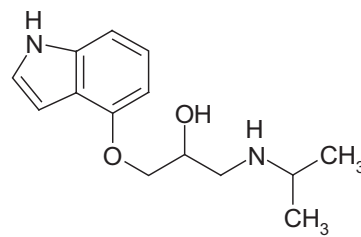


Končí dostupnost pindololu

PharmDr. Kamil Hrubý Ph.D.

Pindolol (APO-Pindol®) přestal být v České republice dostupný z důvodu rozhodnutí výrobce o ukončení dovozu (1). Přípravek se v současnosti doprodává. Originální přípravek Visken® není u nás dostupný už dlouhou dobu. Molekula pindololu (obrázek 1) byla patentována v roce 1969 společností Sandoz (2).

Obrázek 1. Molekula pindololu



Pindolol je beta-blokátor. Je to neselektivní beta-blokátor s významnou vnitřní sympatomimetickou aktivitou (ISA) a s membrány stabilizující aktivitou (3). Pindolol je indikován pro léčbu mírné až středně těžké hypertenze a pro profylaxi anginy pectoris (4). V některých státech je také používán jako antiglaukomatikum ve formě očních kapek (5). Mimo schválené indikace byl také užíván u antipsychotiky indukované akatie (3).

Pindolol je po perorálním podání téměř kompletně absorbován z gastrointestinálního traktu. Maximální plazmatické koncentrace je dosaženo asi 1–2 h po podání, biologický poločas je asi 3–4 h, u starších hypertoniků ale až 7–15 h. Vazebnost na plazmatické proteiny je asi 40–60%. Patří mezi středně liposolubilní beta-blokátory. Je částečně metabolizován (z asi 60%) v játrech a jak metabolity, tak parentní látka jsou vylučovány ledvinami. Pindolol přechází do mateřského mléka. Z hlediska užívání v těhotenství je řazen do kategorie B dle FDA (3, 5).

Při léčbě hypertenze se pindolol začíná užívat v dávce 5 mg ráno a večer. Maximální dávka je 45 mg, přičemž od denní dávky 30 mg se látka užívá 3krát denně. U anginy pectoris se pindolol užívá 3krát denně, začíná se dávkou 5 mg 3krát denně.

Nežádoucí účinky pindololu jsou obdobné jako u ostatních beta-blokátorů. Taktéž kontraindikace jsou společné s ostatními beta-blokátory:

- sinusová bradykardie
- A-V blok 2. a 3. stupně
- selhání pravé komory sekundární k plicní hypertenzi
- městnavé srdeční selhání
- kardiogenní šok

- celková anestézie, s použitím látek vedoucích k depresi myokardu
 - bronchospasmus, včetně astmatu a těžké CHOPN
 - přecitlivělost na složky přípravku (4)
- Z hlediska farmakologické charakteristiky je pindololu podobný bopindolol a méně i carteolol (u nás neregistrovaný) (3, 5). U beta-blokátorů je hodně diskutováno nepříznivé ovlivnění lipidového spektra. Je prokázáno, že toto ovlivnění (zvýšení celkového cholesterolu, snížení HDL-fractione) je nižší u beta-blokátorů s ISA. Podání pindololu u hypertoniků není s těmito nepříznivými efekty spojeno (6, 7). Beta-blokátory s ISA také méně ovlivňují tepovou frekvenci. Farmakologicky je dále zajímavé, že pindolol působí na serotoninové presynaptické autoreceptory 5-HT_{1A}, což akceleruje účinek SSRI (8), přičemž pindolol prokázal svůj klinický efekt při tzv. augmentaci léčby u deprese (např. 9, 10, 11, další bohatá literatura). Pindolol

se také ukázal jako účinný v augmentaci léčby agresivních schizofreniků, kdy jeho přidání ke standardní léčbě signifikantně snížilo počet epizod agresivity (12), a dále při augmentaci léčby panické poruchy (13).

Pindolol je v zahraničí stále dostupný (14, 15, 16). I když v léčbě kardiovaskulárních onemocnění je zastupitelný řadou dalších beta-blokátorů s farmakologicky výhodnějším profilem, zajímavé jsou jistě výsledky, kterých s ním bylo dosaženo při léčbě některých psychiatrických onemocnění, byť nejde o schválené indikace tohoto léčiva. Pro potenciální léčbu těchto pacientů pindolol tedy u nás nebude dostupný.

PharmDr. Kamil Hrubý, Ph.D.

Nemocniční lékárna při VNBMA

Zalužanského 15, 703 00 Ostrava-Vítkovice

e-mail: kamil.hruby@ipcnet.cz

Literatura

1. Informační dopis společnosti Apotex.
2. Pindolol. In: The Merck Index 1996. Merck & Co., Inc. 1996: 1280.
3. Beta-adrenergic blocking agents. In: Drug Facts and Comparisons. Facts and Comparisons 2001: 477.
4. Pindolol, souhrn SPC. Mikro-verze AISLP – ČR 2005: 2.
5. Pindolol. In: Martindale, The complete drug reference. Pharmaceutical Press 1999: 931.
6. Hunter Hypertension Research Group. Effects of pindolol, or a pindolol/clopidamide combination preparation, on plasma lipid levels in essential hypertension. Med J Aust 1989; 150: 646–652.
7. Terént A, et al. Long-term effects of pindolol on lipids and lipoproteins in men with newly diagnosed hypertension. Eur J Clin Pharmacol 1989; 36: 347–350.
8. Rabiner ER, et al. Preferential 5-HT_{1A} autoreceptor occupancy by pindolol is attenuated in depressed patients: effect of treatment or an endophenotype of depression? Neuropsychopharmacology 2004; 29: 1688–1698.
9. Thase ME. Therapeutic alternatives for difficult-to-treat depression: a narrative review of the state of the evidence. CNS Spectr 2004; 9: 818–821.
10. Ballesteros J, Callado LF. Effectiveness of pindolol plus serotonin uptake inhibitors in depression: a meta-analysis of early and late outcomes from randomised controlled trials. J Affect Disord 2004; 79: 137–147.
11. Isaac MT, et al. Milnacipran and pindolol: a randomized trial of reduction of antidepressant latency. Hum Psychopharmacol 2003; 18: 595–601.
12. Caspi N, et al. Pindolol augmentation in aggressive schizophrenic patients: a double-blind crossover randomized study. Int Clin Psychopharmacol 2001; 16: 111–115.
13. Hirschmann S, et al. Pindolol augmentation in patients with treatment-resistant panic disorder: A double-blind, placebo-controlled trial. J Clin Psychopharmacol 2000; 20: 556–559.
14. Electronic Orange Book. www.fda.gov.
15. www.rote-liste.de/Online.
16. www.bnf.org.