Инструкция по применению
Бинелол таблетки 14 шт

Характеристики

Форма выпуска: Таблетки покрытые оболочкой
Страна: Хорватия
Производитель: Белупо
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Небиволол
Количество в упаковке: 14
Дозировка действующего вещества: 5 мг
Срок годности: 36.0



Действующее вещество

Небиволол

Состав

Одна таблетка содержит: Действующее вещество: небиволола гидрохлорид 5,45 мг (эквивалентно 5 мг небиволола). Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 85,96 мг, кросповидон (тип А) - 6,89 мг, полоксамер 188 - 6,90 мг, повидон К-30 - 3,50 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 119,00 мг, магния стеарат - 2,30 мг.

Форма выпуска

Таблетки покрытые оболочкой

Фармакокинетика

Всасывание После приема внутрь оба энантиомера небиволола быстро абсорбируются из желудочно-кишечного тракта. Прием пищи не влияет на абсорбцию, поэтому небиволол можно принимать независимо от приема пищи. Биодоступность составляет в среднем 12 % у пациентов с «быстрым» метаболизмом (эффект «первичного прохождения») и является почти полной у пациентов с «медленным» метаболизмом. Распределение 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 Небиволол активно метаболизируется, частично с образованием активных гидроксиметаболитов. Метаболизм небиволола происходит путем алициклического и ароматического гидроксилирования, частичного N-дезалкилирования и глюкуронирования, кроме того, образуются глюкурониды гидроксиметаболитов. Скорость метаболизма небиволола путем ароматического гидроксилирования генетически определена окислительным полиморфизмом и зависит от изофермента CYP2D6. Скорость метаболизма не влияет на эффективность небиволола. Выведение Через неделю после приема 38 % (количество неизмененного активного вещества составляет менее 0,5 %) дозы выводится почками и 48 % - через кишечник. У пациентов с «быстрым» метаболизмом значения периода полувыведения (T1/2) 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 T1/2 гидроксиметаболитов обоих энантиомеров из плазмы крови составляют в среднем 24 ч, у пациентов с «медленным» метаболизмом эти значения приблизительно в 2 раза увеличиваются. Учитывая различия в скорости метаболизма, доза препарата должна всегда подбираться индивидуально: пациентам с «медленным» метаболизмом требуется меньшая доза. На фармакокинетику небиволола не влияет возраст и пол пациентов.

Показания

- Артериальная гипертензия. - Ишемическая болезнь сердца (ИБС): профилактика приступов стенокардии напряжения. - Хроническая сердечная недостаточность (в составе комбинированной терапии).

Способ применения и дозы

БИНЕЛОЛ® следует принимать внутрь в одно и то же время суток независимо от приема пищи, не разжевывая и запивая достаточным количеством жидкости.

Артериальная гипертензия и ишемическая болезнь сердца Средняя суточная доза для лечения артериальной гипертензии и ишемической болезни сердца составляет 2,5 - 5 мг (1/2 таблетки по 5 мг – 1 таблетка) 1 раз в сутки. Оптимальный терапевтический 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 максимальной 10 мг (2 таблетки по 5 мг в один прием). Применение у пациентов пожилого возраста: для пациентов старше 65 лет начальная доза составляет 2,5 мг /сут. (1/2 таблетки по 5 мг). При необходимости суточная доза может быть увеличена до 5 мг. Тем не менее, принимая во внимание ограниченный опыт применения небиволола у пациентов пожилого возраста, необходимо соблюдать осторожность и обеспечить тщательное наблюдение пациентов. Применение у пациентов с почечной недостаточностью: начальная доза для пациентов с нарушением функции почек (КК более 20 мл/мин) составляет 2,5 мг/сут. (1/2 таблетки по 5 мг). При необходимости суточная доза может быть увеличена до 5 мг. Отсутствует опыт применения небиволола у пациентов с тяжелой почечной недостаточностью (КК менее 20 мл/мин), поэтому его применение у таких пациентов не рекомендуется. Увеличение дозы у таких пациентов надо проводить с особой осторожностью. Хроническая сердечная недостаточность (ХСН) Лечение хронической сердечной недостаточности должно начинаться с постепенного увеличения дозы до достижения индивидуальной оптимальной поддерживающей дозы. У пациентов не должно быть приступов острой сердечной недостаточности в течение последних 6 недель. Рекомендовано осуществлять лечение под тщательным наблюдением врача. Пациентам, которые принимают диуретики, сердечные гликозиды, ингибиторы ангиотензинпревращающего фермента (АПФ), антагонисты рецепторов к ангиотензину II, дозирование препаратов должно быть стабилизировано за 2 недели до начала лечения небивололом. Подбор дозы в начале лечения необходимо осуществлять по следующей схеме, выдерживая недельные или двухнедельные интервалы и основываясь на переносимости этой дозы пациентом: доза, составляющая 1,25 мг препарата Бинелол® (1/4 таблетки по 5 мг) 1 раз в сутки, может быть увеличена сначала до 2,5 – 5 мг препарата Бинелол® (1/2 таблетки по 5 мг – 1 таблетка), а затем – до 10 мг (2 таблетки по 5 мг) 1 раз в сутки. 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 в сутки в один прием. Во время титрования дозы 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 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). Лечение стабильной хронической недостаточности обычно является продолжительным. Лечение препаратом Бинелол® не рекомендуется прекращать резко, поскольку это может привести к временному обострению течения хронической сердечной недостаточности. Если необходимо прекратить прием препарата, отмену проводят постепенно, снижая дозу в течение недели, вдвое.

Противопоказания

- повышенная чувствительность к небивололу или любому из компонентов препарата и другим бета-адреноблокаторам, - тяжелые нарушения функции печени, - острая сердечная недостаточность, - хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации (требующая внутривенного введения препаратов, обладающих инотропным эффектом), - кардиогенный шок, - синдром слабости синусового узла, включая синоаурикулярную блокаду, - атриовентрикулярная (AV) блокада II и III степени (без искусственного водителя ритма), - бронхоспазм и бронхиальная астма в анамнезе, - феохромоцитома (без одновременного применения альфа-адреноблокаторов), - депрессия, - метаболический ацидоз, - выраженная брадикардия (ЧСС менее 60 уд./мин.), - выраженная артериальная гипотензия (систолическое АД менее 90 мм рт.ст.), - тяжёлые нарушения периферического кровообращения (перемежающаяся хромота, синдром Рейно), - миастения, - возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены), - непереносимость лактозы, дефицит лактазы или глюкозо-галактозная мальабсорбция, - период грудного вскармливания, - одновременный прием с флоктафенином, сультопридом, - внутривенное введение верапамила на фоне применения небиволола, - тяжелая почечная недостаточность (клиренс креатинина (КК) менее 20 мл/мин).

Применение при беременности и кормлении грудью

При беременности препарат назначают только в том случае, если ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода. Небиволол может оказывать вредное воздействие на течение беременности, на плод и новорожденного. Уменьшение плацентарной перфузии под действием бета-адреноблокаторов может вызвать задержку развития плода, внутриутробную смерть плода, выкидыш и преждевременные роды. У новорожденных может наблюдаться брадикардия, артериальная гипотензия, гипогликемия и паралич дыхания. Прием препарата необходимо прекратить за 48-72 часа до родов. В тех случаях, когда это невозможно, необходимо обеспечивать строгое наблюдение за новорожденным в течение 48-72 часов после родов. Исследования на животных показали, что небиволол экскретируется с грудным молоком. Данные о том, выделяется ли небиволол с грудным молоком у человека, отсутствуют. Однако большинство бета-адреноблокаторов, в особенности липофильные соединения (например, небиволол и его метаболиты), в той или иной степени проникают в грудное молоко. Если применение препарата в период лактации необходимо, то грудное вскармливание необходимо прекратить.

Побочные действия

Частота побочных реакций классифицирована согласно рекомендациям Всемирной организации здравоохранения: очень часто (≥10 %), часто (≥1 % и Нарушения со стороны иммунной системы: частота неизвестна – ангионевротический отек, гиперчувствительность. Нарушения со стороны центральной нервной системы: очень часто – головокружение (у пациентов с ХСН), часто – головная боль, головокружение, повышенная утомляемость, слабость, парестезия, нечасто – «кошмарные» сновидения, депрессия, снижение способности к концентрации внимания, сонливость, бессонница, очень редко – синкопе. Нарушения со стороны органа зрения: нечасто – нарушение зрения, сухость глаз. Нарушения со стороны сердечно-сосудистой системы: очень часто – брадикардия (у пациентов с ХСН), часто – периферические отеки, нечасто – брадикардия, острая сердечная недостаточность, усугубление течения хронической сердечной недостаточности, замедление атриовентрикулярной проводимости/AV блокада, выраженное снижение АД, ортостатическая гипотензия, нарушения ритма сердца, кардиалгия, обострение перемежающейся хромоты. Нарушения со стороны дыхательной системы: часто – одышка, нечасто – бронхоспазм (в том числе, при отсутствии обструктивных заболеваний легких в анамнезе), ринит. Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: часто – тошнота, запор, диарея, сухость слизистой оболочки полости рта, нечасто – диспепсия, метеоризм, рвота. Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: нечасто – кожный зуд, кожная сыпь эритематозного характера, очень редко – обострение течения псориаза, фотодерматоз, повышенное потоотделение, частота неизвестна – крапивница. Нарушения со стороны репродуктивной системы: нечасто – эректильная дисфункция. Прочие: частота неизвестна – алопеция. При применении некоторых антагонистов бета-адренергических рецепторов также описаны следующие нежелательные реакции: галлюцинации, психоз, спутанность сознания, похолодание/цианоз конечностей, синдром Рейно.

Передозировка

Симптомы: выраженное снижение АД, брадикардия, AV блокада, кардиогенный шок, острая сердечная недостаточность, остановка сердца, бронхоспазм, тошнота, рвота, цианоз, потеря сознания, кома, гипогликемия, судороги. Лечение: промывание желудка, прием активированного угля. В случае выраженного снижения АД необходимо придать пациенту горизонтальное положение с приподнятыми ногами, при необходимости внутривенное (в/в) введение жидкости и вазопрессоров. Может потребоваться искусственная вентиляция легких. При брадикардии вводят в/в 0,5-2 мг атропина, при отсутствии положительного эффекта возможна постановка трансвенозного или внутрисердечного электростимулятора. При AV блокаде (II-III ст.) рекомендуется в/в введение бета-адреномиметиков. Эффект бета-адреноблокаторов может быть нейтрализован медленным в/в введением изопреналина, начиная с дозы 5 мкг/мин, или добутамина, начиная с дозы 2,5 мкг/мин, до достижения желаемого эффекта. В тяжелых случаях изопреналин можно комбинировать с допамином. Если эти дозы не дают желаемого эффекта, следует рассмотреть вопрос о в/в введении 50-100 мкг/кг глюкагона. При необходимости инъекцию следует повторить через 1 ч с последующим в/в введением 70 мкг/кг/ч глюкагона. 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 назначают в/в бета2-адреномиметики. При желудочковой экстрасистолии - лидокаин (нельзя вводить антиаритмические средства класса IA). При судорогах – в/в введение диазепама. При гипогликемии может быть показано в/в введение декстрозы (глюкозы).

Взаимодействие с другими препаратами

Фармакодинамическое взаимодействие Противопоказано одновременное применение небиволола с флоктафенином, так как существует угроза развития тяжелой артериальной гипотензии или шока. Противопоказано одновременное применение небиволола и сультоприда, так как повышается риск возникновения желудочковой аритмии, особенно желудочковой тахикардии типа «пируэт». Нерекомендуемые комбинации При одновременном применении с антиаритмическими средствами I класса (хинидин, гидрохинидин, цибензолин, флекаинид, дизопирамид, лидокаин, мексилетин, пропафенон) возможно усиление отрицательного инотропного действия и удлинение времени проведения через атриовентрикулярный узел. 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 одновременном применении с гипотензивными средствами центрального действия (клонидин, гуанфацин, моксонидин, метилдопа, рилменидин) возможно ухудшение течения сердечной недостаточности за счет снижения центрального симпатического тонуса (снижение ЧСС и сердечного выброса, симптомы вазодилатации). В случае резкой отмены данных препаратов, особенно до отмены небиволола, возможен риск развития «рикошетной» артериальной гипертензии. Комбинации, которые следует применять с осторожностью При одновременном применении с антиаритмическими препаратами III класса (амиодарон) возможно усиление влияния на время проведения через атриовентрикулярный узел. Одновременное применение небиволола и препаратов для общей анестезии может вызывать подавление рефлекторной тахикардии и увеличивать риск развития артериальной гипотензии. При одновременном применении небиволола с инсулином и гипогликемическими средствами для приема внутрь могут маскироваться симптомы гипогликемии (ощущение сердцебиения, тахикардия). Одновременный прием небиволола с баклофеном, амифостином приводит к усилению артериальной гипотензии. Комбинации, которые следует принимать во внимание При одновременном применении небиволола с сердечными гликозидами возможно замедление атриовентрикулярной проводимости. Небиволол не влияет на фармакокинетические параметры дигоксина. Одновременное применение небиволола и БМКК 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. При сочетании с гипотензивными средствами, нитроглицерином может развиться выраженная артериальная гипотензия (особая осторожность необходима при сочетании с празозином). Одновременное применение трициклических антидепрессантов, барбитуратов и производных фенотиазина может усиливать гипотензивное действие небиволола. Клинически значимого взаимодействия небиволола и нестероидных противовоспалительных препаратов (НПВП) не установлено. Ацетилсалициловая кислота в качестве антиагрегантного средства может применяться одновременно с небивололом. При одновременном применении симпатомиметические средства подавляют фармакологическую активность небиволола. Фармакокинетическое взаимодействие При одновременном применении с препаратами, ингибирующими обратный захват серотонина, или другими средствами, биотрансформирующимися с участием изофермента CYP2D6 (например, пароксетин, флуоксетин, тиоридазин и хинидин), метаболизм небиволола замедляется, повышается его концентрация в плазме крови, что может приводить к повышению риска появления выраженной брадикардии и нежелательных явлений.

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 увеличиваются, однако это не имеет клинического значения. Одновременный прием этанола, фуросемида или гидрохлоротиазида не влияет на фармакокинетику небиволола. Не установлено клинически значимого взаимодействия небиволола и варфарина.

Особые указания

Бета-адреноблокаторы не следует применять у пациентов с нелеченной хронической сердечной недостаточностью, до тех пор, пока состояние не стабилизировалось. Недопустимо резкое прекращение применения бета-адреноблокаторов. Отмену бета-адреноблокаторов следует проводить постепенно, в течение 10 дней (до 2-х недель у пациентов с ишемической болезнью сердца). 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. (см. раздел «Противопоказания»). Бета-адреноблокаторы необходимо применять с осторожностью у следующих групп пациентов: - с нарушениями периферического кровообращения, так как возможно усугубление данных симптомов, - с атриовентрикулярной блокадой I степени, так как бета-адреноблокаторы отрицательно влияют на время проведения импульса, - со стенокардией Принцметала вследствие беспрепятственной опосредованной альфа-рецепторами вазоконстрикции коронарной артерии: бета-адренергические антагонисты могут увеличивать число и продолжительность приступов стенокардии. При решении вопроса о назначении препарата Бинелол® пациентам с псориазом следует тщательно соотнести предполагаемую пользу от применения препарата и возможный риск обострения псориаза. Пациенты, пользующиеся контактными линзами, должны учитывать, что на фоне применения бета-адреноблокаторов возможно снижение продукции слезной жидкости. При проведении хирургических вмешательств следует предупредить врача-анестезиолога о том, что пациент принимает бета-адреноблокаторы. Продолжение бета-адреноблокады уменьшает риск возникновения аритмии во время проведения общей анестезии и интубации. Если подготовка к хирургическому вмешательству подразумевает прерывание бета-адреноблокады, следует прекратить прием бета-адренергических антагонистов, по

меньшей мере, за 24 часа до хирургического вмешательства. Следует с осторожностью применять анестетики, которые вызывают угнетение миокарда. Вагусные реакции у пациента можно предотвратить внутривенным введением атропина. Небиволол не влияет на уровень глюкозы у пациентов с сахарным диабетом. Тем не менее, следует соблюдать осторожность при лечении этих пациентов, поскольку Бинелол® может маскировать определённые симптомы гипогликемии (например, тахикардию, ощущение сердцебиения), вызванные применением гипогликемических средств. Контроль содержания глюкозы в плазме крови следует проводить 1 раз в 4-5 мес. (у пациентов с сахарным диабетом). Небиволол 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. Бета-адреноблокаторы могут также маскировать симптомы тахикардии при гипертиреозе. Внезапная отмена препарата может усугубить данные симптомы. Бета-адреноблокаторы следует применять с осторожностью у пациентов с хронической обструктивной болезнью легких, поскольку возможно усиление бронхоспазма. Небиволол может давать положительный результат при проведении допинг-теста. Эффективность бета-адреноблокаторов у курящих пациентов ниже, чем у некурящих.

Условия хранения

В сухом месте