
Состав и форма выпуска

Таблетки.

Белые или слегка крапчатые, капсулообразные, двояковыпуклые таблетки с гравировкой «80» на одной стороне и с линией разрыва на другой стороне.

Действующее вещество: надолол 80,0 мг.

Вспомогательные вещества: микрокристаллическая целлюлоза, стеарат магния.

Фармакологическое действие

Надолол является агентом, блокирующим бета-адренергические рецепторы, с пролонгированной активностью, позволяющим принимать один раз в день при стенокардии, гипертонии, нарушениях сердечного ритма, профилактике мигрени и облегчении симптомов гипертиреоза.

Надолол не метаболизируется. Он не обладает мембраностабилизирующей или внутренней симпатомиметической активностью, и его единственным действием на вегетативную нервную систему является бета-адренергическая блокада. Надолол неселективен.

Блокирование рецептора надололом приводит к защите от чрезмерной неадекватной симпатической активности. Надолол уменьшает количество и тяжесть приступов стенокардии, блокируя реакцию на стимуляцию катехоламинами и, таким образом, снижает потребность сердца в кислороде при любом уровне усилий.

Надолол снижает как лежачее, так и прямое кровяное давление. Как и другие бета-адреноблокаторы, надолол оказывает антиаритмическое действие. Было показано, что надолол уменьшает быстрый желудочковый ответ, который сопровождает мерцание / трепетание предсердий, замедляя проводимость через АВ-узел. Бета-блокада имеет особое значение при аритмии, вызванной повышенным уровнем или чувствительностью сердца к циркулирующим катехоламинам, например аритмии, связанные с феохромоцитомой, тиреотоксикозом или физической нагрузкой. Надолол эффективен в сокращении желудочковых преждевременных ударов у отдельных пациентов.

Надолол оказывает влияние на профилактику мигрени с помощью механизма, который может включать предотвращение вазоконстрикции в области, обслуживаемой внутренней сонной артерией, и предотвращение чрезмерной адренергической вазодилатации в наружной сонной артерии.

Надолол облегчает симптомы тиреотоксикоза и обеспечивает симптоматический контроль

до и во время операции на щитовидной железе.

Было показано, что бета-блокирующие агенты в крупномасштабных исследованиях снижают смертность путем предотвращения повторного инфаркта и внезапной смерти у пациентов, переживших первый инфаркт миокарда.

Фармакокинетика

Поглощение

Около 30 процентов пероральной дозы Corgard поглощается. Наличие пищи в желудочно-кишечном тракте не влияет на скорость или степень поглощения.

Распределение

Пиковые концентрации в сыворотке обычно возникают через 3-4 часа после приема препарата. Приблизительно 30 процентов веществ препарата, присутствующих в сыворотке, обратимо связаны с белками плазмы.

Биотрансформация

Коргард не метаболизируется.

Устранение

В отличие от большинства доступных бета-блокирующих агентов, Corgard не метаболизируется и выводится из организма в основном без изменений почками. Период полувыведения из терапевтических доз Corgard сыворотки является относительно длительным, в диапазоне от 20 до 24 часов (с учетом один раз в день дозировки).

Характеристики в конкретных группах субъектов или пациентов:

У больных гипертонической болезнью была продемонстрирована значительная корреляция между минимальной устойчивой концентрацией сыворотки Corgard и общей суточной пероральной дозой; однако наблюдаемый диапазон доза-ответ является широким и правильная дозировка требует индивидуального титрования.

Показания к применению

Показаниями к назначению Коргарда являются:

- Стенокардия: для длительного ведения пациентов со стенокардией путем непрерывного приема лекарств.
- Гипертония: для долгосрочного лечения эссенциальной гипертонии, отдельно или в сочетании с другими антигипертензивными средствами, особенно с диуретиками тиазидного типа.
- Аритмии: для лечения сердечных тахикардий.
- Мигрень: для профилактического лечения мигрени. Эффективность препарата в лечении приступа мигрени, который уже начался, не была установлена, и Corgard не указывается для такого использования.

- Тиреотоксикоз: для облегчения симптомов гипертиреоза и предоперационной подготовки пациентов к операции. Надолол может быть использован в сочетании с обычной анти тиреоидной терапией.

Режим дозирования

Дозировка должна титроваться постепенно, по крайней мере, с интервалом в неделю для оценки ответа; у индивидуумов наблюдаются значительные различия в ответе на бета-адренергическую блокаду.

Corgard может быть дан в дозировке один раз в день независимо от приема пищи. Интервал дозировки должен быть увеличен, когда клиренс креатинина ниже 50 мл / мин / 1,73 м².

Если прием препарата должен быть прекращен, уменьшать дозировку необходимо в течение как минимум двух недель.

Стенокардия:

Первоначально 40 мг один раз в день. Доза может увеличиваться с недельными интервалами, пока не будет получен адекватный ответ или не возникнет чрезмерная брадикардия. Большинство пациентов отвечают на 160 мг или менее ежедневно. Значение и безопасность суточных доз, превышающих 240 мг, не установлены.

Гипертония:

Первоначально 80 мг один раз в день. Доза может быть увеличена на еженедельный прирост 80 мг или меньше, пока не будет получен оптимальный ответ. Многие пациенты отвечают на 80 мг в день, и большинство пациентов отвечают на 240 мг или менее ежедневно, но для некоторых пациентов требуются более высокие дозы. У некоторых пациентов необходимо вводить диуретик, периферический вазолидатор и / или другие антигипертензивные препараты в сочетании с надололом для достижения удовлетворительного ответа.

Лечение гипертонии, связанной с феохромоцитомой, может потребовать добавления альфа-блокирующего агента.

Сердечные тахикардии:

Первоначально 40 мг один раз в день. Доза может быть увеличена при необходимости до 160 мг один раз в день. Если возникает брадикардия, дозу следует уменьшить до 40 мг один раз в день.

Мигрень:

Начальная доза надолола составляет 40 мг один раз в день. Дозировка может постепенно увеличиваться с шагом 40 мг, пока не будет достигнута оптимальная профилактика мигрени. Обычная поддерживающая доза составляет от 80 до 160 мг один раз в день. Через 4-6 недель при максимальной дозе, если удовлетворительный ответ не получен, терапию надололом следует постепенно прекратить.

Тиреотоксикоз:

Диапазон дозировки составляет 80-160 мг один раз в день. Было установлено, что большинству пациентов требуется доза 160 мг один раз в день. Надолол может использоваться вместе с обычным лечением против щитовидной железы. Для подготовки пациентов к частичной тиреоидэктомии надолол следует вводить в сочетании с йодидом калия в течение 10 дней до операции. Надолол следует назначать утром после операции. После операции дозу надолола следует постепенно снижать, а затем отменять после достижения клинической стабильности.

Детская популяция:

Безопасность и эффективность надолола у детей не установлена.

Пожилые люди:

У пожилых пациентов следует использовать низкую начальную дозу, чтобы можно было оценить чувствительность к побочным эффектам.

Почечная или печеночная недостаточность:

Как и со всеми препаратами, пациенты с нарушениями функции почек или печени должны контролироваться.

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к действующему веществу или любому из наполнителей.
- Бронхиальная астма или история астмы.
- Синусовая брадикардия.
- Больше чем атриовентрикулярная проводимость блока первой степени.
- Кардиогенный шок.
- Правожелудочковая недостаточность вторичная по отношению к легочной гипертензии.
- Явная сердечная недостаточность.
- Ранее продемонстрированная гиперчувствительность к надололу.

Особые предупреждения и меры предосторожности при использовании

Обострение ишемической болезни сердца после внезапной отмены

Повышенная чувствительность к катехоламинам наблюдалась у пациентов, отказавшихся от терапии бета-блокаторами; обострение стенокардии, гипертензии и, в некоторых случаях, инфаркт миокарда произошли после резкого прекращения такой терапии. При прекращении приема надолола в хронической форме, особенно у пациентов с ишемической болезнью сердца, дозировку следует постепенно снижать в течение периода от одной до двух недель, а пациента следует тщательно контролировать. Если стенокардия заметно ухудшается или развивается острая коронарная недостаточность, следует

незамедлительно возобновить прием надолола (по крайней мере, временно) и принять другие меры, подходящие для лечения нестабильной стенокардии. Пациенты должны быть предупреждены о прекращении или прекращении терапии без консультации с врачом. Поскольку заболевание коронарной артерии является распространенным и может быть нераспознанным, целесообразно не прерывать терапию надололом внезапно, даже у пациентов, получающих лечение только от гипертонии.

Пациенты с историей сердечной недостаточности

Симпатическая стимуляция может быть жизненно важным компонентом, поддерживающим функцию кровообращения у пациентов с застойной сердечной недостаточностью, а бета-блокада может усугубить недостаточность.

Хотя следует избегать применения бета-блокаторов, включая надолол, при явной застойной сердечной недостаточности, при необходимости их можно осторожно использовать у пациентов с сердечной недостаточностью в анамнезе, которые хорошо компенсированы (обычно при использовании дигиталиса и диуретиков). Бета-адренергические блокирующие агенты не отменяют инотропное действие наперстянки на сердечную мышцу.

Пациенты без истории сердечной недостаточности

Продолжающаяся депрессия миокарда с бета-блокадой в течение определенного периода времени может в некоторых случаях приводить к сердечной недостаточности. При первых признаках или симптомах надвигающейся сердечной недостаточности пациент должен быть полностью переведен в цифровую форму и / или обработан диуретиками, а реакция должна внимательно наблюдаться.

Если сердечная недостаточность продолжается, несмотря на адекватную дигитализацию и диурез, Коргард следует отменить (постепенно, если это возможно).

Обширное оперативное вмешательство

Бета-блокада ухудшает способность сердца реагировать на рефлексорные раздражители и может увеличить риск общей анестезии и хирургических процедур, что приводит к длительной гипотонии или низкому сердечному выбросу. Обычно предполагалось, что бета-блокаторная терапия должна быть отменена за несколько дней до операции. Признание повышенной чувствительности к катехоламинам больных недавно выведенных из бета-блокатор терапии, однако, сделала эту рекомендацию спорным. По возможности бета-адреноблокаторы, включая надолол, должны быть сняты задолго до операции

Ни при каких обстоятельствах не следует отменять бета-адреноблокаторы до операции у пациентов с феохромоцитомой или тиреотоксикозом.

В случае неотложной хирургии анестезиолог должен быть проинформирован о том, что пациент находится на терапии бета-блокаторами. Эффекты надолола можно обратить путем введения агонистов бета-рецепторов, таких как изопреналин или добутамин. Однако такие пациенты могут быть подвержены длительной тяжелой гипотонии. Сообщалось также о трудностях с возобновлением и поддержанием сердечного ритма с помощью агентов, блокирующих бета-адренергические рецепторы.

(Исключением из вышеприведенного абзаца является операция на щитовидной железе).

Неаллергический бронхоспазм (например, хронический бронхит, эмфизема)

Пациенты с бронхоспастическими заболеваниями, как правило, не должны получать бета-адреноблокаторы, поскольку они могут блокировать бронходилатацию, вызванную эндогенной или экзогенной катехоламиновой стимуляцией бета-рецепторов.

Диабет и гипогликемия

Бета-адренергическая блокада может предотвратить появление предупреждающих знаков и симптомов (например, тахикардия и изменения артериального давления) острой гипогликемии. Это особенно важно для лабильных диабетиков. Бета-блокада также снижает выброс инсулина в ответ на гипергликемию; таким образом может потребоваться корректировать дозу антидиабетических препаратов.

Иногда вызывает гипогликемию даже у пациентов, не страдающих диабетом, например, у новорожденных, младенцев, детей, пожилых пациентов, пациентов, находящихся на гемодиализе, или пациентов, страдающих хроническим заболеванием печени, и пациентов, страдающих от передозировки. Тяжелая гипогликемия, связанная с надололом, редко сопровождалась судорогами и / или комой у изолированных пациентов.

Кожные высыпания

Поступали сообщения о кожных высыпаниях (в том числе псориазообразного типа) и / или окулярных изменениях (конъюнктивит и «сухость глаз»), связанных с применением бета-адренергических блокирующих препаратов. Сообщаемая частота невелика, и в большинстве случаев симптомы исчезли после прекращения лечения. Следует прекратить прием препарата, если любая такая реакция не может быть объяснена иным образом. Прекращение терапии бета-адренергическим блокатором должно быть постепенным.

Лечение анафилактической реакции

Принимая бета-адреноблокаторы, пациенты с тяжелой анафилактической реакцией в анамнезе могут быть более восприимчивы к повторному заражению, случайному, диагностическому или терапевтическому. Такие пациенты могут не реагировать на обычные дозы адреналина, используемые для лечения аллергической реакции. (ПРИМЕЧАНИЕ: адреналин в сочетании с некардиоселективными бета-блокаторами, такими как надолол, может вызвать гипертонический эпизод с последующей брадикардией.)

Тиреотоксикоз

Бета-адренергическая блокада может маскировать определенные клинические признаки гипертиреоза (например, тахикардия). Резкая абстиненция надолола у пациентов со щитовидной железой может ускорить шторм щитовидной железы

Меры предосторожности

Иногда бета-блокада с помощью таких препаратов, как надолол, может вызывать гипотензию и / или выраженную брадикардию, что приводит к головокружению, обмороку

или ортостатической гипотензии.

Нарушение функции почек или печени

Надолол следует использовать с осторожностью у пациентов с нарушениями функции почек или печени.

Канцерогенез, мутагенез, нарушение фертильности

В хронических пероральных токсикологических исследованиях, продолжавшихся от одного до двух лет, надолол не оказывал каких-либо значительных токсических эффектов у мышей, крыс или собак. В двухлетних оральных канцерогенных исследованиях на крысах и мышах надолол не вызывал каких-либо неопластических, преднеопластических или неопухолевых патологических повреждений. В исследованиях фертильности и общей репродуктивной функции у крыс надолол не вызывал побочных эффектов.

Стресс-тесты

Бета-блокаторы, включая надолол, существенно влияют на точность всех видов стресс-тестов.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие формы взаимодействия

Общие анестетики

Те, которые вызывают депрессию миокарда, такие как хлороформ, циклопропан, трихлорэтилен и эфир, следует избегать, так как у пациента может быть длительная тяжелая гипотензия.

Депрессанты миокарда

Депрессанты миокарда, такие как лидокаин и прокаинамид, могут подвергать пациента длительной тяжелой гипотонии.

Стимуляторы адренорецепторов

Стимуляторы бета-адренорецепторов, такие как изопреналин и верапамил, или стимуляторы альфа-адренорецепторов, такие как норадреналин и адреналин, обратят гипотензивные эффекты и увеличат вазоконстрикторную активность.

Катехоламины, истощающие наркотики

Аддитивные эффекты могут возникнуть с надололом; внимательно следить за доказательствами гипотонии и / или чрезмерной брадикардии (например, головокружение, обмороки, постуральная гипотензия).

Антигипертензивные средства (например, нейроноблокирующие препараты, вазодилататоры, диуретики)

Аддитивный гипотензивный эффект.

Клофелин

Если Коргард и клонидин назначаются одновременно, клонидин не следует отменять в течение нескольких дней после отмены Коргарда.

Противодиабетические препараты (пероральные препараты и инсулин)

Гипогликемия или гипергликемия - дозировка антидиабетического препарата должна быть отредактирована соответствующим образом.

Ингибиторы моноаминоксидазы (MAOIs)

Отдельные случаи брадикардии имели место при одновременном применении бета-блокаторов и ИМАО.

Антимускариновые препараты

Может противодействовать брадикардии, вызванной бета-блокаторами.

Блокаторы кальциевых каналов

Блокаторы кальциевых каналов обычно усиливают фармакологические эффекты бета-блокаторов. Пациенты, принимающие оба препарата, должны тщательно контролироваться на предмет неблагоприятных сердечно-сосудистых событий.

Дилтиазем

Сообщалось о повышенном риске депрессии при одновременном назначении бета-блокаторов с дилтиаземом.

Другие антиаритмические агенты

Аддитивные или антагонистические эффекты могут возникнуть с надололом.

Fingolimod

Одновременный прием Финголимода с бета-адреноблокаторами может усиливать брадикардический эффект и не рекомендуется. Если такое совместное введение считается необходимым, рекомендуется соответствующий мониторинг в начале лечения, то есть, по крайней мере, мониторинг в течение ночи.

Лидокаин, IV

Значительное снижение клиренса лидокаина может происходить при одновременном назначении бета-блокатора.

Нестероидные противовоспалительные средства (НПВП)

Антигипертензивные эффекты бета-блокаторов могут быть уменьшены при одновременном назначении индометацина и, возможно, других НПВП.

Фенотиазины и другие антипсихотические средства

Аддитивные антигипертензивные эффекты имели место с другими бета-блокаторами, когда они давались одновременно с фенотиазинами или галоперидолом.

Вазоконстриктор агенты

Эффекты с надололом могут быть аддитивными (например, с алкалоидами спорыньи).

Беременность и кормление грудью

Не существует адекватных и контролируемых исследований у беременных женщин.

Надолол следует использовать во время беременности, только если потенциальные выгоды оправдывают потенциальный риск для плода.

Сообщалось о задержке роста плода.

У новорожденных, чьи матери получают надолол при родах, наблюдаются брадикардия, гипогликемия, респираторный дистресс и сопутствующие симптомы.

Грудное вскармливание

Надолол выделяется из организма в материнском молоке. Из-за возможного неблагоприятного воздействия на грудных детей, необходимо принять решение о том, следует ли прекратить кормить грудью или прекратить терапию, принимая во внимание важность надолола для матери.

Влияние на способность управлять автомобилем и использовать машины

Там нет исследований о влиянии этого лекарства на способность управлять автомобилем. При управлении транспортными средствами или эксплуатационными машинами следует учитывать, что иногда может возникнуть головокружение или усталость.

Побочные действия

Брадикардия, гипотензия, парестезии, сухость во рту, нарушения со стороны ЖКТ, бессонница.

Передозировка

В случае передозировки надолол может вызвать чрезмерную брадикардию, сердечную недостаточность, гипотензию или бронхоспазм.

Сообщалось о временном увеличении БУН, и могут происходить изменения электролита в

сыворотке крови, особенно у пациентов с нарушениями функции почек.

Лечение

Надолол может быть удален из общего кровотока гемодиализом. При определении продолжительности корректирующей терапии необходимо учитывать длительность эффекта надолола.

В дополнение к промыванию желудка, при необходимости, должны применяться следующие меры:

Сердечная недостаточность

Наперстянка гликозид и мочегонное средство. Сообщалось, что глюкагон также может быть полезен в этой ситуации.

Гипотония

Если введение жидкости неэффективно, необходимо использовать вазопрессоры, такие как дофамин, добутамин или адреналин.

Бронхоспазм

Бета-2-агонист агент и / или производное теофиллина.

Ступор или кома

Поддерживающая терапия гарантирована.

Желудочно-кишечные эффекты

Симптоматическое лечение по мере необходимости.

Нарушения и/или аномалии электролита сыворотки

Принятие мер поддержки для поддержания гидратации, электролитного баланса, дыхания, сердечно-сосудистой и почечной функции.

Условия хранения

При комнатной температуре не выше 30 °C.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Условия продажи

По рецепту.