МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

АТЕНОЛОЛ

Регистрационный номер:

Торговое название препарата: Атенолол

Международное непатентованное название (МНН): атенолол

Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Состав:

1 таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит:

Активное вещество: атенолол 25,0 мг.

Вспомогательные вещества (ядро): целлюлоза микрокристаллическая – 58,5 мг, карбоксиметилкрахмал натрия – 3,2 мг, повидон (поливинилпирролидон) – 1,5 мг, магния стеарат – 1,5 мг, крахмал картофельный – 5,0 мг, кремния диоксид коллоидный – 0,3 мг.

Вспомогательные вещества (оболочка): Опадрай II 85F48105 белый – 3,0 мг, в т.ч. поливиниловый спирт – 1,407 мг, макрогол-3350 – 0,708 мг, тальк – 0,522 мг, титана диоксид – 0,363 мг.

Активное вещество: атенолол 50,0 мг.

Вспомогательные вещества (ядро): целлюлоза микрокристаллическая – 117,0 мг, карбоксиметилкрахмал натрия – 6,4 мг, повидон (поливинилпирролидон) – 3,0 мг, магния стеарат – 3,0 мг, крахмал картофельный – 10,0 мг, кремния диоксид коллоидный – 0,6 мг.

Вспомогательные вещества (оболочка): Опадрай II 85F48105 белый – 6,0 мг, в т.ч. поливиниловый спирт – 2,814 мг, макрогол-3350 – 1,416 мг, тальк – 1,044 мг, титана диоксид – 0,726 мг.

Активное вещество: атенолол 100,0 мг.

Вспомогательные вещества (ядро): целлюлоза микрокристаллическая – 234,0 мг, карбоксиметилкрахмал натрия – 12,8 мг, повидон (поливинилпирролидон) – 6,0 мг,

магния стеарат – 6,0 мг, крахмал картофельный – 20,0 мг, кремния диоксид коллоидный – 1,20 мг.

Вспомогательные вещества (оболочка): Опадрай II 85F48105 белый – 12,0 мг, в т.ч. поливиниловый спирт – 5,628 мг, макрогол-3350 – 2,832 мг, тальк – 2,088 мг, титана диоксид – 1,452 мг.

Описание:

Цилиндрические, двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, на изломе видны два слоя – ядро белого или почти белого цвета и пленочная оболочка.

Фармакотерапевтическая группа: бета$_1$-адреноблокатор селективный

Код АТХ: C07AB03

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Оказывает антиангинальное, антигипертензивное и антиаритмическое действие. Не обладает мембраностабилизирующей и внутренней симпатомиметической активностью. Уменьшает стимулированное катехоламинами образование циклического аденозинмонофосфата (цАМФ) из аденозинтрифосфата (АТФ), снижает внутриклеточный ток ионов кальция. В первые 24 ч после приема внутрь на фоне снижения сердечного выброса отмечается реактивное повышение общего периферического сопротивления сосудов, которое в течение 1-3 суток постепенно возвращается к исходному, а затем постепенно снижается. Антигипертензивный эффект связан с уменьшением минутного объема крови, снижением активности ренин-ангиотензин-альдостероновой системы, чувствительности барорецепторов и влиянием на центральную нервную систему. Антигипертензивное действие проявляется как снижением систолического, так и диастолического артериального давления (АД), уменьшением ударного и минутного объема крови.

В средних терапевтических дозах не оказывает влияния на тонус периферических артерий. Антигипертензивный эффект продолжается 24 ч, при регулярном применении стабилизируется к концу второй недели лечения.

Антиангинальный эффект определяется снижением потребности миокарда в кислороде в результате уменьшения частоты сердечных сокращений (удлинение диастолы и улучшение перфузии миокарда) и сократимости, а также снижением чувствительности миокарда к воздействию симпатической стимуляции. Урежает частоту сердечных

сокращений (ЧСС) в покое и при физической нагрузке. За счет повышения конечного диастолического давления в левом желудочке и увеличения растяжения мышечных волокон желудочков может повышать потребность в кислороде, особенно у пациентов с хронической сердечной недостаточностью.

Антиаритмическое действие проявляется подавлением синусовой тахикардии и связано с устранением аритмогенных симпатических влияний на проводящую систему сердца, уменьшением скорости распространения возбуждения через синоатриальный узел и удлинением рефрактерного периода. Угнетает проведение импульсов в антеградном и в меньшей степени в ретроградном направлениях через AV (атриовентрикулярный) узел и по дополнительным путям проведения.

Отрицательный хронотропный эффект проявляется через 1 ч после приема, достигает максимума спустя 2-4 ч, продолжается до 24 ч.

Уменьшает автоматизм синусового узла, урежает ЧСС, замедляет AV проводимость, снижает сократимость миокарда, снижает потребность миокарда в кислороде. Уменьшает возбудимость миокарда. При применении в средних терапевтических дозах оказывает менее выраженное влияние на гладкую мускулатуру бронхов и периферических артерий, чем неселективные бета-адреноблокаторы.

Увеличивает выживаемость пациентов, перенесших инфаркт миокарда (снижает частоту развития желудочковых аритмий и приступов стенокардии).

Практически не ослабляет бронходилатирующее действие изопреналина.

В отличие от неселективных бета-адреноблокаторов при назначении в средних терапевтических дозах оказывает менее выраженное влияние на органы, содержащие бета$_2$-адренорецепторы (поджелудочная железа, скелетные мышцы, гладкая мускулатура периферических артерий, бронхов и матки), и на углеводный обмен. В меньшей степени оказывает отрицательный батмо-, хроно-, ино- и дромотропный эффект. При применении в больших дозах (более 100 мг/сут.) оказывает блокирующий эффект на оба подтипа бета-адренорецепторов.

Фармакокинетика

Абсорбция из желудочно-кишечного тракта - быстрая, неполная (50-60%), биодоступность - 40-50%, время достижения максимальной концентрации в плазме крови - 2-4 ч. Плохо проникает через гематоэнцефаличекий барьер, проходит в незначительных количествах через плацентарный барьер и в грудное молоко. Связь с белками плазмы крови - 6-16%. Практически не метаболизируется в печени. Период полувыведения - 6-9 ч (увеличивается у пациентов пожилого возраста). Выводится почками путем клубочковой

фильтрации (85-100% в неизмененном виде). Нарушение функции почек сопровождается удлинением периода полувыведения и кумуляцией: при клиренсе креатинина ниже 35 мл/мин/1,73 м^2 период полувыведения составляет 16-27 ч, при клиренсе креатинина ниже 15 мл/мин/1,73 м^2 - более 27 ч (необходимо уменьшение доз). Выводится в ходе гемодиализа.

Показания к применению

- артериальная гипертензия;
- профилактика приступов стенокардии (за исключением стенокардии Принцметала);
- нарушения сердечного ритма: синусовая тахикардия, профилактика наджелудочковой тахиаритмии, желудочковая экстрасистолия.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к компонентам препарата, кардиогенный шок, атриовентрикулярная (AV) блокада II-III ст. (без искусственного водителя ритма сердца), выраженная брадикардия (ЧСС менее 60 уд./мин.), синдром слабости синусового узла, синоатриальная блокада, острая или хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации, кардиомегалия без признаков сердечной недостаточности, стенокардия Принцметала, артериальная гипотензия (в случае применения при инфаркте миокарда, систолическое АД менее 100 мм рт.ст.), период грудного вскармливания, одновременный прием ингибиторов моноаминооксидазы (МАО), возраст до 18 лет (эффективность и безопасность препарата не установлены). Тяжелые формы бронхиальной астмы и хроническая обструктивная болезнь легких (ХОБЛ) в анамнезе, феохромоцитома (без одновременного применения α-адреноблокаторов), тяжелые нарушения периферического кровообращения.

Меры предосторожности при применении: сахарный диабет (может маскировать симптомы гипогликемии), гипогликемия, метаболический ацидоз, проведение десенсибилизирующей терапии, хроническая обструктивная болезнь легких, бронхоспазм (в анамнезе), AV блокада I степени, хроническая сердечная недостаточность (компенсированная), нарушения периферического кровообращения, феохромоцитома (с одновременным применением альфа-адреноблокаторов), печеночная недостаточность, миастения, тиреотоксикоз, депрессия (в т.ч. в анамнезе), псориаз, пожилой возраст, беременность, хирургическое вмешательство.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Атенолол проникает через плацентарный барьер и обнаруживается в пуповинной крови. Исследований по применению Атенолола в первом триместре не проводилось и, поэтому, нельзя исключить возможность повреждающего действия на плод. Для лечения артериальной гипертензии в третьем триместре беременности препарат применяется под тщательным врачебным контролем. Применение Атенолола при беременности может быть причиной нарушения роста плода. Назначать Атенолол беременным или планирующим беременность женщинам, следует только в тех случаях, когда польза для матери превышает потенциальный риск для плода, особенно в первом и втором триместре беременности, так как бета-адреноблокаторы снижают уровень плацентарной перфузии, что может привести к внутриутробной гибели плода или его незрелости и преждевременным родам. Кроме того, такие побочные эффекты, как гипогликемия и брадикардия, могут наблюдаться как у плода, так и у новорожденного.

Атенолол выделяется в грудное молоко, поэтому если в период кормления грудью применение препарата необходимо, грудное вскармливание рекомендуется отменить.

Способ применения и дозы

Назначают внутрь перед едой, не разжевывая, запивая небольшим количеством жидкости.

Артериальная гипертензия. Лечение начинают с 50 мг Атенолола 1 раз в сутки. Для достижения стабильного антигипертензивного эффекта требуется 1 -2 недели приема. При недостаточной выраженности антигипертензивного эффекта дозу повышают до 100 мг в один прием. Дальнейшее увеличение дозы не рекомендуется, так как оно не сопровождается усилением терапевтического эффекта.

При ишемической болезни сердца, тахисистолических нарушениях сердечного ритма – 50 мг 1 раз в сутки.

Стенокардия. Начальная доза составляет 50 мг в сутки. Если в течение недели не достигается оптимальный терапевтический эффект, увеличивают дозу до 100 мг в сутки.

Пациентам пожилого возраста и пациентам с нарушениями выделительной функции почек необходима коррекция режима дозирования. При наличии почечной недостаточности рекомендуют коррекцию дозы в зависимости от клиренса креатинина. У больных с почечной недостаточностью при значениях клиренса креатинина выше 35 мл/мин./1,73м^2 (нормальные значения составляют 100-150 мл/мин./1,73 м^2) значительной кумуляции атенолола не происходит. Рекомендуются следующие максимальные дозы для больных с почечной недостаточностью:

Клиренс креатинина (мл/мин./1,73 м^2)	Период полувыведения атенолола (ч)	Максимальная доза
15 - 35	16 - 27	50 мг в сутки или 100 мг через день
менее 15	более 27	50 мг через день или 100 мг 1 раз в 4 дня

Пациентам, находящимся на гемодиализе, Атенолол назначают по 25 или 50 мг/сутки сразу после проведения каждого диализа, что необходимо проводить в стационарных условиях, так как может иметь место снижение АД.

У пожилых пациентов начальная однократная доза - 25 мг (может быть увеличена под контролем АД, ЧСС).

Увеличение суточной дозы свыше 100 мг не рекомендуется, так как терапевтический эффект не усиливается, а вероятность развития побочных эффектов возрастает.

Побочное действие

Со стороны сердечно-сосудистой системы: развитие (усугубление) симптомов хронической сердечной недостаточности (отечность лодыжек, стоп; одышка), нарушение атриовентрикулярной проводимости, аритмия, брадикардия, выраженное снижение АД, ощущение сердцебиения, снижение сократимости миокарда, ортостатическая гипотензия, проявления ангиоспазма (похолодание нижних конечностей, синдром Рейно), васкулит, боль в груди, синдром слабости синусового узла.

Со стороны центральной нервной системы: головокружение, снижение способности к концентрации внимания, снижение быстроты реакции, сонливость или бессонница, депрессия, галлюцинации, повышенная утомляемость, головная боль, слабость, "кошмарные" сновидения, беспокойство, спутанность сознания или кратковременная потеря памяти, парестезии в конечностях (у больных с "перемежающейся" хромотой и синдромом Рейно), мышечная слабость, судороги.

Со стороны пищеварительной системы: сухость слизистой оболочки полости рта, тошнота, рвота, боль в животе, запор или диарея, нарушение вкуса.

Со стороны дыхательной системы: диспноэ, бронхоспазм, апноэ, заложенность носа.

Со стороны системы гемостаза: тромбоцитарная пурпура, анемия (апластическая), тромбоз.

Со стороны репродуктивной системы: снижение потенции, снижение либидо, болезнь Пейрони.

Со стороны обмена веществ: гипергликемия (у пациентов сахарным диабетом 2 типа), гипогликемия (у пациентов сахарным диабетом 1 типа), гипотиреоидное состояние.

Со стороны кожных покровов: крапивница, дерматиты, кожный зуд, фоточувствительность, усиление потоотделения, гиперемия кожи, обострение течения псориаза, обратимая алопеция.

Со стороны органа чувств: нарушения зрения, уменьшение секреции слезной жидкости, сухость и болезненность глаз, конъюнктивит.

Влияние на плод: внутриутробная задержка роста, гипогликемия, брадикардия.

Лабораторные показатели: агранулоцитоз, лейкопения, повышение активности "печеночных" ферментов, гипербилирубинемия, тромбоцитопения (необычные кровотечения и кровоизлияния).

Прочие: боль в спине, артралгия, синдром "отмены" (тахикардия, учащение приступов стенокардии, повышение АД и т.д.).

Частота побочных явлений возрастает при увеличении дозы препарата.

Передозировка

Симптомы: выраженная брадикардия, AV блокада II-III степени, нарастание симптомов сердечной недостаточности, выраженное снижение АД, затруднение дыхания, бронхоспазм, головокружение, обморок, аритмия, желудочковая экстрасистолия, цианоз ногтей пальцев или ладоней, судороги, гипогликемия.

Лечение: промывание желудка и назначение адсорбирующих средств; при возникновении бронхоспазма показано ингаляционное или внутривенное введение бета$_2$-адреномиметика сальбутамола. При нарушении AV проводимости, брадикардии - внутривенное введение 1-2 мг атропина, эпинефрина или постановка временного кардиостимулятора; при желудочковой экстрасистолии - лидокаин (препараты IA класса не применяются); при выраженном снижении АД - пациент должен находиться в положении Тренделенбурга. Если нет признаков отека легких - внутривенно плазмозамещающие растворы, при неэффективности - введение эпинефрина, допамина, добутамина; при хронической сердечной недостаточности - сердечные гликозиды, диуретики, глюкагон; при судорогах - внутривенно диазепам. Возможно проведение диализа. При гипогликемии может быть показано внутривенное введение декстрозы (глюкозы).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

При одновременном применении атенолола с инсулином, гипогликемическими средствами для приема внутрь - их гипогликемическое действие усиливается.

При одновременном применении с гипотензивными средствами разных групп или нитратов происходит усиление антигипертензивного действия.

Одновременное применение атенолола и верапамила (или дилтиазема) может вызвать взаимное усиление кардиодепрессивного действия.

Антигипертензивный эффект ослабляют эстрогены (задержка натрия) и нестероидные противовоспалительные препараты, глюкокортикостероиды.

При одновременном применении атенолола и сердечных гликозидов повышается риск развития брадикардии и нарушения атриовентрикулярной проводимости.

При одновременном назначении атенолола с резерпином, метилдопой, клонидином, верапамилом возможно возникновение выраженной брадикардии.

Одновременное внутривенное введение верапамила и дилтиазема может спровоцировать остановку сердца; нифедипин может приводить к значительному снижению АД.

При одновременном приеме атенолола с производными эрготамина, ксантина, эффективность его снижается.

При прекращении комбинированного применения атенолола и клонидина лечение клонидином продолжают еще несколько дней после отмены атенолола.

Одновременное применение с лидокаином, может уменьшить его выведение и повысить риск токсического действия лидокаина.

Применение совместно с производными фенотиазина, способствует повышению концентрации каждого из препаратов в сыворотке крови.

Фенитоин при внутривенном введении, лекарственные средства для общей анестезии (производные углеводородов) повышают выраженность кардиодепрессивного действия и вероятность снижения АД.

При одновременном применении с эуфиллином и теофиллином, возможно взаимное подавление терапевтических эффектов.

Не рекомендуется одновременное применение с ингибиторами МАО вследствие значительного усиления антигипертензивного действия, перерыв в лечении между приемом ингибиторов МАО и атенолола должен составлять не менее 14 дней.

Аллергены, используемые для иммунотерапии, или экстракты аллергенов для кожных проб повышают риск возникновения тяжелых системных аллергических реакций или анафилаксии.

Средства для ингаляционного наркоза (производные углеводородов) повышают риск угнетения функции миокарда и развития артериальной гипертензии.

Амиодарон повышает риск развития брадикардии и угнетения AV проводимости.

Циметидин увеличивает концентрацию в плазме крови (тормозит метаболизм).

Йодсодержащие рентгеноконтрастные средства для внутривенного введения повышают риск развития анафилактических реакций.

Удлиняет действие недеполяризующих миорелаксантов и антикоагулянтный эффект кумаринов.

Три- и тетрациклические антидепрессанты, антипсихотические средства (нейролептики), этанол, седативные и снотворные средства усиливают угнетение центральной нервной системы.

Негидрированные алкалоиды спорыньи повышают риск развития нарушений периферического кровообращения.

Особые указания

Контроль за пациентами, принимающими Атенолол, должен включать наблюдение за ЧСС и АД (в начале лечения - ежедневно, затем 1 раз в 3-4 мес.), концентрацией глюкозы крови у пациентов сахарным диабетом (1 раз в 4-5 мес.). У пожилых пациентов рекомендуется следить за функцией почек (1 раз в 4-5 мес.).

Следует обучить пациента методике подсчета ЧСС и проинструктировать о необходимости врачебной консультации при ЧСС менее 60 уд./мин.

При тиреотоксикозе атенолол может маскировать определенные клинические признаки тиреотоксикоза (например, тахикардию). Резкая отмена у пациентов с тиреотоксикозом противопоказана, поскольку способна усилить симптоматику. При сахарном диабете может маскировать тахикардию, вызванную гипогликемией. В отличие от неселективных бета-адреноблокаторов практически не усиливает вызванную инсулином гипогликемию и не задерживает восстановление концентрации глюкозы в крови до нормального уровня.

У пациентов с ишемической болезнью сердца (ИБС) резкая отмена бета-адреноблокаторов может вызывать увеличение частоты или тяжести ангиозных приступов, поэтому прекращение приема атенолола у пациентов с ИБС необходимо проводить постепенно.

По сравнению с неселективными бета-адреноблокаторами, кардиоселективные бета-адреноблокаторы обладают меньшим воздействием на функцию легких, тем не менее, при обструктивных заболеваниях дыхательных путей Атенолол назначают только в случае абсолютных показаний. При необходимости их назначения в некоторых случаях можно рекомендовать применение бета$_2$-адреномиметиков.

Пациентам с бронхоспастическими заболеваниями можно назначать кардиоселективные адреноблокаторы в случае непереносимости и/или неэффективности других гипотензивных средств, но при этом следует строго следить за дозировкой. Передозировка опасна развитием

бронхоспазма.

Особое внимание необходимо в случаях, если требуется хирургическое вмешательство под общей анестезией у пациентов, принимающих Атенолол. Прием препарата следует прекратить за 48 часов до хирургического вмешательства. В качестве анестетика следует выбирать препарат с возможно минимально отрицательным инотропным действием.

При одновременном применении атенолола и клонидина прием Атенолола прекращают на несколько дней раньше клонидина с целью избежания симптома отмены последнего.

Возможно усиление выраженности реакции повышенной чувствительности и отсутствие эффекта от обычных доз эпинефрина (адреналина) на фоне отягощенного аллергологического анамнеза.

Лекарственные средства, снижающие запасы катехоламинов (например, резерпин), могут усилить действие бета-адреноблокаторов, поэтому пациенты, принимающие такие сочетания лекарственных средств, должны находиться под постоянным наблюдением врача на предмет выявления выраженного снижения АД или брадикардии.

В случае появления у пациентов пожилого возраста нарастающей брадикардии (менее 60 уд./мин), артериальной гипотензии (систолическое АД ниже 100 мм рт.ст,), атриовентрикулярной блокады, бронхоспазма, желудочковых аритмий, тяжелых нарушений функции печени и почек необходимо уменьшить дозу или прекратить лечение.

Рекомендуется прекращать терапию при развитии депрессии, вызванной приемом бета-адреноблокаторов.

В случае необходимости внутривенного введения верапамила это следует делать через 48 часов после приема Атенолола.

При применении Атенолола возможно уменьшение продукции слезной жидкости, что имеет значение у пациентов, пользующихся контактными линзами.

Нельзя резко прерывать лечение из-за опасности развития тяжелых аритмий и инфаркта миокарда. Отмену проводят постепенно, снижая дозу в течение 2 нед. и более (снижают дозу на 25% в 3-4 дня).

Атенолол следует отменять перед исследованием содержания в крови и моче катехоламинов, норметанефрина и ванилилминдальной кислоты; титров антинуклеарных антител.

У курильщиков эффективность бета-адреноблокаторов ниже.

Влияние на способность управлять автотранспортом и заниматься другими потенциально опасными видами деятельности

В период лечения необходимо воздержаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой по 25 мг, 50 мг, 100 мг.

По 10, 30 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 10, 20, 30, 40, 50 или 100 таблеток в банки полимерные для лекарственных средств.

Одну банку или 1, 2, 3, 4, 5 или 10 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению помещают в картонную упаковку (пачку).

Условия хранения

В защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в местах, недоступных для детей.

Срок годности

3 года. Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Производитель

ООО «Озон»

Юридический адрес: 445351, Россия, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Песочная, д. 11.

Адрес места производства (адрес для переписки, в том числе для приема претензий): 445351, Россия, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.

Тел./факс: (84862) 3-41-09, 7-18-51

E-mail: ozon_pharm@samtel.ru

www.ozonpharm.ru

Директор ООО «Атолл» В. В. Брудневский

ЭКСПЕРТНЫЙ ОТЧЕТ
ДЕЙСТВИТЕЛЕН ДЛЯ ДАННОЙ ВЕРСИИ ДОКУМЕНТА
0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 4