Инструкция по применению
Небиволол-Озон Таблетки 5 мг 28 шт



Характеристики

Форма выпуска: Таблетки
Страна: Россия
Производитель: Озон
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Небиволол
Количество в упаковке: 28
Дозировка действующего вещества: 5 мг

Описание

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

Действующее вещество

Небиволол

Состав

Действующее вещество: небиволола гидрохлорид - 5,45 мг, что соответствует небиволола основанию - 5,00 мг, Вспомогательные вещества: лактоза - 148,00 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 20,0 мг, повидон-К25 - 5,00 мг, кроскармеллоза натрия - 8,00 мг, кремния диоксид коллоидный - 1,65 мг, магния стеарат - 1,90 мг,

Форма выпуска

Таблетки

Фармакокинетика

Всасывание После приема внутрь оба энантиомера небиволола быстро абсорбируются из желудочно-кишечного тракта. Одновременный прием пищи не влияет на абсорбцию поэтому небиволол можно принимать независимо от времени 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 В плазме крови оба энантиомера небиволола преимущественно связаны с альбумином. Связь с белками плазмы крови (преимущественно с альбумином) для D-небиволола составляет 981% для L-небиволола - 979%. Концентрации небиволола в плазме крови составляет 1-30 мкг/л и пропорциональны дозе. Равновесная концентрация небиволола в плазме крови у большинства пациентов (с "быстрым" метаболизмом) достигается в течение 24 ч а для гидроксиметаболитов - через несколько суток. Метаболизм Небиволол метаболизируется с образованием активных метаболитов путем алициклического и ароматического гидроксилирования и частичного N-дезалкилирования изоферментами семейства CYP2D6 имеющего генетический полиморфизм. Образующиеся гидрокси- и аминопроизводные конъюгируют с глюкуроновой кислотой и выводятся в виде О- и N-глюкуроидов. Скорость метаболизма небиволола путем ароматического гидроксилирования генетически определена окислительным полиморфизмом и зависит от изофермента CYP2D6. После приема одинаковой дозы небиволола и достижения Css пиковая концентрация неизмененного небиволола в 23 раза выше у "медленных" метаболизаторов по сравнению с "быстрыми" метаболизаторами. Скорость метаболизма не влияет на эффективность небиволола. Учитывая различия в скорости метаболизма доза препарата должна всегда подбираться индивидуально - пациентам с "медленным" метаболизмом требуется меньшая доза. Выведение Выводится небиволол в виде О- и N-глюкуронидов. Через неделю после приема 38% (количество неизмененного действующего вещества составляет менее 05%) дозы выводится почками и 48% - через кишечник. Выведение неизмененного небиволола через почки составляет менее 05%от дозы препарата принятого внутрь. У пациентов с "быстрым" метаболизмом значения периода полувыведения (Т1/2) для гидроксиметаболитов - 24 ч энантиомеров небиволола из плазмы крови составляют в среднем 10 ч. У пациентов с "медленным" метаболизмом эти значения в 2-5 раз увеличиваются составляя для гидроксиметаболитов- 48 ч для энантиомеров небиволола - 30-50 ч. Возраст пациента не оказывает влияния на фармакокинетику небиволола.

Показания

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

Способ применения и дозы

Внутрь в одно и то же время независимо от времени приема пищи не разжевывая и запивая достаточным количеством жидкости. Таблетку 5 мг или 10 мг можно разделить на две или четыре равные части по крестообразной риске. Артериальная гипертензия и ишемическая болезнь сердца Средняя суточная доза составляет 25-5 мг (1-2 таблетки по 25 мг, 1/2-1 таблетка по 5 мг) 1 раз в сутки. Оптимальный антигипертензивный эффект достигается через 1-2 недели лечения в отдельных случаях - через 4 недели. При необходимости дозу можно увеличить до максимальной суточной дозы 10 мг. Возможно применение препарата Небиволол в монотерапии или в сочетании с другими гипотензивными средствами. Пациенты пожилого возраста: для пациентов старше 65 лет начальная доза составляет 25 мг в сутки (1 таблетка по 25 мг или 1/2 таблетки по 5 мг). При необходимости суточную дозу можно увеличить до 5 мг. Однако принимая во внимание ограниченный опыт применения препарата у пациентов пожилого возраста необходимо быть осторожными и проводить тщательное обследование пациентов в возрасте старше лет. У пациентов пожилого возраста необходимость в коррекции дозы отсутствует поэтому необходимо индивидуально подбирать дозу постепенно повышая ее до максимально переносимой дозы. Пациенты с почечной недостаточностью (КК более 20 мл/мин): начальная доза составляет 25 мг в сутки (1 таблетка по 25 мг или 1/2 таблетки по 5 мг). При необходимости суточную дозу можно увеличить до 5 мг. Увеличение дозы у таких пациентов надо проводить с особой осторожностью. Хроническая сердечная недостаточность (ХСН) Лечение стабильной ХСН необходимо начинать с постепенного повышения 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 терапии препаратом Небиволол. Начинать лечение ХСН блокаторами бета-адренорецепторов необходимо при клинически стабильном состоянии пациента на протяжении последних 2 недель. Подбор дозы в начале терапии необходимо осуществлять по следующей схеме выдерживая интервалы от 1 до 2 недель: доза составляющая 125 мг в сутки (1/2

таблетки по 25 мг или 1/4 таблетки по 5 мг) может быть увеличена сначала до 25 мг в сутки (1 таблетка по 25 мг или 1/2 таблетки по 5 мг) далее - до 5-10 мг в сутки. Каждое увеличение дозы должно осуществляться не менее чем через 1-2 недели в зависимости от индивидуальной переносимости препарата. В начале лечения и при каждом повышении дозы пациент должен не менее 2-х часов находится под наблюдением врача чтобы убедиться что клиническое состояние остается стабильным (особенно: АД ЧСС нарушения проводимости а также симптомов усугубления течения хронической сердечной недостаточности). Максимальная суточная доза небиволола составляет 10 мг 1 раз в сутки. Во время титрации рекомендуется регулярный контроль АД ЧСС и симптомов хронической сердечной недостаточности. Во время титрования в случае ухудшения течения ХСН или непереносимости препарата рекомендуется снизить дозу препарата Небиволол или в случае необходимости немедленно прекратить его прием (в случае выраженной артериальной гипотензии при ухудшении течения ХСН с острым отеком легких в случае развития кардиогенного шока симптоматической брадикардии или атриовентрикулярной блокады). Лечение стабильной ХСН обычно является длительным. Лечение препаратом Небиволол не рекомендуется прекращать резко (если это не является необходимым) поскольку это может привести к временному обострению течения ХСН. Если необходимо прекратить прием препарата отмену проводят постепенно снижая дозу в течение недели вдвое.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к небивололу или другим компонентам препарата и другим бета-адреноблокаторам, - острая сердечная недостаточность, - хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации (требующая внутривенного введения препаратов обладающих инотропным действием), - выраженная артериальная гипотензия (систолическое артериальное давление менее 90 мм рт.ст.), - синдром слабости синусового узла включая синоатриальную блокаду, - атриовентрикулярная блокада II и III степени (в отсутствие искусственного водителя ритма), - брадикардия (ЧСС менее 60 уд/мин), - кардиогенный шок, - феохромоцитома (без одновременного применения альфа-адреноблокаторов): - метаболический ацидоз, - бронхоспазм и бронхиальная астма в анамнезе, - тяжелые нарушения периферического кровообращения (перемежающаяся хромота синдром Рейно), - миастения, - депрессия, - тяжелые нарушения функции печени, - тяжелые нарушения функции почек (клиренс креатинина менее 20 мл/мин). - одновременное применение с флоктафенином сультопридом (см. раздел "Взаимодействие с другими лекарственными препаратами"), - противопоказано внутривенное введение верапамила на фоне применения небиволола (см. раздел "Взаимодействие с другими лекарственными средствами"), - непереносимость лактозы дефицит лактазы или глюкозо-галактозная мальабсорбция. - период грудного вскармливания, - возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).

Применение при беременности и кормлении грудью

Беременность При беременности препарат Небиволол назначают только по жизненным показаниям когда ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода (в связи с возможностью задержки роста плода внутриутробной гибели плода преждевременных родов а также развития у новорожденного брадикардии артериальной гипотензии гипогликемии и паралича дыхания). Если применение бета-адреноблокаторов во время беременности необходимо то более предпочтительно применять селективные бета1-адреноблокаторы. Прием препарата Небиволол необходимо прекратить за 48-72 ч до родов. В тех случаях когда это невозможно необходимо контролировать маточноплацентарный кровоток и рост плода а также обеспечить строгое наблюдение за новорожденными в течение 48-72 ч после родов. Период грудного вскармливания Исследования на животных показали что небиволол выделяется с молоком лактирующих животных. Данных о том выделяется ли небиволол с грудным молоком отсутствуют. Однако большинство бета-адреноблокаторов в особенности липофильные соединения (например небиволол и его метаболиты) в той или иной степени проникают в грудное молоко. При необходимости применения препарата в период лактации грудное вскармливание необходимо прекратить.

Побочные действия

Частота побочных эффектов приведенных ниже определялась соответственно следующему (классификация Всемирной организации здравоохранения): очень часто (более 10%) часто (более 1% и менее 10%) нечасто (более 01% и менее 1%) редко (более 001% и менее 01%) очень редко (менее 001%) частота неизвестна (по имеющимся данным оценить частоту развития невозможно). Нарушения со стороны иммунной системы: очень редко: ангионевротический отек гиперчувствительность. Нарушения со стороны психики: нечасто: депрессия "кошмарные" сновидения психоз, очень редко: галлюцинации спутанность сознания. Нарушения со стороны нервной системы: очень часто: головокружение1, часто: головная боль головокружение слабость парестезия, очень редко: обморок. Нарушения со стороны органа зрения: нечасто: нарушение зрения, редко: сухость глаз. Нарушения со стороны сердечнососудистой системы: очень часто: брадикардия1, часто: усугубление течения ХСН1 атриовентрикулярная блокада I степени1 ортостатическая гипотензия1, нечасто: периферические отеки брадикардия сердечная недостаточность замедление атриовентрикулярной проводимости/атриовентрикулярная блокада выраженное снижение АД прогрессирование сопутствующей "перемежающей" хромоты, очень редко: синдром Реино. Нарушения со стороны дыхательной системы органов грудной клетки и средостения: часто: одышка, нечасто: бронхоспазм (в т.ч. при отсутствии обструктивных заболеваний легких в анамнезе). Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: часто: тошнота запор диарея, нечасто: диспепсия метеоризм рвота. Нарушения со стороны половых органов и молочной железы: нечасто: эректильная дисфункция. Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: нечасто: кожная сыпь эритематозного характера кожный зуд, очень редко: усугубление течения псориаза крапивница, частота неизвестна: алопеция. Общие расстройства и нарушения в месте введения: часто: повышенная утомляемость, очень редко: похолодание/цианоз конечностей1, нечасто: фотодерматоз гипергидроз, 1 - у пациентов с ХСН.

Передозировка

Симптомы: выраженное снижение АД выраженная брадикардия острая сердечная недостаточность атриовентрикулярная блокада кардиогенный шок остановка сердца бронхоспазм потеря сознания судороги кома тошнота рвота гипогликемия цианоз. Лечение: промывание желудка прием активированного угля. В случае выраженного снижения АД необходимо придать пациенту горизонтальное положение с приподнятыми ногами при необходимости внутривенное введение жидкости и вазопрессоров. Может понадобиться искусственная вентиляция легких. При выраженной брадикардии следует вводить внутривенно 05-2 мг атропина при отсутствии положительного эффекта возможна постановка искусственного водителя ритма. При атриовентрикулярной блокаде (II-III ст.) рекомендуется внутривенное 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 25 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 применяют внутривенно бета2-адреномиметики. При желудочковой экстрасистолии - лидокаин (нельзя вводить антиаритмические средства IA класса). При судорогах - внутривенное введение диазепама. При гипогликемии может быть показано внутривенное введение декстрозы (глюкозы).

Взаимодействие с другими препаратами

Фармакодинамическое взаимодействие Противопоказано одновременное применение с флоктафенином: небиволол способен препятствовать компенсаторным реакциям сердечно-сосудистой системы ассоциированным с артериальной гипотензией или шоком которые могут быть вызваны флоктафенином. Противопоказано одновременное применение небиволола и сультоприда так как при их одновременном применении отмечается повышенный риск возникновения желудочковой аритмии особенно полиморфной желудочковой тахикардии типа "пируэт". Нерекомендуемые комбинации При одновременном применении с антиаритмическими средствами I класса (хинидин гидрохинидин флекаинид цибензолин дизопирамид лидокаин мексилетин пропафенон) возможно усиление отрицательного инотропного действия и удлинение времени проведения возбуждения

через атриовентрикулярный узел. При одновременном применении бета-адреноблокаторов с блокаторами "медленных" кальциевых каналов (БМКК) (верапамил и дилтиазем) усиливается отрицательное действие на сократимость миокарда и атриовентрикулярную проводимость. Противопоказано внутривенное 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 симпатического тонуса (снижение ЧСС и сердечного выброса симптомы вазодилатации). В случае резкой отмены данных препаратов особенно до отмены небиволола возможно развитие "рикошетной" артериальной гипертензии (синдрома "отмены"). Комбинации которые следует применять с осторожностью При одновременном применении с антиаритмическими средствами III класса (амиодарон) может усиливаться влияние на время проведения через атриовентрикулярный узел. При одновременном применении небиволола с инсулином и гипогликемическими средствами для приема внутрь могут маскироваться симптомы гипогликемии (учащенное сердцебиение тахикардия). Одновременное применение небиволола и лекарственных средств для общей анестезии может вызывать подавление рефлекторной тахикардии и увеличить риск развития артериальной гипотензии. Одновременный прием небиволола с баклофеном амифостином с гипотензивными препаратами может вызвать значительное падение АД поэтому требуется коррекция доз гипотензивных препаратов. 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 одновременном применении небиволола с гипотензивными средствами нитроглицерином может развиться выраженная артериальная гипотензия (особая осторожность необходима при сочетании с празозином). Одновременное применение трициклических антидепрессантов барбитуратов и производных фенотиазина анксиолитиков снотворных средств может усиливать антигипертензивное 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 могут подавлять активность бета-адреноблокаторов. Теоретически совместное применение

мефлохина с небивололом может привести к удлинению интервалаQT. Фармакокинетические взаимодействия При применении небиволола в сочетании с препаратами ингибирующими обратный захват серотонина или другими препаратами метаболизирующимися с участием изофермента CYP2D6 (например пароксетин флуоксетин тиоридазин хинидин) метаболизм небиволола замедляется повышается концентрация небиволола в плазме крови что может привести к риску возникновения брадикардии и других побочных эффектов. При одновременном применении с циметидином возможно повышение концентрации небиволола в плазме крови (данные о влиянии на фармакологические эффекты препарата отсутствуют). Одновременное применение ранитидина не оказывало влияния на фармакокинетические параметры небиволола. Рифампицин усиливает метаболизм небиволола. При одновременном применении небиволола с никардипином концентрации активных веществ в плазме крови незначительно увеличиваются без изменения клинического эффекта. Одновременный прием этанола фуросемида или гидрохлоротиазида не влияет на фармакокинетику небиволола. Не установлено клинически значимого взаимодействия небиволола и варфарина.

Особые указания

Недопустимо резкое прекращение приема бета-адреноблокаторов (при резком прекращении лечения возможно развитие синдрома "отмены") лечение по возможности следует прекращать постепенно сокращая дозу в течение 10 дней (1-2 недели у пациентов с ишемической болезнью сердца). Контроль за пациентами принимающими бета-адреноблокаторы включает наблюдение за частотой сердечных сокращений и артериальным давлением (в начале приема - ежедневно затем 1 раз в 3-4 мес.). У пожилых пациентов необходим контроль функции почек (1 раз в 4-5 месяцев). При стабильной стенокардии подобранная доза должна обеспечивать 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 - 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. Бета-адреноблокаторы следует с осторожностью применять у пациентов с хронической обструктивной болезнью легких поскольку возможно усиление бронхоспазма. Бета-адреноблокаторы не следует применять у пациентов с

нелеченной хронической сердечной недостаточностью до тех пор пока состояние не стабилизировалось. Лечение хронической сердечной недостаточности небивололом проводят на фоне стабильных показателей сердечно-сосудистой системы не ранее чем через 6 недель после окончания периода декомпенсации. Небиволол можно применять для терапии хронической сердечной недостаточности одновременно с тиазидными диуретиками дигоксином ингибиторами АПФ или антагонистами рецепторов ангиотензина II. У курящих пациентов эффективность бета-адреноблокаторов ниже чем у некурящих. Небиволол не оказывает влияния на концентрацию глюкозы у пациентов с сахарным диабетом однако под действие небиволола могут оказаться замаскированными признаки гипогликемии (тахикардия ощущение сердцебиения) вызванные применением гипогликемических средств. У пациентов сахарным диабетом контроль концентрации глюкозы следует проводить 1 раз в 4-5 мес. Бета-адреноблокаторы следует с осторожностью применять у пациентов с повышенной функцией щитовидной железы в связи с тем что под влиянием могут маскироваться клинические признаки гипертиреоза такие как тахикардия. Резкая отмена препарата может вызвать обострение симптомов заболевания и развитие тиреотоксического криза. Применение небиволола у пациентов с феохромоцитомой возможно только при совместном приеме альфа-адреноблокаторов. Бета-адреноблокаторы могут повысить чувствительность к аллергенам и тяжесть анафилактических реакций. 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. При решении вопроса о назначении препарата пациентам с псориазом следует тщательно соотнести предполагаемую пользу от применения препарата и возможный риск обострения течения псориаза. Пациенты пользующиеся контактными линзами должны учитывать что на фоне лечения бета-адреноблокаторами возможно уменьшение продукции слезной жидкости. Если во время терапии Небивололом пациенту требуется провести хирургическое вмешательство необходимо проинформировать хирурга-анестезиолога о характере проводимой терапии. Продолжение бета-адреноблокады уменьшает риск возникновения аритмии во время введения наркоза и интубации. Если подготовка к операции 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. Влияние на способность управлять трансп. ср. и мех.: Исследования влияния небиволола на способность управлять транспортными средствами и механизмами не проводились. Фармакологические исследования

показали что небиволол не оказывает влияния на скорость психомоторных реакций. Из-за возможного появления побочных эффектов таких как головокружение и повышенная утомляемость в период лечения препаратом необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии другими потенциально опасными видами деятельности требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Условия хранения

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