируется в печени с образованием неактивных метаболитов.

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

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.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия (монотерапия или, при необходимости, в сочетании с другими антигипертензивными средствами);

— стабильная стенокардия (в качестве монотерапии или в сочетании с другими антиангинальными средствами с целью профилактики приступов);

— нарушения ритма сердца (фибрилляция или трепетание предсердий, наджелудочковая тахикардия, мерцательная тахиаритмия, наджелудочковая и желудочковая экстрасистолия, экстрасистолия, вызванная физической нагрузкой или препаратами дигиталиса);

— гиперкинетический кардиальный синдром.

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Желудочковая экстрасистолия
- Кардит
- Стенокардия
- Тахикардия
- Фиброз
- Экстрасистолия

Противопоказания:

— острая сердечная недостаточность;

— хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации;

— легочное сердце;

— выраженная брадикардия (ЧСС менее 40 уд./мин);

— AV-блокада II и III степени;

— синоатриальная блокада;

— СССУ;

— бронхиальная астма;

— ХОБЛ;

— кардиогенный шок;

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

— тяжелые нарушения функции почек;

— стенокардия Принцметала;

— сахарный диабет с кетоацидозом;

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

— одновременный прием ингибиторов МАО;

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

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

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью* следует применять препарат при AV-блокаде I степени, хронической сердечной недостаточности, феохромоцитоме, синдроме Рейно, миастении, тиреотоксикозе, депрессии (в т.ч. в анамнезе), при псориазе, печеночной недостаточности, хронической почечной недостаточности.

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь. Дозу следует подбирать индивидуально.

При лечении *артериальной гипертензии* рекомендуемая начальная суточная доза для взрослых - 5 мг 2 раза/сут. Поддерживающая доза составляет 10-30 мг/сут в 2-3 приема. Суточную дозу следует повышать постепенно с недельными интервалами до достижения необходимого антигипертензивного эффекта. Максимальная суточная доза - 30 мг.

Эффект препарата может наблюдаться с 1 недели его применения, однако выраженный терапевтический эффект развивается через 3-4 недели лечения.

При *стенокардии* доза составляет 5-20 мг/сут в 2-3 приема.

При *нарушениях сердечного ритма* препарат назначают в дозе 15-30 мг/сут за 2-3 приема.

При *гиперкинетическом кардиальном синдроме* назначают в дозе 5-20 мг/сут за 2-3 приема.

Пациентам пожилого возраста препарат можно назначать в обычной дозе.

При **легком или умеренном нарушении функции печени или почек** коррекции дозы не требуется. Однако при **выраженном нарушении функции печени** может возникнуть необходимость в снижении дозы, а при **почечной недостаточности тяжелой степени** препарат противопоказан.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: астения, утомляемость, головокружение, головная боль, нарушение сна, редко - депрессия, галлюцинации, бессонница, кошмарные сновидения, слабость, сонливость; редко - беспокойство, спутанность сознания, тремор.

Со стороны органов чувств: редко - нарушение зрения, уменьшение секреции слезной жидкости, конъюнктивит.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: синусовая брадикардия, ортостатическая гипотензия, сердечная недостаточность, сердцебиение, аритмии, уменьшение сократимости миокарда, боль в груди, снижение АД; редко - парестезии в конечностях (у больных с перемежающейся хромотой и синдромом Рейно); в отдельных случаях - нарушения проводимости миокарда, AV-блокада (вплоть до развития полной поперечной блокада и остановки сердца), усиление ранее существовавших нарушений периферического кровообращения (проявление ангиоспазма), похолодание нижних конечностей, синдром Рейно.

Дыхательная система: очень редко - одышка при физической нагрузке; в единичных случаях – ларинго- и бронхоспазм (даже при отсутствии обструктивного заболевания легких), заложенность носа , затруднение дыхания.

Со стороны пищеварительной системы: симптомы нарушения функций желудка и кишечника, в основном - тошнота, рвота, боль в животе и диарея; возможны сухость слизистой оболочки полости рта, нарушение функции печени (темная моча, желтушность склер или кожи, холестаз), изменение вкуса, изменение активности печеночных ферментов, билирубина.

Со стороны костно-мышечной системы: мышечные спазмы и тремор, артралгия; редко - миастения.

Со стороны обмена веществ: гипогликемия (у больных, получающих инсулин), гипергликемия (у больных инсулиннезависимым сахарным диабетом); снижение толерантности к глюкозе при сахарном диабете, замедление нормализации уровня глюкозы в крови, снижение холестерина-ЛПВП и повышение уровня триглицеридов.

Дерматологические реакции: редко - изменения кожи, эритема и экзантема, псориазоподобные кожные реакции, обострение течения псориаза, обратимая алопеция, усиление потоотделения.

Аллергические реакции: зуд, кожная сыпь, крапивница.

Со стороны системы кроветворения: тромбоцитопения (необычные кровотечения и кровоизлияния), агранулоцитоз, лейкопения.

Прочие: редко - снижение потенции, снижение либидо; синдром отмены - усиление приступов стенокардии, повышение АД; в редких случаях описано появление антиядерных антител.

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

Пиндолол обычно хорошо переносится. Возможны слабые преходящие побочные эффекты, которые сходны с побочными эффектами других бета-адреноблокаторов.

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: выраженная брадикардия, головокружение, AV-блокада, снижение АД, обморочные состояния, желудочковая экстрасистолия, сердечная недостаточность, цианоз ногтей пальцев или ладоней, судороги, затруднение дыхания, бронхоспазм.

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 приемом активированного угля.

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 применить 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:

Вискен не следует принимать при беременности и в период лактации (грудного вскармливания), за исключением случаев, когда ожидаемая польза терапии для матери превышает возможный риск для плода и/или грудного ребенка.

Пиндолол проникает через плацентарный барьер. Соотношение концентраций активного вещества в крови пупочного канатика и в крови матери составляет 0.7.

Данные клинических исследований пиндолола при беременности отсутствуют. Препарат может оказывать нежелательное влияние на плод: возможны внутриутробная задержка роста, гипогликемия, брадикардия.

В клинических исследованиях других бета-адреноблокаторов не выявлено фетотоксических эффектов.

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. Хотя пиндолол, попадающий таким путем в организм новорожденного, не представляет для него опасности, следует соблюдать осторожность в период грудного вскармливания, т.к. возможны побочные эффекты бета-адреноблокаторов (в т.ч. брадикардия*).*

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Противопоказана комбинация Вискена с парентеральными блокаторами медленных кальциевых каналов производнями фенилалкиламина (верапамил) или бензотиазепина (дилтиазем); с ингибиторами МАО (теоретически риск выраженного снижения АД сохраняется в течение 14 дней после отмены ингибитора МАО).

Комбинации, при которых требуется осторожность

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

С другими гипотензивными средствами (особенно группы гуанетидина, резерпина, альфа-метилдопа, нифедипина, клонидина и гуанфацина) - из-за риска артериальной гипотензии и/или брадикардии.

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

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

С гликозидами наперстянки - риск брадикардии, нарушений проводимости; пиндолол не влияет на положительный инотропный эффект препаратов наперстянки.

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

С алкалоидами спорыньи - опасность нарушений периферического кровообращения.

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

С фенотиазинами и бета-адреноблокаторами – взаимное повышение концентраций в плазме крови.

С фенитоином при в/в введении и 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.

При совместном применении с НПВС (например, с индометацином) возможно уменьшение гипотензивный эффект (предположительно вследствие подавления синтеза простагландинов в почках, а также задержки натрия и воды).

С эстрогенами – уменьшение гипотензивного эффекта вследствие задержки в организма ионов натрия.

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 пиндолол, должны научиться распознавать гипогликемические эпизоды по возникновению повышенного потоотделения.

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 аллергенами, используемыми для иммунотерапии, или экстрактами аллергенов для кожных проб - повышение риска возникновения тяжелых системных аллергических реакций или анафилаксии у пациентов, получающих пиндолол.

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 и персонал для реанимации.

Пиндолол удлиняет действие недеполяризующих миорелаксантов и антикоагулянтный эффект кумаринов.

С амифостином - повышается риск выраженной артериальной гипотензии или брадикардии.

С системными ГКС тетракозактидом (за исключением гидрокортизона при лечении болезни Аддисона) - задержка натрия и жидкости могут снизить гипотензивный эффект пиндолола.

Совместное назначение с антиаритмическими препаратами I класса (особенно с хинидиноподобными средствами) или III класса может вызвать выраженное удлинение интервала QT и тяжелые желудочковые нарушения ритма.

Пиндолол усиливает действие тиреостатических и утеротонизирующих средств; снижает действие антигистаминных средств.

М-холиноблокаторы устраняют реципрокное повышение активности парасимпатической нервной системы, возникающей на фоне действия пиндолола.

Особые указания и меры предосторожности:

У пациентов с незначительной или выраженной сердечной недостаточностью следует принять меры для достижения состояния компенсации до начала приема препарата Вискен.

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

Из-за наличия ISA у пиндолола Вискен 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 Вискен противопоказан пациентам с бронхиальной астмой или другим обструктивным заболеванием легких. При возникновении бронхоконстрикции применение препарата Вискен 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 Вискен, 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 Вискен, снижение дозы следует производить постепенно (в идеальном случае – в течение 1-2 недель) и при необходимости назначить его заменитель, поскольку резкая отмена препарата Вискен (особенно у пациентов с ИБС) может ухудшить состояние пациента и спровоцировать приступ стенокардии или даже инфаркт миокарда (вследствие повышения активности бета-адренорецепторов). Если наркоз дается по экстренным показаниям после применения бета-адреноблокаторов, необходимо тщательное мониторирование параметров сердечно сосудистой системы, а для профилактики брадикардии может потребоваться в/в введение 1-2 мл атропина сульфата.

Однако в некоторых случаях введение бета-адреноблокаторов перед хирургическим вмешательством может быть полезным, т.к. они способны уменьшать аритмогенные эффекты и выраженность ухудшения коронарного кровообращения при хирургическом стрессе, вызывающем преобладание симпатического тонуса. Если, с учетом этого, пациенту назначают бета-адреноблокатор, то следует выбрать анестетик со слабым отрицательным инотропным эффектом, чтобы уменьшить риск угнетающего действия на миокард.

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

При недостаточности кровообращения, а также нарушении функций почек или печени, особенно важно контролировать содержание калия в крови.

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 Вискен всегда следует сочетать с альфа-адреноблокаторами.

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

У пациентов, предрасположенных к анафилактическим реакциям на различные антигены, пиндолол 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 активное вещество препарата (пиндолол) может дать положительный результат при некоторых допинговых тестах.

Использование в педиатрии

Данных о применении препарата Вискен у **детей и подростков в возрасте до 18 лет** не имеется, эффективность и безопасность не установлены. Применение препарата в педиатрии противопоказано.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Вискен 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

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

При **почечной недостаточности тяжелой степени** препарат противопоказан.

При нарушениях функции печени

При **легком или умеренном нарушении функции печени** коррекции дозы не требуется, при **выраженном нарушении функции печени** может потребоваться снижение дозы препарата.

Применение в пожилом возрасте

Пациентам пожилого возраста препарат можно назначать в обычной дозе.

Применение в детском возрасте

Данных о применении препарата Вискен у **детей и подростков в возрасте до 18 лет** не имеется, эффективность и безопасность не установлены. Применение препарата в педиатрии противопоказано.

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить в 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/Visken