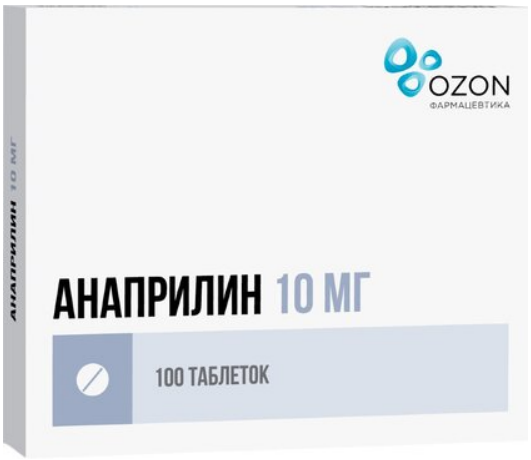
Инструкция по применению
Анаприлин Таблетки 10 мг 100 шт

Характеристики

Форма выпуска: Таблетки
Страна: Россия
Производитель: Озон
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Пропранолол
Количество в упаковке: 100
Дозировка действующего вещества: 10 мг



Описание

Круглые плоскоцилиндрические таблетки белого или почти белого цвета с риской и с фаской.

Действующее вещество

Пропранолол

Состав

Состав на одну таблетку 40 мг: Действующее вещество: пропранолола гидрохлорид - 40,0 мг. Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат (сахар молочный) - 256,0 мг, крахмал кукурузный - 80,0 мг, желатин - 10,0 мг, карбоксиметилкрахмал натрия - 10,0 мг, магния стеарат - 4,0 мг.

Форма выпуска

Таблетки

Фармакокинетика

Всасывание Быстро и достаточно полно (90%) всасывается при приеме внутрь из желудочно-кишечного тракта и относительно быстро выводится из организма. Биодоступность после приема внутрь составляет 30-40% (эффект "первичного прохождения" через печень, микросомальное окисление), при длительном применении - увеличивается (образуются метаболиты, ингибирующие ферменты печени), величина биодоступности зависит от характера пищи и интенсивности печеночного кровотока. Биодоступность увеличивается на 50% при приеме пищевых продуктов богатых белком. Максимальная концентрация в плазме крови достигается через 1-1,5 ч после приема внутрь. Пропранолол является субстратом Р-гликопротеина. Показано, что Р-гликопротеин не оказывает воздействия на метаболизм пропранолола в обычном терапевтическом диапазоне доз. Распределение Связь с белками плазмы крови (альбумином и альфа 1 кислым гликопротеином) - 90-95%. Объем распределения - 3-5 л/кг. Проникает через гематоэнцефалический и плацентарный барьер, а также в грудное молоко. Метаболизм Пропранолол интенсивно метаболизируется в печени по трем основным путям: ароматическое гидроксилирование (42%), N-деалкилирование с последующим окислением (41%) и прямое глюкуронирование (17%). Соотношение путей метаболизма пропранолола может существенно различаться в отдельных случаях. Выявлено 4 основных метаболита: пропранолола глюкуронид, нафтилоксимолочная кислота, глюкуроновая кислота и сложные сульфатные соединения 4-гидроксипропранолола. Согласно исследованиям in vitro, в метаболизме пропранолола принимают участие изоферменты системы цитохрома Р450, главным образом, изофермент CYP2D6 (ароматическое гидроксилирование), изофермент CYP1A2 (окисление цепей) и, в меньшей степени, изофермент CYP2C19. У здоровых добровольцев, "быстрых" и "медленных" метаболизаторов изофермента CYP2D6, существенных различий в клиренсе и периоде полувыведения пропранолола не выявлено. Выведение Период полувыведения - 3-6 ч., на фоне курсового применения может удлиняться до 12 ч. Выводится преимущественно почками в виде метаболитов, в неизмененном виде выводится менее 1%. Не удаляется при гемодиализе.

Показания

Артериальная гипертензия, стенокардия напряжения, нестабильная стенокардия, синусовая тахикардия (в т.ч. при гипертиреозе), наджелудочковая тахикардия, тахисистолическая форма фибрилляции предсердий (мерцательная тахиаритмия), наджелудочковая и желудочковая экстрасистолия, профилактика повторного инфаркта миокарда (систолическое артериальное давление более 100 мм рт. ст.), феохромоцитома (при одновременном применении с альфа-адреноблокаторами), эссенциальный тремор, мигрень (профилактика приступов), в качестве вспомогательного средства в терапии тиреотоксикоза и тиреотоксического криза (при непереносимости тиреостатических средств), симпатоадреналовые кризы на фоне диэнцефального синдрома.

Способ применения и дозы

Принимать препарат внутрь, перед приемом пищи. При артериальной гипертензии - внутрь, по 40 мг 2 раза в сутки. При недостаточной выраженности антигипертензивного эффекта дозу увеличивают с недельным интервалом до 40 мг 3 раза или до 80 мг 2 раза в сутки. Максимальная суточная доза - 320 мг. При стенокардии, нарушениях сердечного ритма - в начальной дозе 20 мг (по 2 таблетки по 10 мг или &frac12, таблетки по 40 мг) 3 раза в сутки, затем дозу увеличивают с недельным интервалом до 80-120 мг в 2-3 приема. Максимальная суточная доза - 240 мг. Профилактика повторного инфаркта миокарда - терапию следует начинать между 5-ым и 21-ым днем после перенесенного инфаркта миокарда в дозе 40 мг 4 раза в сутки в течение 2-3 дней, затем в дозе 80 мг 2 раза в сутки. Дня профилактики приступов мигрени, при эссенциальном треморе, симпатоадреналовых кризах на фоне диэнцефального синдрома - рекомендуется применять в начальной дозе 40 мг 2-3 раза в сутки, при необходимости дозу постепенно увеличивают до 160 мг/сутки с недельным интервалом. При феохромоцитоме - применять только в комбинации с блокаторами альфа-адренорецепторов. Перед операцией применяют в дозе 60 мг в сутки в течение 3 дней. При неоперабельной злокачественной феохромоцитоме применяют в дозе 30 мг в сутки. В качестве вспомогательного средства в терапии тиреотоксикоза и тиреотоксического криза - в дозе 10-20 мг 3-4 раза в сутки. При необходимости возможно увеличение дозы до 120-160 мг в сутки в 2-3 приема. Особые группы пациентов Применение у пациентов с нарушением функции печени Биодоступность пропранолола может быть увеличена у пациентов с нарушениями функции печени, что может потребовать коррекции дозы. У пациентов с тяжелыми нарушениями функции печени начальная доза препарата не должна превышать 20 мг 3 раза в сутки под контролем ЧСС. Применение у пациентов с нарушением функции почек При нарушениях функции почек необходимо снизить начальную дозу препарата или увеличить интервал между приемами препарата (возможно увеличение концентрации пропранолола в плазме крови).

Противопоказания

Повышенная чувствительность к действующему веществу или другим компонентам препарата атриовентрикулярная (AV) блокада II-III степени синдром слабости синусового узла (включая синоаурикулярную (синоатриальную) блокаду) брадикардия (ЧСС менее 60 уд/мин) артериальная гипотензия (систолическое АД менее 100 мм рт. ст.) неконтролируемая хроническая сердечная недостаточность острая сердечная недостаточность острый инфаркт миокарда кардиогенный шок отек легких стенокардия Принцметала кардиомегалия (без признаков сердечной недостаточности) тяжелые заболевания периферических сосудов (синдром Рейно) метаболический ацидоз (в т. ч. диабетический кетоацидоз) бронхиальная астма, склонность к бронхоспастическим реакциям, хроническая обструктивная болезнь легких (в том числе и в анамнезе) феохромоцитома (без одновременного применения альфа-адреноблокаторов) спастический колит одновременное применение с антипсихотическими средствами (нейролептиками), анксиолитиками (хлорпромазин, триоксазин и др.), ингибиторами моноаминоксидазы (МАО), блокаторами "медленных" кальциевых каналов (БМКК) (см. раздел "Взаимодействие с другими лекарственными средствами") беременность период грудного вскармливания возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены) дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция (препарат содержит лактозу).

Применение при беременности и кормлении грудью

Препарат Анаприлин не рекомендуется применять во время беременности и в период грудного вскармливания. Поэтому перед началом приема препарата у женщин детородного возраста следует исключить беременность, а во время лечения они должны использовать надежные методы контрацепции. В случае подтверждения факта беременности во время лечения препаратом, следует как можно скорее прекратить его прием и перевести пациентку на прием других препаратов, при применении которых риск для ребенка будет наименьшим. Беременность При беременности препарат применяют только по строгим показаниям в случае, если предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода (в связи с возможностью задержки роста плода, внутриутробной гибели плода, преждевременных родов, а также развитием у новорожденного брадикардии, артериальной гипотензии, гипогликемии и паралича дыхания). Если применение бета-адреноблокаторов во время беременности необходимо, то более предпочтительно применять селективные бета1-адреноблокаторы. Лечение необходимо прерывать за 48-72 часа до родов. В тех случаях, когда это невозможно, необходимо контролировать маточно-плацентарный кровоток и рост плода, а также обеспечивать строгое наблюдение за новорожденным в течение первых 3 суток после родоразрешения. Период грудного вскармливания Пропранолол выделяется с грудным молоком. При необходимости применения препарата в период лактации следует прекратить грудное вскармливание.

Побочные действия

Указанные ниже нежелательные эффекты даются в соответствии со следующими градациями частоты их возникновения в соответствии с классификацией Всемирной организации здравоохранения: очень часто (&ge, 1/10), часто (от &ge, 1/100 до Нарушения со стороны сердца: нечасто - атриовентрикулярная блокада, редко - брадикардия, сердечная недостаточность, ощущение сердцебиения, нарушение проводимости миокарда, аритмия, боль в груди. Нарушения со стороны сосудов: часто - похолодание конечностей, редко - выраженное снижение АД, ортостатическая гипотензия, ангиоспазм, мезентериальный тромбоз, синдром Рейно. Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: нечасто - тошнота, рвота, диарея, боли в эпигастральной области, изменение вкуса, частота неизвестна - сухость слизистой оболочки полости рта, ишемический колит, запор. Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей: частота неизвестна - нарушение функции печени. Нарушения со стороны нервной системы: редко - психоз, эмоциональная лабильность, спутанность сознания или кратковременная потеря памяти, парестезия, головокружение, частота неизвестна - головная боль. Нарушения со стороны психики:

очень часто - расстройства сна (бессонница, сонливость), часто - ажитация (длительное возбуждение, сопровождаемое тревогой), ночные кошмары, раздражительность, частота неизвестна - депрессия, судороги, кататония, снижение скорости психомоторных реакций. Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: очень часто - бронхит, часто - бронхиолит, редко - ринит, заложенность носа, бронхоспазм (иногда с летальным исходом), ларингоспазм, частота неизвестна - одышка. Нарушения со стороны обмена веществ и питания: часто - снижение аппетита, нечасто - гипогликемия (у пациентов с сахарным диабетом 1 типа), гипергликемия (у пациентов с сахарным диабетом 2 типа), повышение концентрации триглицеридов и холестерина. Нарушения со стороны органа зрения: редко - сухость слизистой оболочки глаз (уменьшение секреции слезной жидкости), нарушение остроты зрения, частота неизвестна - кератоконъюнктивит. Нарушения со стороны репродуктивной системы и молочных желез: частота неизвестна - снижение либидо, снижение потенции, болезнь Пейрони. Нарушения со стороны кожи и подкожной клетчатки: редко - алопеция, частота неизвестна - обострение течения псориаза, повышенное потоотделение, гиперемия кожи, экзантема, псориазоподобные кожные реакции, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз, эксфолиативный дерматит, мультиформная эритема, кожная сыпь, кожный зуд. Нарушения со стороны эндокринной системы: частота неизвестна - снижение функции щитовидной железы. Нарушения со стороны крови и лимфатической системы: нечасто - нейтропения, редко - тромбоцитопения, частота неизвестна - агранулоцитоз, лейкопения. Лабораторные и инструментальные данные: частота неизвестна - повышение активности "печеночных" трансаминаз и концентрации билирубина, повышение титра антинуклеарных антител, гиперкалиемия. Общие нарушения и реакции в месте введения препарата: частота неизвестна - боль в грудной клетке, синдром "отмены", астенический синдром (слабость), повышенная утомляемость. Нарушения со стороны опорно-двигательного аппарата и соединительной ткани: частота неизвестна - артралгия, мышечная слабость, боль в спине или суставах.

Передозировка

Симптомы: Со стороны сердца: брадикардия, снижение АД, атриовентрикулярная блокада, замедление внутрижелудочковой проводимости, сердечная недостаточность. Со стороны дыхательной системы: бронхоспазм. Лабораторные показатели: гипогликемия. Со стороны нервной системы: возможны судороги, поскольку пропранолол проникает через гематоэнцефалический барьер. Лечение: подключить пациента к кардиостимулятору. Необходим контроль основных жизненно важных показателей: концентрацией глюкозы, психоэмоциональным статусом, в случае брадикардии применяют атропин. Если у пациента не наблюдается соответствующая реакция на введение плазмозамещающих растворов, следует рассмотреть возможность применения глюкагона или катехоламинов. При бронхоспазме показано введение аминофиллина. Гемодиализ неэффективен.

Взаимодействие с другими препаратами

Антигипертензивный эффект пропранолола усиливается при одновременном применении с диуретиками, резерпином, гидралазином и другими гипотензивными средствами (ингибиторы ангиотензинпревращающего фермента, антагонисты рецепторов ангиотензина II, альфа-адреноблокаторы). При одновременном применении с гипотензивными средствами центрального действия (клонидин, гуанфацин, моксонидин, метилдопа, рилменидин) возможно ухудшение течения сердечной недостаточности за счет снижения симпатического тонуса (снижение ЧСС и сердечного выброса, усиление симптомов вазодилатации). В случае резкой отмены данных препаратов, особенно до отмены пропранолола, возможно развитие "рикошетной" артериальной гипертензии. Одновременное применение с ИМКК дигидропиридинового ряда (амлодипин, фелодипин, лацидипин, нифедипин, никардипин, нимодипин, нитрендипин) может повышать риск развития артериальной гипотензии. Нельзя исключать возрастание риска дальнейшего снижения сократительной способности миокарда у пациентов с сердечной недостаточностью. Пропранолол необходимо отменить за несколько дней до прекращения применения клонидина (см. раздел "Особые указания"). Препараты, вызывающие ортостатическую гипотензию (нитраты, ингибиторы фосфодиэстеразы 5, трициклические антидепрессанты, нейролептики, агонисты дофаминовых рецепторов, леводопа, амифостин, баклофен и другие) могут усилить действие бета-адреноблокаторов. Антигипертензивный эффект ослабляют нестероидные противовоспалительные препараты (задержка натрия и блокирование синтеза простагландина почками), эстрогены (задержка натрия) и ингибиторы МАО. Циметидин увеличивает биодоступность пропранолола. Повышает концентрацию лидокаина в плазме крови, снижает клиренс теофиллина. Одновременное применение с производными

фенотиазина повышает концентрации обоих препаратов в плазме крови. Усиливает действие тиреостатических и утеротонизирующих средств, снижает действие антигистаминных средств. Повышает вероятность развития тяжелых системных реакций (анафилаксии) на фоне введения аллергенов, используемых для иммунотерапии или для кожных проб. Амиодарон, верапамил, дилтиазем, бепридил - усиление выраженности отрицательного хроно-, ино- и дромотропного действия пропранолола. Йодсодержащие рентгеноконтрастные средства для в/в введения повышают риск развития анафилактических реакций. Фенитоин при в/в введении, лекарственные средства для ингаляционной общей анестезии (производные углеводородов) повышают выраженность кардиодепрессивного действия и вероятность снижения АД. Изменяет эффективность инсулина и гипогликемических средств для приема внутрь, маскирует симптомы развивающейся гипогликемии (тахикардию, повышение АД). Пропранолол снижает клиренс ксантинов (кроме дифиллина). Антигипертензивный эффект ослабляют глюкокортикостероиды. Сердечные гликозиды, метилдопа, резерпин и гуанфацин, антиаритмические средства повышают риск развития или усугубления брадикардии, атриовентрикулярной блокады, остановки сердца и сердечной недостаточности. Удлиняет действие недеполяризующих миорелаксантов и антикоагулянтный эффект кумаринов. Три- и тетрациклические антидепрессанты, антипсихотические средства (нейролептики), этанол, седативные и снотворные средства усиливают угнетение ЦНС. Не рекомендуется одновременное применение с ингибиторами МАО вследствие значительного усиления антигипертензивного действия, перерыв в лечении между приемом ингибиторов МАО и пропранолола должен составлять не менее 14 дней. Одновременное применение с анксиолитиками (хлорпромазин, триоксазин и др.) усиливает антигипертензивное действие бета-адреноблокаторов. Негидрированные алкалоиды спорыньи повышают риск развития нарушений периферического кровообращения. Сульфасалазин увеличивает концентрацию пропранолола в плазме крови (тормозит метаболизм), рифампицин укорачивает период полувыведения.

Особые указания

Бета-адреноблокаторы не следует применять у пациентов с нелеченной хронической сердечной недостаточностью, до тех пор, пока состояние не стабилизировалось. Перед применением препарата пациентам с сердечной недостаточностью (ранние стадии) необходимо применять сердечные гликозиды и/или диуретические средства. Контроль над пациентами, принимающими препарат, должен включать наблюдение за ЧСС и АД (в начале лечения - ежедневно, затем 1 раз в 3-4 месяца), запись электрокардиограммы. У пожилых пациентов рекомендуется контролировать функцию почек (1 раз в 4-5 месяцев). В случае появления у пациентов пожилого

возраста нарастающей брадикардии (менее 60 уд./мин), артериальной гипотензии (систолическое АД менее 100 мм рт. ст.), атриовентрикулярной блокады, бронхоспазма, желудочковых аритмий, тяжелых нарушений функции печени и/или почек, необходимо уменьшить дозу препарата или прекратить лечение. С осторожностью применять препарат у пациентов с атриовентрикулярной блокадой I степени. Следует обучить пациента методике подсчета ЧСС и проинструктировать о необходимости врачебной консультации при ЧСС менее 60 уд./мин. Рекомендуется прекращать терапию при развитии депрессии, вызванной приемом бета-адреноблокаторов. Пациенты, пользующиеся контактными линзами, должны учитывать, что на фоне лечения бета-адреноблокаторами возможно уменьшение продукции слезной жидкости. Лечение ишемической болезни сердца и стойкой артериальной гипертензии должно быть длительным - прием препарата возможен в течение нескольких лет. Прекращение лечения осуществляют постепенно, под наблюдением врача: резкая отмена может резко усилить ишемию миокарда, ангинозный синдром, ухудшить толерантность к физической нагрузке. Отмену проводят постепенно, снижая дозу на 25 % каждые 3-4 дня в течение 2 недель и более. При решении вопроса о применении препарата Анаприлин у пациентов с псориазом следует тщательно соотнести предполагаемую пользу и возможный риск обострения течения псориаза. При тиреотоксикозе пропранолол может маскировать определенные клинические признаки гиперфункции щитовидной железы (например, тахикардию). Резкая отмена у пациентов с гиперфункцией щитовидной железы противопоказана, поскольку способна усилить симптоматику. На фоне терапии пропранололом были зарегистрированы отдельные сообщения о развитии миастении. При появлении мышечной слабости необходима консультация врача. У пациентов с сахарным диабетом, применение препарата проводят под контролем концентрации глюкозы в крови (1 раз в 4-5 месяцев). С осторожностью применять одновременно с гипогликемическими средствами, поскольку во время продолжительных перерывов в приеме пищи, а также на фоне терапии инсулином может развиться гипогликемия. Причем такие ее симптомы, как тахикардия или тремор, будут маскироваться за счет действия препарата. Пациента следует проинструктировать, что основным симптомом гипогликемии во время лечения препаратом является повышенное потоотделение. Также существует опасность возникновения гипергликемии на фоне приема гипогликемических средств для приема внутрь. При одновременном приеме клонидина его прием может быть прекращен только через несколько дней после отмены препарата. Бета-адреноблокаторы могут повысить чувствительность к аллергенам и тяжесть анафилактических реакций. пропранолол может быть причиной тяжелой реакции на ряд аллергенов при назначении его пациентам, имеющим в анамнезе тяжелую анафилактическую реакцию на эти аллергены. Такие пациенты могут не реагировать на обычные дозы эпинефрина (адреналина), применяемого для

лечения анафилактического шока. При феохромоцитоме применяют только в сочетании с альфа-адреноблокаторами. Противопоказано одновременное применение с антипсихотическими средствами (нейролептиками) и транквилизаторами. Препараты, снижающие запасы катехоламинов (например, резерпин) могут усилить действие пропранолола. поэтому пациенты, принимающие сочетания препаратов, должны находиться под постоянным наблюдением врача на предмет выявления артериальной гипотензии и брадикардии. На фоне лечения следует избегать внутривенного введения верапамила, дилтиазема. С осторожностью применять совместно с психотропными средствами, например, ингибиторами МАО, при их курсовом применении более 2 недель. За несколько дней перед проведением общей анестезии хлороформом или эфиром необходимо прекратить прием препарата (повышение риска угнетения функции миокарда и развития артериальной гипотензии). Необходимо предупредить врача-анестезиолога, что пациент принимает Анаприлин. Эффективность бета-адреноблокаторов у курильщиков ниже, чем у некурящих пациентов. Следует отменить препарат Анаприлин перед исследованием содержания в крови и моче катехоламинов, норметанефрина и ванилилминдальной кислоты, титров антинуклеарных антител. Следует приостановить терапию препаратом при респираторной инфекции нижних дыхательных путей, сопровождаемой затрудненным дыханием. Допускается применение бета2-агонистов и ингаляционных глюкокортикостероидов. Возобновление применения препарата возможно только после полного выздоровления пациента. При повторной инфекции, а также в случае изолированного бронхоспазма, применение препарата должно быть прекращено совсем. Во время лечения не рекомендуется принимать алкоголь. Бета-адреноблокаторы необходимо применять с осторожностью у пациентов с нарушениями периферического кровообращения, так как возможно усугубление данных симптомов. Следует избегать употребления натуральной лакрицы: пища, богатая белком, способна увеличить биодоступность пропранолола. Пропранолол может давать положительный результат при проведении допинг-теста.Влияние на способность управлять трансп. ср. и мех.:Влияние препарата Анаприлин на способность к управлению транспортными средствами и механизмами не изучалось. Из-за возможного появления побочных эффектов, таких как головокружение, сонливость, снижение скорости психомоторных реакций, в период лечения необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Условия хранения

При температуре не выше 25гр.С. Хранить в недоступном для детей месте.