МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ И СОЦИАЛЬНОГО РАЗВИТИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

ОБЗИДАН

Регистрационный номер:

Торговое название препарата: ОБЗИДАН

Международное непатентованное название: пропранолол

Лекарственная форма: таблетки

Состав

1 таблетка содержит:

активное вещество: пропранолола гидрохлорид 40 мг;

вспомогательные вещества: лактозы моногидрат 48,10 мг, крахмал картофельный 41,90 мг, тальк 11,70 мг, карбоксиметилкрахмал натрия (тип А) 3,80 мг, желатин 2,3 мг, магния стеарат 1,60 мг, кремния диоксид коллоидный 0,60 мг.

Описание

Белые, круглые таблетки со скошенными краями. На одной стороне таблетки - риска, по одну сторону риски выдавлено “4”, по другую “0”. Другая сторона таблетки - гладкая.

Фармакотерапевтическая группа: бета-адреноблокатор

Код АТХ [C07AA05]

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Неселективный бета-адреноблокатор. Обладает антиангинальным, гипотензивным и антиаритмическим эффектом. Неселективно блокируя бета-адренорецепторы (75% бета1- и 25% бета2–адренорецепторы), уменьшает стимулированное катехоламинами образование цАМФ из АТФ, в результате чего снижает внутриклеточное поступление кальция, оказывает отрицательное хроно-, дромо-, батмо- и инотропное действие (урежает

частоту сердечных сокращений, угнетает проводимость и возбудимость, снижает сократимость миокарда).

В начале применения бета-адреноблокаторов общее периферическое сосудистое сопротивление в первые 24 ч увеличивается (в результате реципрокного возрастания активности альфа-адренорецепторов и устранения стимуляции бета2–адренорецепторов сосудов скелетной мускулатуры), но через 1–3 сут возвращается к исходному, а при длительном назначении снижается.

Гипотензивный эффект связан с уменьшением минутного объема сердца, симпатической стимуляцией периферических сосудов, снижением активности ренин-ангиотензиновой системы (имеет значение у больных с исходной гиперсекрецией ренина), чувствительностью барорецепторов дуги аорты (не происходит усиления их активности в ответ на снижение АД) и влиянием на центральную нервную систему. Гипотензивный эффект стабилизируется к концу 2 недель курсового назначения.

Антиангинальное действие обусловлено снижением потребности миокарда в кислороде (за счёт отрицательного хронотропного и инотропного эффекта). Уменьшение частоты сердечных сокращений ведет к удлинению диастолы и улучшению перфузии миокарда. За счет повышения конечного диастолического давления в левом желудочке и увеличения растяжения мышечных волокон желудочков может повышать потребность в кислороде, особенно у больных с хронической сердечной недостаточностью.

Антиаритмический эффект обусловлен устранением аритмогенных факторов (тахикардии, повышенной активности симпатической нервной системы, увеличенного содержания цАМФ, артериальной гипертензии), уменьшением скорости спонтанного возбуждения синусового и эктопических водителей ритма и замедлением атриовентрикулярного проведения. Угнетение проведения импульсов отмечается преимущественно в антеградном и в меньшей степени в ретроградном направлениях через атриовентрикулярный узел и по дополнительным путям. По классификации антиаритмических лекарственных средств относится к препаратам группы II. Уменьшение выраженности ишемии миокарда – за счет снижения потребности миокарда в кислороде, постинфарктная летальность может также уменьшаться благодаря антиаритмическому действию.

Способность предупреждать развитие головной боли сосудистого генеза обусловлена уменьшением выраженности расширения церебральных артерий вследствие бета-адреноблокады сосудистых рецепторов, ингибированием вызываемых катехоламинами агрегации тромбоцитов и липолиза, снижением адгезивности тромбоцитов, предотвращением активации факторов свертывания крови во время высвобождения

адреналина, стимуляцией поступления кислорода в ткани и уменьшением секреции ренина.

Уменьшение тремора на фоне применения пропранолола может быть обусловлено блокадой бета2-адренорецепторов. Повышает атерогенные свойства крови. Усиливает сокращения матки (спонтанные и вызванные лекарственными средствами, стимулирующими миометрий). Повышает тонус бронхов.

Фармакокинетика. Быстро и достаточно полно (90%) всасывается при приеме внутрь и относительно быстро выводится из организма. Биодоступность после перорального приема составляет 30-40% (эффект «первого прохождения» через печень, микросомальное окисление), при длительном приеме – увеличивается (образуются метаболиты, ингибирующие ферменты печени), ее величина зависит от характера пищи и интенсивности печеночного кровотока. Метаболизируется путем глюкуронирования в печени. Максимальная концентрация в плазме крови достигается через 1 – 1,5 ч. Обладает высокой липофильностью, накапливается в ткани легких, головном мозге, почках, сердце. Проникает через гематоэнцефалический и плацентарный барьеры, в грудное молоко. Связь с белками плазмы крови – 90-95%. Объем распределения –3 –5 л/кг.

Попадает с желчью в кишечник, деглюкуронизируется и реабсорбируется. Период полувыведения – 3-5 часа, на фоне курсового введения может удлиняться до 12 часов. Выводится почками – 90%, в неизмененном виде – менее 1%. Не удаляется при гемодиализе.

Показания к применению

Артериальная гипертензия, стенокардия напряжения, нестабильная стенокардия, синусовая тахикардия (в т.ч. при гипертиреозе), наджелудочковая тахикардия, мерцательная тахиаритмия, наджелудочковая и желудочковая экстрасистолия, профилактика инфаркта миокарда (систолическое АД – более 100 мм рт.ст.), эссенциальный тремор, мигрень (профилактика приступов), в качестве вспомогательного средства в терапии тиреотоксикоза и тиреотоксического криза (при непереносимости тиреостатических лекарственных средств), симпато-адреналовые кризы на фоне диэнцефального синдрома.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к препарату, атриовентрикулярная блокада II и III степени, синоаурикулярная блокада, синусовая брадикардия, артериальная гипотензия (систолическое артериальное давление ниже 90 мм рт. ст.), неконтролируемая

хроническая сердечная недостаточность IIБ-III степени, острая сердечная недостаточность, острый инфаркт миокарда (систолическое артериальное давление – менее 100 мм рт.ст.), кардиогеный шок, отек легких, синдром слабости синусового узла, стенокардия Принцметала, кардиомегалия (без признаков сердечной недостаточности), вазомоторный ринит, окклюзионные заболевания периферичеких сосудов (осложненные гангреной, «перемежающейся хромотой» или болью в покое), сахарный диабет, 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 использования альфа-адреноблокаторов), спастический колит, одновременный прием с антипсихотическими средствами и анксиолитиками (хлорпромазин, триоксазин и др.), ингибиторами МАО, период лактации.

С осторожностью – печеночная и/или почечная недостаточность, гипертиреоз, миастения, сердечная недостаточность, феохромоцитома, псориаз, беременность, аллергические реакции в анамнезе, синдром Рейно, пожилой возраст, возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).

Способ применения и дозы

Внутрь, до еды, не разжевывая и запивая небольшим количеством жидкости.

При артериальной гипертензии – внутрь, по 40 мг 2 раза в сутки. При недостаточной выраженности гипотензивного эффекта дозу увеличивают до 40 мг 3 раза или по 80 мг 2 раза в сутки. Максимальная суточная доза – 320 мг.

При стенокардии, нарушениях сердечного ритма – в начальной дозе 20 мг 3 раза в сутки, затем дозу увеличивают до 80-120 мг за 2-3 приема. Максимальная суточная доза – 240 мг.

Для профилактики мигрени, а также при эссенциальном треморе – в начальной дозе 40 мг 3 раза в сутки.

При нарушении функции печени и почек необходимо снижение дозы препарата.

При нарушенной функции почек необходимо снизить первоначальную дозу или увеличить интервал между приемами препарата.

Профилактика повторного инфаркта миокарда - терапию начинать между 5-ым и 21-ым днем после перенесенного инфаркта миокарда в дозе 40 мг 3 раза в сутки, в течение 2-3 дней. Затем в дозе 80 мг 2 раза в сутки. При необходимости можно назначать 180-240 мг в сутки в разделенных дозах.

При гипертиреозе (вспомогательное средство) – 40 мг 3-4 раза в сутки, при необходимости возможно повышение дозы до 120-160 мг в сутки.

Побочное действие

Со стороны сердечно-сосудистой системы: синусовая брадикардия, атриовентрикулярная блокада, сердечная недостаточность, сердцебиение, нарушение проводимости миокарда, аритмии, снижение артериального давления, ортостатическая гипотензия, боль в груди, спазм периферических артерий, похолодание конечностей.

Со стороны пищеварительного тракта: сухость во рту, тошнота, рвота, диарея, запор, боли в эпигастральной области, нарушение функции печени, изменение вкуса.

Со стороны нервной системы: редко – головная боль, бессонница, «кошмарные» сновидения, астенический синдром, снижение способности к быстрым психическим и двигательным реакциям, возбуждение, депрессия, парестезии, повышенная утомляемость, слабость, головокружение, сонливость, спутанность сознания или кратковременная потеря памяти, галлюцинации, тремор.

Со стороны дыхательной системы: ринит, заложенность носа, одышка, бронхоспазм, ларингоспазм.

Со стороны обмена веществ: гипогликемия (у больных сахарным диабетом I типа), гипергликемия (у больных сахарным диабетом II типа).

Со стороны органов чувств: сухость слизистой глаз (уменьшение секреции слезной жидкости), нарушение остроты зрения, кератоконъюнктивит.

Со стороны репродуктивной системы: снижение либидо, снижение потенции.

Со стороны кожных покровов: алопеция, обострение течения псориаза, усиление потоотделения, гиперемия кожи, экзантема, псориазоподобные кожные реакции.

Со стороны эндокринной системы: снижение функции щитовидной железы.

Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд.

Лабораторные показатели: агранулоцитоз, повышение активности «печеночных» трансаминаз и уровня билирубина.

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

Прочие: мышечная слабость, боль в спине или суставах, боль в грудной клетке, лейкопения, тромбоцитопения и синдром «отмены».

Передозировка

Симптомы: брадикардия, головокружение или обморок, снижение артериального давления, аритмии, затрудненное дыхание, цианоз ногтей пальцев или ладоней, судороги.

Лечение: промывание желудка, назначение активированного угля, при нарушении атриовентрикулярной проводимости – внутривенно вводят 1-2 мг атропина, эпинефрина, при низкой эффективности осуществляют постановку временного кардиостимулятора; при желудочковой экстрасистолии – лидокаин (препараты IA класса не применяются); при артериальной гипотензии больной должен находиться в положении Тренделенбурга. Если нет признаков отека легких, внутривенно вводят плазмозамещающие растворы, при неэффективности – эпинефрин, допамин, добутамин; при судорогах – внутривенно диазепам; при бронхоспазме ингаляционно или парентерально – бета-адреностимуляторы.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Гипотензивный эффект пропранолола усиливается при сочетании с диуретиками, резерпином, гидралазином и другими гипотензивным средствами, а также этанолом.

Гипотензивный эффект ослабляют нестероидные противовоспалительные препараты (задержка натрия и блокирование синтеза простагландина почками), эстрогены (задержка натрия) и ингибиторы МАО.

Циметидин увеличивает биодоступность.

Повышает концентрацию лидокаина в плазме крови, снижает клиренс теофиллина.

Одновременное назначение с производными фенотиазина повышает концентрации обоих препаратов в плазме крови.

Усиливает действие тиреостатических и утеротонизирующих препаратов; снижает действие антигистаминных средств.

Повышает вероятность развития тяжелых системных реакций (анафилаксии) на фоне введения аллергенов, используемых для иммунотерапии или для кожных проб.

Амиодарон, верапамил и дилтиазем – усиление выраженности отрицательного хроно-, ино- и дромотропного действия пропранолола.

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

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

Изменяет эффективность инсулина и пероральных гипогликемических лекарственных средств, маскирует симптомы развивающейся гипогликемии (тахикардию, повышение артериального давления).

Снижает клиренс ксантинов (кроме дифиллина).

Гипотензивный эффект ослабляют глюкокортикостероиды.

Сердечные гликозиды, метилдопа, резерпин и гуанфацин, антиаритмические лекарственные средства повышают риск развития или усугубления брадикардии, атриовентрикулярной блокады, остановки сердца и сердечной недостаточности.

Нифедипин может приводить к значительному снижению артериального давления.

Удлиняет действие недеполяризующих миорелаксантов и антикоагулянтный эффект кумаринов.

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

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

Негидрированные алкалоиды спорыньи повышают риск развития нарушений периферического кровообращения.

Усиливает действие тиреостатических и утеротонизирующих лекарственных средств; снижает действие антигистаминных лекарственных средств.

Сульфасалазин увеличивает концентрацию пропранолола в плазме крови (тормозит метаболизм), рифампицин укорачивает период полувыведения.

Особые указания

Контроль за больными, принимающими Обзидан, должен включать наблюдение за частотой сердечных сокращений и артериальным давлением (в начале лечения – ежедневно, затем 1 раз в 3-4 месяца), ЭКГ.

У пожилых пациентов рекомендуется следить за функцией почек (1 раз в 4-5 месяцев).

В случае появления у больных пожилого возраста нарастающей брадикардии (менее 50 ударов в минуту), артериальной гипотензии (систолическое артериальное давление менее 100 мм рт.ст.), атриовентрикулярной блокады, бронхоспазма, желудочковых аритмий, тяжелых нарушений функции печени и/или почек, необходимо уменьшить дозу препарата или прекратить лечение.

Следует обучить больного методике подсчета частоты сердечных сокращений и проинструктировать о необходимости врачебной консультации при частоте сердечных сокращений менее 50 ударов в минуту.

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

Больные, пользующиеся контактными линзами, должны учитывать, что на фоне лечения возможно уменьшение продукции слезной жидкости.

Перед назначением Обзидана пациентам с сердечной недостаточностью (ранние стадии) необходимо применять дигиталис и/или мочегонные средства.

Лечение ишемической болезни сердца и стойкой артериальной гипертензии должно быть длительным – прием Обзидана 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 в течение 2 недель и более (снижают дозу на 25% каждые 3-4 дня).

У больных сахарным диабетом применение препарата проводят под контролем содержания глюкозы крови (1 раз в 4-5 месяцев).

При тиреотоксикозе Обзидан может маскировать определенные клинические признаки гипертиреоза (например, тахикардию). Резкая отмена у больных тиреотоксикозом противопоказана, поскольку способна усилить симптоматику. При назначении бета-адреноблокаторов больным, получающим гипогликемические препараты, следует соблюдать осторожность, поскольку во время продолжительных перерывов в приеме пищи может развиться гипогликемия. Причем такие её симптомы, как тахикардия или тремор будут маскироваться за счет действия препарата. Больных следует проинструктировать в отношении того, что основным симптомом гипогликемии во время лечения бета-адреноблокаторами является повышенное потоотделение.

С осторожностью назначать совместно с гипогликемическими средствами (опасность возникновения гипогликемии на фоне терапии инсулином и гипергликемии – на фоне приема пероральных гипогликемических средств).

При одновременном приеме клонидина его прием может быть прекращен только через несколько дней после отмены Обзидана.

При феохромоцитоме назначают только в сочетании с альфа-адреноблокаторами.

Прием во время беременности возможен только в том случае, если польза для матери превышает риск развития побочных эффектов у плода и ребенка. При необходимости приема во время беременности требуется тщательное наблюдение за состоянием плода, за 48-74 часов до родов препарат следует отменить.

Нельзя одновременно применять с антипсихотическими препаратами (нейролептиками) и транквилизаторами.

Препараты, снижающие запасы катехоламинов (например, резерпин) могут усилить действие бета-адреноблокаторов, поэтому больные, принимающие сочетания препаратов, должны находиться под постоянным наблюдением врача на предмет выявления артериальной гипотензии и брадикардии.

На фоне лечения Обзиданом следует избегать внутривенного введения верапамила, дилтиазема.

Осторожно 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).

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

У «курильщиков» эффективность бета-адреноблокаторов ниже.

Во время лечения не рекомендуется принимать этанол (возможно резкое снижение артериального давления).

Следует отменять препарат перед исследованием содержания в крови и моче катехоламинов, норметанефрина и виниламидальной кислоты; титров антинуклеарных антител.

Во время лечения избегать использования натуральной лакрицы; пища, богатая белком, способна увеличить биодоступность.

Форма выпуска

Таблетки 40 мг. По 20 таблеток в блистеры из непрозрачной поливинилхлоридной или полипропиленовой пленки и лакированной алюминиевой фольги. 3 блистера вместе с инструкцией по применению в картонную пачку.

Условия хранения

В защищенном от света месте при температуре 15 - 25°С.

Хранить в недоступном для детей месте!

Срок годности

5 лет.

Не применять после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Производитель

АО «Актавис Групп», Исландия, произведено Шварц Фарма АГ, 40789 Монхайм, Германия

Претензии потребителей направлять по адресу:

ООО «Актавис»,

127018, г. Москва, ул. Сущевский вал, д. 18,

Тел. 644-44-14, Факс: 644-44-24

Медицинский директор
ООО «Актавис» Вильчинская М. Ю.