



ИНСТРУКЦИЯ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ БИСОПРОЛ®

Торговое название препарата: Бисопрол®

Действующее вещество (МНН): бисопролол

Лекарственная форма: таблетки

Состав:

1 таблетка содержит:

активное вещество: бисопролола фумарат в пересчёте на 100 % вещество 5 мг или 10 мг.

вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая, кальция гидрофосфат, кросповидон, кремния диоксид коллоидный безводный, жёлтый закат FCF (Е 110), магния стеарат.

Описание:

Для дозировки 5 мг: таблетки круглой формы с двояковыпуклой поверхностью, бледно-розового цвета, с риской или без риски. На поверхности таблеток допускаются вкрапления;

для дозировки 10 мг: таблетки круглой формы с плоской поверхностью, с фаской и риской, бледно-розового цвета. На поверхности таблеток допускаются вкрапления.

Фармакотерапевтическая группа: антигипертензивное средство (бета - адреноблокатор)
Код АТХ: C07A B07.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Бисопролол – высокоселективный β_1 -адреноблокатор, не обладает внутренней симпатомиметической и мембраностабилизирующей активностью.

Он обладает только небольшим сродством к бета₂-рецепторам в гладких мышцах бронхов, сосудов и к бета₂-рецепторам метаболической регуляции. Поэтому не ожидается, что бисопролол повлияет на сопротивление дыхательных путей и бета₂-опосредованные метаболические эффекты. Бета₁-селективность бисопролола поддерживается при дозах, превышающих терапевтический диапазон.

Как и у других бета₁-адреноблокаторов, механизм действия бисопролола при артериальной гипертензии неясен. Однако известно, что бисопролол значительно снижает активность ренина плазмы.

У пациентов со стабильной систолической сердечной недостаточностью III и IV класса NYHA при приеме бисопролола снизилась общая смертность, частота случаев внезапной смерти, число эпизодов сердечной недостаточности, требующих госпитализации, а также отмечалось значительное улучшение функционального состояния согласно классификации NYHA.

При однократном применении у пациентов с ишемической болезнью сердца без хронической сердечной недостаточности бисопролол снижает частоту сердечных сокращений и ударный объем и, таким образом, сердечный выброс и потребление

кислорода. При длительном применении изначально повышенное периферическое сопротивление снижается.

Максимальный эффект бисопролола достигается через 3-4 часа после перорального приема. Период полувыведения (10-12 часов) обеспечивает 24-часовую эффективность при приеме препарата один раз в день. В общем случае, максимальный антигипертензивный эффект бисопролола достигается после 2-недельного лечения.

Фармакокинетика

Абсорбция

Биодоступность составляет около 90 % после перорального применения и не зависит от приема пищи.

Распределение

Объем распределения составляет 3,5 л/кг. Связывание с белками плазмы крови составляет около 30%.

Метаболизм и выведение

Бисопролол выводится из организма двумя путями: 50 % биотрансформируется в печени с образованием неактивных метаболитов и выводится почками, 50 % выводится почками в неизменном виде. Общий клиренс бисопролола составляет 15 л/час. Благодаря длительному периоду полувыведения (10-12 часов) препарат сохраняет терапевтический эффект в течение 24 часов при применении один раз в сутки.

Линейность

Фармакокинетика бисопролола линейная, ее показатели не зависят от возраста.

Особые группы пациентов

Поскольку бисопролол выводится из организма почками и печенью в равной мере, у пациентов с нарушением функции печени или с нарушениями функции почек коррекция режима дозирования не нужна.

Фармакокинетика у пациентов со стабильной хронической сердечной недостаточностью и с нарушением функций печени или почек не изучалась. У пациентов с хронической сердечной недостаточностью III функционального класса (по NYHA) уровень бисопролола в плазме крови выше и период полувыведения, пролонгированный в сравнении со здоровыми добровольцами.

Максимальная концентрация в плазме крови при равновесном состоянии составляет 64 ± 21 нг/мл при суточной дозе 10 мг и периоде полувыведения 17 ± 5 часов.

Показания к применению

- Артериальная гипертензия;
- ишемическая болезнь сердца (стенокардия);

Способ применения и дозы

Таблетки бисопролола следует принимать с небольшим количеством жидкости, не разжевывая, утром натощак.

Дозировка

Лечение должно быть начато в основном постепенно, с малых доз, которые затем увеличиваются. Доза для однократного приёма – 2,5-5 мг. В случае необходимости, возможно увеличение дозы до 10 мг (один раз в сутки). Для больных с нарушением функции почек или печени допустимые дозы приёма препарата остаются такими же.

Лечение артериальной гипертензии

Рекомендуемая доза бисопролола составляет 5 мг один раз в день.

При легких формах гипертонии (диастолическое артериальное давление до 105 мм рт.ст.), терапия дозой 2,5 мг один раз в день может быть достаточной.

При необходимости дозировку можно увеличить до 10 мг один раз в день.

Дальнейшее увеличение дозы должно обосновываться и проводиться в исключительных случаях. Максимальная рекомендуемая доза бисопролола составляет 20 мг один раз в день.

Ишемическая болезнь сердца (стенокардия)

Рекомендуемая доза бисопролола составляет 5 мг один раз в день.

При необходимости дозировку можно увеличить до 10 мг один раз в день.

Дальнейшее увеличение дозы должно обосновываться и проводиться в исключительных случаях. Максимальная рекомендуемая доза бисопролола составляет 20 мг один раз в день.

Дозировка при печеночной и/или почечной недостаточности

Пациентам с нарушениями функции печени или почек легкой или средней тяжести коррекции режима дозирования, как правило, не требуется. Для больных с тяжелыми нарушениями функции почек (клиренс креатинина < 20 мл/мин) и пациентов с тяжелыми нарушениями функции печени максимальная суточная доза составляет 10 мг.

Существует только ограниченный опыт использования бисопролола у диализных пациентов, который не указывает на необходимость коррекции режима дозирования.

Пожилые люди

Коррекция дозировки не требуется.

Продолжительность лечения

Продолжительность лечения не ограничена и зависит от течения и тяжести заболевания.

Нельзя резко прекращать лечение бисопрололом, особенно у пациентов с ишемической болезнью сердца, поскольку это может привести к острому ухудшению состояния здоровья пациента. Если приостановка лечения необходима, доза должна снижаться постепенно (например, вдвое уменьшая дозу один раз в неделю).

Побочные действия

Со стороны сердечно – сосудистой системы: брадикардия, ухудшение сердечной недостаточности, ощущение холода или онемение конечностей, артериальная гипотензия, нарушения атриовентрикулярной проводимости, ортостатическая гипотензия.

Со стороны нервной системы: головокружение, головная боль, потеря сознания.

Со стороны органов зрения: снижение слезовыделения (нужно учитывать при ношении контактных линз), конъюнктивит.

Со стороны органов слуха: ухудшение слуха.

Со стороны дыхательной системы: бронхоспазм у пациентов с бронхиальной астмой в анамнезе и хроническими обструктивными заболеваниями дыхательных путей в анамнезе; аллергический ринит.

Со стороны пищеварительного тракта: тошнота, рвота, диарея, запор.

Со стороны кожи и соединительных тканей: реакции гиперчувствительности (зуд, покраснение, высыпания), алопеция. При лечении β -блокаторами может наблюдаться ухудшение состояния больных псориазом в виде псориазического высыпания.

Со стороны костно-мышечной системы: мышечная слабость, судороги.

Со стороны печени: гепатит.

Со стороны репродуктивной системы: нарушение потенции.

Психические расстройства: депрессия, нарушения сна, ночные кошмары, галлюцинации.

Лабораторные показатели: повышение уровня триглицеридов в крови, повышение активности печеночных ферментов в плазме крови (АСТ, АЛТ).

Общие расстройства: астения, утомляемость.

В случае возникновения побочных явлений или нежелательных реакций необходимо немедленно проинформировать врача.

Противопоказания

- Острая сердечная недостаточность или сердечная недостаточность в состоянии декомпенсации, требующая внутривенной инотропной терапии;
- кардиогенный шок;
- атриовентрикулярная блокада II и III степени;
- синдром слабости синусового узла;
- синоатриальная блокада;
- симптоматическая брадикардия;
- симптоматическая артериальная гипотензия;
- тяжелая форма бронхиальной астмы или тяжелое течение хронического обструктивного заболевания легких;
- тяжелая форма облитерирующих заболеваний периферических артерий или болезни Рейно;
- нелеченная феохромоцитома;
- метаболический ацидоз;
- повышенная чувствительность к бисопрололу или другим компонентам препарата.

С осторожностью

- гипертония или стенокардия с сопутствующей сердечной недостаточностью
- сахарный диабет со значительными колебаниями уровня глюкозы в крови, симптомов гипогликемии (например, тахикардия, учащенное сердцебиение или потливость), которые могут быть замаскированы
- строгая диета
- продолжающаяся десенсибилизирующая терапия
- первая степень AV -блокады
- стенокардия Принцметала
- периферическая артериальная обтурирующая болезнь (могут увеличиваться жалобы, особенно в начале терапии)
- пациентам, у которых в анамнезе есть псориаз, бета-блокаторы (например, бисопролол) должны назначаться только после тщательной оценки пользы/риска.

Лекарственные взаимодействия

Одновременный прием других препаратов может повлиять на эффект и переносимость препарата. Подобные взаимодействия также могут происходить, если с момента принятия другого препарата прошло слишком мало времени. Проинформируйте Вашего лечащего врача, если Вы принимаете какие-либо другие препараты.

Не рекомендуется одновременное применение со следующими препаратами:

Антагонисты кальция типа верапамила и в меньшей степени, дилтиазема, при одновременном применении с Бисопрололом могут приводить к снижению сократительной способности сердечной мышцы, и задерживать проведение атриовентрикулярных импульсов. В частности, внутривенное введение верапамила пациентам, получающим терапию бета-блокаторами, может привести к глубокой гипотензии и атриовентрикулярной блокаде.

Гипотензивные препараты центрального действия (такие как клонидин, метилдопа, моксонидин, рилменидин) могут привести к сокращению ЧСС и сердечного выброса, а также к вазодилатации вследствие снижения центрального симпатического тонуса. Резкая отмена, особенно до отмены бета-блокаторов может увеличить риск развития «рикошетной» гипертензии.

С осторожностью применять со следующими препаратами:

Антиаритмические средства класса I (например, хинидин, дизопирамид, лидокаин, фенитоин, флекаинид, пропафенон): влияют на время атриовентрикулярной проводимости, а также может увеличиваться отрицательный инотропный эффект.

Блокаторы кальциевых каналов по типу дигидропиридина (например, нифедипин): совместное применение может увеличить риск гипотензии, а также не исключается нарушение нагнетательной функции желудочков у пациентов с сердечной недостаточностью.

Антиаритмические средства класса III (например, амиодарон): возможно усиление влияния на время атриовентрикулярной проводимости.

Парасимпатомиметики: комбинированная терапия может увеличить время атриовентрикулярной проводимости и повысить риск брадикардии.

Местное применение бета-блокаторов (например, глазные капли для лечения глаукомы) может усилить системный эффект бисопролола.

Сахароснижающее действие инсулина и пероральных противодиабетических средств может усиливаться. Блокада бета-адренорецепторов может скрыть симптомы гипогликемии.

Анестезирующие препараты: ослабление рефлекторной тахикардии и повышение риска гипотензии.

Сердечные гликозиды: снижение частоты сердечных сокращений, повышение времени атриовентрикулярной проводимости.

Нестероидные противовоспалительные препараты (НПВП): могут снижать гипотензивный эффект Бисопролола.

β -симпатомиметики (например, добутамин, орципреналин): сочетание с бисопрололом может снизить эффект обоих агентов. Могут быть необходимы более высокие дозы адреналина для лечения аллергических реакций.

Симпатомиметики, которые активируют α - и β -рецепторы (например, адреналин, норадреналин): возможно увеличение кровяного давления и обострение перемежающейся хромоты. Такие взаимодействия более вероятны при применении неселективных бета-блокаторов.

Трициклические антидепрессанты, барбитураты, фенотиазины, а также другие антигипертензивные средства: усиленный гипотензивный эффект.

При совместном применении следующих препаратов должны быть приняты во внимание следующие замечания:

Мефлохин: повышенный риск брадикардии.

Ингибиторы моноаминоксидазы (кроме ингибиторов MAO-B): повышенный гипотензивный эффект бета-блокаторов, а также риск гипертонического криза.

Особые указания

Аллергические реакции: как и в случае других бета-блокаторов, Бисопролол может увеличивать как чувствительность к аллергенам, так и выраженность анафилактических реакций. В данных случаях адреналин не всегда может обеспечить желаемый терапевтический эффект.

Дыхательная система: при бронхиальной астме или других хронических обструктивных дисфункциях, которые могут сопровождаться симптомами, показана сопутствующая бронхолитическая терапия. В редких случаях у пациентов с астмой может увеличиваться сопротивление дыхательных путей, что требует повышения доз β_2 -симпатомиметиков.

Общая анестезия: у пациентов, которые получили общую анестезию, бета-блокаторы уменьшают риск аритмии и ишемии миокарда во время вводного наркоза, интубации и после операции. В настоящее время рекомендуется продолжать применение бета-блокаторов перидоперационно. Анестезиолог должен быть проинформирован о том, что пациент принимает бета-блокаторы, поскольку возможно взаимодействие с другими лекарственными препаратами, которое может привести к брадиаритмии, ослаблению рефлекторной тахикардии, а также пониженной рефлекторной способности к предотвращению кровопотери. Если необходимо прекращение терапии бета-блокаторами до операции, то оно должно выполняться постепенно и быть полностью завершено примерно за 48 часов до анестезии.

Феохромоцитома: пациентам с феохромоцитомой бисопролол должен вводиться только после блокады альфа-рецепторов.

Тиреотоксикоз: при лечении бисопрололом могут быть не выявлены симптомы тиреотоксикоза.

Применение Бисопролола может привести к положительным результатам допинг-тестов.

Применение в период беременности или кормления грудью.

Беременность

Бисопролол имеет фармакологические свойства, которые могут оказывать вредное воздействие на течение беременности и/или развитие плода/новорожденного. В период беременности бисопролол следует рекомендовать только в том случае, если польза для матери превышает риск развития побочных эффектов у плода.

Как правило, бета-адреноблокаторы снижают кровоток в плаценте и могут повлиять на развитие плода. Следует внимательно отслеживать кровоток в плаценте и матке, а также следить за ростом и развитием будущего ребенка, и в случае опасных проявлений в отношении беременности или плода, принимать альтернативные терапевтические меры. Следует тщательно обследовать новорожденного после родов. В первые три дня жизни могут возникать симптомы снижения уровня глюкозы в крови и ЧСС.

Период кормления грудью

Данных об экскреции бисопролола в грудное молоко или безопасности воздействия бисопролола на грудных детей нет. Поэтому прием препарата бисопролол не рекомендуется женщинам в период кормления грудью.

Особенности влияния лекарственного средства на способность управлять транспортным средством или потенциально опасными механизмами

Бисопролол не влиял на способность управлять автомобилем при исследовании пациентов, страдающих заболеваниями коронарных сосудов сердца. Однако вследствие индивидуальных реакций способность управлять автомобилем или работать с технически сложными механизмами может быть нарушена. На это следует обратить особое внимание в начале лечения, после изменения дозы, а также при одновременном употреблении алкоголя.

Передозировка

Симптомы:

Наиболее распространенными признаками передозировки бета-блокаторов являются брадикардия, артериальная гипотензия, бронхоспазм, острая сердечная недостаточность и гипогликемия.

Лечение:

При передозировке терапия бисопрололом должна приостанавливаться, и должно быть начато подходящее симптоматическое лечение. Ограниченные, но имеющиеся доступные данные позволяют предположить, что бисопролол выводится путем диализа.

Брадикардия: внутривенное введение атропина. При неадекватном ответе, с осторожностью могут применяться орципреналин или другие агенты с положительными хронотропными свойствами. В некоторых случаях может быть необходима трансвенозная имплантация электрокардиостимулятора.

Гипотензия: внутривенная инфузия и введение вазопрессоров. Также эффективным может быть внутривенный глюкагон.

AV-блокада (второй или третьей степени): пациенты должны находиться под тщательным наблюдением, а также им необходимо вливание орципреналина. При необходимости следует имплантировать переходные кардиостимуляторы.

Острое ухудшение сердечной недостаточности: внутривенное введение диуретиков, положительных инотропных средств, а также вазодилаторов.

Бронхоспазм: введение бронходилататоров, например, орципреналин, β_2 -симпатомиметики и/или эуфиллин.

Гипогликемия: внутривенное введение глюкозы.

Форма выпуска

По 10 таблеток в блистере. По 2, 3 или 5 блистеров вместе с инструкцией по медицинскому применению в пачке.

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °C.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не применять препарат после окончания срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Производитель:

ПАО «Фармак». Украина, 04080, г. Киев, ул. Фрунзе, 63

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Украина, 04080, г. Киев, ул. Фрунзе, 74.

Наименование и адрес организации, принимающей претензии (предложения) по качеству лекарственных средств на территории Республики Узбекистан

Представительство ПАО "Фармак" в Узбекистане.

100000, г. Ташкент, ул. А. Кодырий, 39.

Тел./факс : +71 235-77-13, +71 235-67-05