

Небилонг АМ

Латинское название: Nebilong AM

Действующее вещество: амлодипин + небиволол

Код АТХ: C07FB

Производитель: Микро Лабс Лимитед (Индия)

Условие отпуска из аптеки: по рецепту

Условия хранения: вдали от света и детей

Срок годности: 3 года

Введение в тему

«Небилонг АМ» – комбинированный препарат, который применяется для лечения гипертензивной болезни. Лекарство принимается один раз в день независимо от приема пищи. Наиболее распространенные возможные нежелательные эффекты включают снижение частоты сердечных сокращений, снижение артериального давления, головокружение, затрудненное дыхание, головную боль, усталость и расстройство желудка. «Небилонг АМ» метаболизируется через CYP2D6.

Состав и форма выпуска

Действующие вещества:

- Амлодипин
- Небиволол.

Вспомогательные вещества:

- Электролиты
- Полисахариды.

«Небилонг АМ» выпускается в виде таблеток по 0,005 г активных веществ для перорального употребления.

Фармакологические свойства

Амлодипин – липофильный блокатор кальциевых каналов третьего поколения длительного действия, который оказывает действие посредством ингибирования притока кальция в клетки гладких мышц сосудов и миокарда, что приводит к снижению периферического сосудистого сопротивления. Амлодипин показан для лечения высокого кровяного давления и стенокардии. Ряд рандомизированных исследований подтвердил его полезность при стенокардии.

Амлодипин обычно вводится один раз в день из-за его длительного периода полувыведения, что благоприятно для соблюдения пациентом режима лечения. Начальная доза 5 мг обычно рекомендуется с максимальной суточной дозой 10 мг. Для пожилых людей и лиц с печеночной недостаточностью рекомендуется начальная доза 2,5 мг.

Амлодипин имеет постепенное начало действия и, следовательно, не имеет значительной рефлекторной нейроэндокринной активации. Активация рефлекторных механизмов, таких как увеличение PVR и повышение частоты сердечных сокращений, может оказывать негативное влияние на метаболизм липидов и углеводов. Заметные побочные эффекты обычно наблюдаются у других агентов, включая β-адреноблокаторы первого поколения. Амлодипин обладает высокой биодоступностью, составляющей от 60% до 80%; он подвергается метаболизму в печени и

демонстрирует некоторое нарушение выведения при циррозе печени, но не накапливается при почечной недостаточности.

Амлодипин также имеет медленную скорость выведения в течение 40–60 часов. Если прекратить прием амлодипина, АД обычно возвращается к исходному уровню через 1 неделю без каких-либо опасных повышений АД (в отличие от клонидина).

β -блокаторы представляют собой гетерогенный класс соединений, которые превратились из неселективных агентов первого поколения (например, пропранолола) в кардиоселективные β 1-блокаторы второго поколения (например, атенолол, бисопролол, метопролол), а затем в соединения третьего поколения, которые объединяют β -блокада с сосудорасширяющими свойствами (например, карведилол, лабеталол, небиволол).

Небиволол обладает высокой β 1-селективностью в дозах ≤ 10 мг в сутки, причем сродство к β 1 по сравнению с β 2 рецепторами в клетках миокарда человека примерно в 320 раз выше. В то время как сосудорасширяющие свойства карведилола и лабеталола опосредуются блокадой α -адренергических рецепторов, небиволол проявляет эти эффекты, увеличивая количество эндотелиального NO посредством стимулирующего воздействия на эндотелиальную синтазу оксида азота (NOS), опосредованную через β 3-агонизм.

Четкий фармакологический профиль небиволола связан с рядом гемодинамически значимых эффектов:

- β 1-блокада, которая уменьшает частоту сердечных сокращений в состоянии покоя и физических нагрузок, сократимость миокарда, а также систолическое и диастолическое артериальное давление
- NO-опосредованная вазодилатация, которая приводит к снижению периферического сосудистого сопротивления, увеличению ударного объема и фракции выброса и поддержанию сердечного выброса
- Вазодилатация и снижение окислительного стресса, которые, как считается, способствуют нейтральному и, возможно, благоприятному воздействию небиволола на метаболизм глюкозы и липидов
- Уменьшенный объем и агрегация тромбоцитов.

Положительные эффекты указывают на потенциально широкую пользу небиволола в лечении гипертонии и хронической сердечной недостаточности.

Абсолютная биодоступность небиволола неизвестна. Препарат на 98% связан с белками, главным образом с альбумином. Препарат достигает максимальной концентрации через 1,5–4 часа. Небиволол метаболизируется в печени, главным образом, путем прямого глюкуронидации и вторично через цитохром P450 2D6 (CYP450 2D6).

Активные метаболиты, гидроксил и глюкурониды, вносят вклад в β -блокирующий эффект небиволола. Как и в случае с другими лекарственными средствами, метаболизируемыми с помощью CYP450 2D6, генетические различия могут влиять на метаболизм, период полувыведения, экскрецию, а также клинические и неблагоприятные эффекты небиволола.

Следует, однако, отметить, что данные свидетельствуют о том, что в CYP450 2D6 с плохими метаболиторами не требуется коррекции дозы, поскольку клинический эффект и профили безопасности сходны с таковыми у обширных метаболиторов.

Период полувыведения небиволола, как правило, составляет 12 ч, но у тех, кто плохо метаболизируется, увеличивается до 19 ч. Экскреция небиволола составляет 35% через мочу и

44% через кал в средних метаболиторах; пациенты с плохим метаболизмом выделяют 67% препарата с мочой и 13% с калом.

Показания к применению

Комбинированная медикаментозная терапия рекомендуется для лечения гипертонии, чтобы позволить лекарствам с различным механизмом действия дополнять друг друга и вместе эффективно снижать артериальное давление при дозах ниже максимальных для каждого.

Седьмой Объединенный национальный комитет по профилактике, выявлению, оценке и лечению высокого кровяного давления предлагает комбинированные препараты, которые являются преимуществом для клиницистов, разрабатывающих сложные схемы лечения, необходимые для улучшения результатов у пожилых людей с хроническими заболеваниями.

Комбинированные препараты предлагают дополнительные преимущества меньшего количества таблеток для пожилых людей, которые могут испытывать трудности с глотанием. Более широкое использование комбинированной терапии с фиксированными дозами может помочь пациентам не забывать принимать таблетки и быстрее и с меньшими проблемами доставлять их к цели. Это должно улучшить показатели контроля артериального давления и в конечном итоге ускорить выздоровление.

Инструкция по применению

Согласно инструкции по применению, рекомендуется применять препарат 1 раз в сутки с небольшим количеством жидкости. Дозировка устанавливается лечащим врачом. Самолечением заниматься категорически запрещено.

Противопоказания, побочные эффекты, передозировка, лекарственное взаимодействие

Абсолютные противопоказания к применению:

- Гиперчувствительность к лекарственному препарату
- Нефропатия или гепатопатия
- Декомпенсированные сердечно-сосудистые заболевания
- Брадиаритмии
- Нестабильная кардиогенная недостаточность.

Наиболее частым побочным эффектом, препятствующим соблюдению амлодипина, является периферический отек. Однако этот неблагоприятный эффект можно минимизировать, если препарат вводится перед сном, и используются более низкие дозы (2,5 или 5 мг/день).

Действительно, введение желудочно-кишечной терапевтической системы нифедипина перед сном сопровождалось снижением отека на 93% по сравнению с утренней дозировкой (1% против 13%, $p < 0,001$ соответственно).

Другие побочные эффекты включают головокружение, усталость, головную боль, учащенное сердцебиение и тошноту, хотя они, как правило, не достаточно надоедливые, чтобы вызвать отмены препарата. Амлодипин противопоказан кормящим женщинам, пациентам с кардиогенным шоком и нестабильной стенокардии. Кроме того, его сосудорасширяющее действие может привести к снижению сердечного выброса при стенозе аорты.