Инструкция по применению
Арител Кор таблетки 2,5 мг 30 шт

Характеристики

Форма выпуска: Таблетки покрытые оболочкой
Страна: Россия
Производитель: КАНОНФАРМА ПРОДАКШН
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Бисопролол
Количество в упаковке: 30
Дозировка действующего вещества: 2.5 мг
Срок годности: 24.0



Действующее вещество

Бисопролол

Состав

Бисопролол (в форме фумарата) 2.5 мгвспомогательные вещества: кремния диоксид коллоидный (аэросил) - 1.5 мг, крахмал картофельный - 18 мг, лактозы моногидрат (сахар мполочный) - 54 мг, повидон - 3 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 20 мг, магния стеарат - 1 мг.состав пленочной оболочки: селекоат aq-02140 - 3 мг (гипромеллоза (гидроксипропилметилцеллюлоза) - 1.8 мг, макрогол (полиэтиленгликоль 400) - 0.33 мг, макрогол (полиэтиленгликоль 6000) - 0.45 мг, титана диоксид - 0.39 мг, краситель солнечный закат желтый - 0.03 мг).

Форма выпуска

Таблетки покрытые оболочкой

Фармакокинетика

ВсасываниеБисопролол почти полностью (более 90%) всасывается из ЖКТ. В незначительной степени подвергается эффекту первого прохождения через печень (приблизительно 10%), вследствие чего биодоступность после приема внутрь составляет приблизительно 90%. Прием пищи не влияет на биодоступность. Cmax в плазме крови достигается через 2-3 ч.РаспределениеБисопролол распределяется довольно широко. Vd составляет 3.5 л/кг. Связывание с белками плазмы крови достигает приблизительно 30%.Бисопролол демонстрирует линейную кинетику, причем его концентрации в плазме крови пропорциональны принятой дозе в диапазоне от 5 до 20 мг.МетаболизмМетаболизируется по окислительному пути без последующей конъюгации. Все метаболиты полярны (водорастворимы) и выводятся почками. Основные метаболиты, обнаруживаемые в плазме крови и моче, не проявляют фармакологической активности. Данные, полученные в результате экспериментов с микросомами печени человека in vitro, показывают, что бисопролол метаболизируется в первую очередь с помощью изофермента CYP3A4 (около 95%), а изофермент CYP2D6 играет лишь незначительную роль.ВыведениеКлиренс бисопролола определяется равновесием между выведением почками в неизмененном виде (около 50%) и метаболизмом в печени (около 50%) до метаболитов, которые также выводятся почками. Общий клиренс составляет 15 л/ч. T1/2 - 10-12 ч. Фармакокинетика в особых клинических случаяхОтсутствует информация о фармакокинетике бисопролола у пациентов с ХСН и одновременным нарушением функции печени или почек.

Показания

- хроническая сердечная недостаточность (ХСН);- артериальная гипертензия;- ИБС: профилактика приступов стабильной стенокардии.

Способ применения и дозы

Препарат принимают внутрь 1 раз/сут, утром, независимо от приема пищи. Таблетки необходимо запивать небольшим количеством жидкости; не следует разжевывать таблетки или растирать в порошок.Хроническая сердечная недостаточность (ХСН) Начало лечения хронической сердечной недостаточности препаратом Арител Кор требует обязательного проведения специальной фазы титрования и регулярного врачебного контроля.Предварительным условием для лечения препаратом Арител Кор является стабильная хроническая сердечная недостаточность без признаков обострения.Лечение ХСН препаратом Арител Кор начинается в соответствии со следующей схемой титрования. Рекомендуемая начальная доза составляет 1.25 мг (1 /2 таб. по 2.5 мг) 1 раз/сут. Необходимо наблюдение за индивидуальной адаптацией

пациента к назначенной дозе. В зависимости от индивидуальной переносимости дозу следует постепенно увеличивать до 2.5 мг, 3.75 мг, 5 мг, 7.5 мг и 10 мг 1 раз/сут. Каждое последующее увеличение дозы следует проводить не менее чем через 2 недели. Если увеличение дозы препарата плохо переносится пациентом, возможно снижение дозы.Максимальная рекомендуемая доза при лечении ХСН составляет 10 мг 1 раз/сут. Если пациент плохо переносит максимальную рекомендуемую дозу препарата, возможно постепенное снижение дозы.Во время титрования рекомендуется регулярный контроль АД, ЧСС и степени выраженности симптомов ХСН. Усугубление симптомов течения ХСН возможно уже с первого дня применения препарата.Во время фазы титрования или после нее может возникнуть временное ухудшение течения ХСН, артериальная гипотензия или брадикардия. В этом случае рекомендуется, прежде всего, провести коррекцию доз препаратов сопутствующей терапии. Также может потребоваться временное снижение дозы препарата Арител Кор или его отмена. После стабилизации состояния пациента следует провести повторное титрование, либо продолжить лечение.Артериальная гипертензия и стабильная стенокардияВо всех случаях режим дозирования врач подбирает каждому пациенту индивидуально, в частности, учитывая ЧСС и состояние пациента.Начальная доза составляет 5 мг 1 раз/сут. При необходимости дозу можно увеличить до 10 мг 1 раз/сут.Максимальная рекомендуемая доза составляет 20 мг 1 раз/сут. Продолжительность лечения при всех показанияхЛечение препаратом Арител Кор обычно проводится длительно.При нарушении функции печени или почек легкой или умеренной степени коррекция дозы обычно не требуется.При выраженных нарушениях функции почек (КК менее 20 мл/мин) и у пациентов с тяжелыми заболеваниями печени максимальная суточная доза составляет 10 мг. Увеличение дозы у таких пациентов следует осуществлять с особой осторожностью.У пациентов пожилого возраста коррекция дозы не требуется.К настоящему времени недостаточно данных относительно применения бисопролола у пациентов с ХСН в сочетании с сахарным диабетом 1 типа, выраженными нарушениями функции почек и/или печени, рестриктивной кардиомиопатией, врожденными пороками сердца или пороком клапана сердца с выраженными гемодинамическими нарушениями.

Противопоказания

- кардиогенный шок;- коллапс;- острая сердечная недостаточность;- хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации, требующая проведения инотропной терапии;- AV-блокада II и III степени (без электрокардиостимулятора);- синоатриальная блокада;- СССУ;- артериальная гипотензия (систолическое АД менее 90 мм рт.ст);- выраженные нарушения периферического кровообращения или синдром Рейно;- бронхиальная астма тяжелой степени;- ХОБЛ тяжелой степени;- феохромоцитома (без одновременного применения альфа-адреноблокаторов);- метаболический ацидоз;- одновременное применение ингибиторов МАО (за исключением ингибиторов МАО типа В);- дефицит лактазы, непереносимость лактозы, синдром мальабсорбции глюкозы-галактозы;- период лактации;- возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены)- повышенная чувствительность к компонентам препарата и другим бета-адреноблокаторам.С осторожностью следует применять препарат при проведении десенсибилизирующей терапии; стенокардии Принцметала; гипертиреозе; сахарном диабете 1 типа и сахарном диабете со значительными колебаниями концентрации глюкозы в крови; AV-блокаде I степени; выраженной почечной недостаточности (КК менее 20 мл/мин); выраженных нарушениях функции печени; псориазе; рестриктивной кардиомиопатии; врожденных пороках сердца или пороке клапана сердца с выраженными гемодинамическими нарушениями; хронической сердечной недостаточности с инфарктом миокарда в течение последних 3 мес; феохромоцитоме (при сопутствующем применении альфа-адреноблокаторов); соблюдении строгой диеты.

Применение при беременности и кормлении грудью

При беременности препарат Арител Кор следует рекомендовать к применению 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 контролировать кровоток в плаценте и матке, а также наблюдать за ростом и развитием будущего ребенка. В случае появления нежелательных явлений в отношении беременности и/или плода следует применять альтернативные методы терапии. Необходимо тщательно обследовать новорожденного после родов. В первые 3 дня жизни могут возникать симптомы гипогликемии и брадикардии.Данных о выделении бисопролола с грудным молоком нет. Поэтому применение препарата Арител Кор не рекомендуется женщинам в период кормления грудью. При необходимости применения препарата в период лактации грудное вскармливание следует прекратить.

Побочные действия

Частота побочных реакций, приведенных ниже, определялась соответственно следующему: очень часто (≥1/10); часто (≥1/100, <1/10); нечасто (≥1/1000, <1/100); редко (≥1/10 000, <1/1000); очень редко (<1/10 000, включая отдельные сообщения).Со стороны ЦНС: часто - головокружение*, головная боль*; редко - потеря сознания.Психические нарушения: нечасто - депрессия, бессонница; редко - галлюцинации, ночные кошмары.Со стороны органа зрения: редко - уменьшение слезотечения (следует учитывать при ношении контактных линз); очень редко - конъюнктивит.Со стороны органа слуха: редко - нарушения слуха.Со стороны сердечно-сосудистой системы: очень часто - брадикардия (у пациентов с ХСН); часто - усугубление симптомов течения ХСН (у пациентов с ХСН), ощущение похолодания и онемения в конечностях, выраженное снижение АД, особенно у пациентов с ХСН; нечасто - нарушение AV-проводимости, брадикардия (у пациентов с артериальной гипертензией или стенокардией), усугубление симптомов течения ХСН (у пациентов с артериальной гипертензией или стенокардией), ортостатическая гипотензия.Со стороны дыхательной системы: нечасто - бронхоспазм у пациентов с бронхиальной астмой или обструкцией дыхательных путей в анамнезе; редко - аллергический ринит.Со стороны пищеварительной системы: часто - тошнота, рвота, диарея, запор; редко - гепатит.Со стороны костно-мышечной системы: нечасто - мышечная слабость, судороги мышц.Со стороны кожных покровов: редко - реакции повышенной чувствительности, такие как кожный зуд, сыпь, гиперемия кожных покровов; очень редко - алопеция. Бета-адреноблокаторы могут способствовать обострению симптомов течения псориаза или вызывать псориазоподобную сыпь.Со стороны репродуктивной системы: редко - нарушение потенции.Со стороны лабораторных показателей: редко - повышение концентрации триглицеридов и активности печеночных трансаминаз в крови (АСТ, АЛТ).Прочие: часто - астения (у пациентов с ХСН), повышенная утомляемость*; нечасто - астения (у пациентов с артериальной гипертензией или стенокардией).* У пациентов с артериальной гипертензией или стенокардией данные симптомы появляются обычно в начале курса лечения, неярко выражены и проходят в течение 1-2 недель после начала лечения.

Передозировка

Симптомы: AV-блокада, брадикардия, снижение АД, бронхоспазм, острая сердечная недостаточность и гипогликемия.Лечение: при возникновении передозировки прежде всего необходимо прекратить прием препарата и начать поддерживающую симптоматическую терапию.При выраженной брадикардии - в/в введение атропина. Если эффект недостаточный, с осторожностью можно ввести средство, обладающее положительным хронотропным действием. Иногда может потребоваться временная постановка искусственного водителя ритма.При чрезмерном снижении АД - в/в введение плазмозамещающих растворов и назначение вазопрессоров.При AV-блокаде пациенты должны находиться под постоянным наблюдением, и получать лечение альфа- и бета-адреномиметиками, такими как эпинефрин. В случае необходимости - постановка искусственного водителя ритма.При обострении течения ХСН - в/в введение диуретиков, препаратов с положительным инотропным эффектом, а также вазодилататоров.При бронхоспазме - применение бронходилататоров, в т.ч. бета2-симпатомиметиков и/или аминофиллина.При гипогликемии - в/в введение декстрозы (глюкозы).

Взаимодействие с другими препаратами

Нерекомендуемые комбинацииПри лечении хронической сердечной недостаточности антиаритмические средства I класса (например, хинидин, дизопирамид, лидокаин, фенитоин, флекаинид, пропафенон) при одновременном применении с бисопрололом могут снижать AV-проводимость и сократительную способность сердца.При лечении хронической сердечной недостаточности, артериальной гипертензии, стабильной стенокардии блокаторы медленных кальциевых каналов (БМКК) типа верапамила и в меньшей степени, дилтиазема, при одновременном применении с бисопрололом могут приводить к снижению сократительной способности миокарда и нарушению AV-проводимости. В частности, в/в введение верапамила пациентам, принимающим бета-адреноблокаторы, может привести к выраженной артериальной гипотензии и AV-блокаде.Гипотензивные средства центрального действия (такие как клонидин, метилдопа, моксонидин, рилменидин) могут привести к урежению ЧСС и снижению сердечного выброса, а также к вазодилатации вследствие снижения центрального симпатического тонуса. Резкая отмена, особенно до отмены бета-адреноблокаторов может увеличить риск развития рикошетной артериальной гипертензии.Комбинации, требующие соблюдения особой осторожностиПри лечении артериальной гипертензии, стабильной стенокардии антиаритмические средства I класса (например, хинидин, дизопирамид, лидокаин, фенитоин, флекаинид, пропафенон) при одновременном применении с бисопрололом могут снижать AV-проводимость и сократительную способность миокарда. Антиаритмические средства I класса

(например, хинидин, дизопирамид, лидокаин, фенитоин; флекаинид, пропафенон) при одновременном применении с бисопрололом могут снижать AV-проводимость и сократительную способность миокарда.При лечении хронической сердечной недостаточности, артериальной гипертензии, стабильной стенокардии БМКК производные дигидропиридина (например, нифедипин, фелодипин, амлодипин) при одновременном применении с бисопрололом могут увеличивать риск развития артериальной гипотензии. У пациентов с хронической сердечной недостаточностью нельзя исключить риск последующего ухудшения сократительной функции сердца. Антиаритмические средства III класса (например, амиодарон) могут усиливать нарушение AV-проводимости.Действие бета-адреноблокаторов для местного применения (например, глазных капель для лечения глаукомы) может усиливать системные эффекты бисопролола (снижение АД, урежение ЧСС). Парасимпатомиметики при одновременном применении с бисопрололом могут усиливать нарушение AV-проводимости и увеличивать риск развития брадикардии. Гипогликемическое действие инсулина или гипогликемических средств для приема внутрь может усиливаться. Признаки гипогликемии (в частности, тахикардия) могут маскироваться или подавляться. Подобные взаимодействия более вероятны при применении неселективных бета-адреноблокаторов.Средства для проведения общей анестезии могут увеличивать риск кардиодепрессивного действия, приводя к артериальной гипотензии.Сердечные гликозиды при одновременном применении с бисопрололом могут приводить к увеличению времени проведения импульса, и таким образом, к развитию брадикардии.НПВП могут снижать гипотензивный эффект бисопролола.Одновременное применение препарата с бета-адреномиметиками (например, изопреналин, добутамин) может приводить к снижению эффекта обоих препаратов.Сочетание бисопролола с адреномиметиками, влияющими на α- и β-адренорецепторы (например, норэпинефрин, эпинефрин), может усиливать вазоконстрикторные эффекты этих средств, возникающие с участием α-адренорецепторов, приводя к повышению АД. Подобные взаимодействия более вероятны при применении неселективных бета-адреноблокаторов. Антигипертензивные средства, также как и другие средства с возможным гипотензивным эффектом (например, трициклические антидепрессанты, барбитураты, фенотиазины), могут усиливать гипотензивный эффект бисопролола.Мефлохин при одновременном применении с бисопрололом может увеличивать риск развития брадикардии.Ингибиторы МАО (за исключением ингибиторов МАО типа В) могут усиливать гипотензивный эффект бета-адреноблокаторов. Одновременное применение также может привести к развитию гипертонического криза.

Особые указания

Не следует резко прерывать лечение препаратом и изменять рекомендуемую дозу без предварительной консультации с врачом, т.к. это может привести к временному ухудшению деятельности сердца. Лечение не следует прерывать внезапно, особенно у пациентов с ИБС. Если прекращение лечения необходимо, то дозу следует снижать постепенно.Контроль состояния пациентов, принимающих бисопролол, должен включать наблюдение за ЧСС и АД (в начале лечения - ежедневно, затем 1 раз в 3-4 мес), ЭКГ, концентрацией глюкозы крови у больных сахарным диабетом (1 раз в 4-5 мес). У пожилых пациентов рекомендуется контролировать функцию почек (1 раз в 4-5 мес). Следует обучить больного методике подсчета ЧСС и проинструктировать о необходимости врачебной консультации при ЧСС менее 50 уд./мин.Перед началом лечения рекомендуется проводить исследование функции внешнего дыхания у больных с отягощенным бронхолегочным анамнезом.Примерно у 20% больных стенокардией бета-адреноблокаторы неэффективны. Основные причины - тяжелый коронарный атеросклероз с низким порогом ишемии (ЧСС менее 100 уд./мин) и повышенный конечный диастолический объем левого желудочка, нарушающий субэндокардиальный кровоток.У курящих пациентов эффективность бета-адреноблокаторов ниже.Пациентам, пользующимся контактными линзами, следует учитывать, что на фоне лечения возможно уменьшение продукции слезной жидкости. При применении препарата у пациентов с феохромоцитомой имеется риск развития парадоксальной артериальной гипертензии (если предварительно не достигнута эффективная альфа-адреноблокада).При гипертиреозе препарат может маскировать определенные клинические признаки гиперфункции щитовидной железы (гипертиреоза), например, тахикардию. Резкая отмена препарата у пациентов с гипертиреозом противопоказана, поскольку это может усилить симптоматику.При сахарном диабете применение препарата может замаскировать тахикардию, вызванную гипогликемией. В отличие от неселективных бета-адреноблокаторов практически не усиливает вызванную инсулином гипогликемию и не задерживает восстановление содержания глюкозы в крови до нормального значения.При одновременном применении с клонидином прием последнего может быть прекращен только через несколько дней после отмены препарата Арител Кор.Возможно усиление выраженности реакций повышенной чувствительности и отсутствие эффекта от обычных доз эпинефрина (адреналина) на фоне отягощенного аллергологического анамнеза.В случае необходимости проведения планового хирургического лечения отмену препарата проводят за 48 ч до проведения общей анестезии. Если пациент принял препарат перед хирургическим вмешательством, ему следует подобрать лекарственное средство для общей анестезии с минимальным отрицательным инотропным действием. Пациенту следует предупредить врача-анестезиолога о том, что он принимает препарат Арител Кор.Реципрокную активацию блуждающего нерва можно устранить в/в введением атропина (1-2 мг).Лекарственные средства,

снижающие запасы катехоламинов (в т.ч. резерпин), могут усилить действие бета-адреноблокаторов, поэтому пациенты, принимающие такие сочетания лекарственных средств, должны находиться под постоянным наблюдением врача на предмет выявления артериальной гипотензии или брадикардии. Пациентам с бронхоспастическими заболеваниями можно назначать кардиоселективные адреноблокаторы в случае непереносимости и/или неэффективности других антигипертензивных средств, но при этом следует строго следить за дозой. Передозировка опасна развитием бронхоспазма.В случае появления у пациентов нарастающей брадикардии (менее 50 уд./мин), артериальной гипотензии (систолическое АД ниже 100 мм рт.ст.), AV-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.Нельзя резко прерывать лечение из-за опасности развития тяжелых аритмий и инфаркта миокарда. Отмену проводят постепенно, снижая дозу в течение 2 недель и более (снижают дозу на 25% в 3-4 дня). Следует отменять препарат перед исследованием содержания в крови и моче катехоламинов, норметанефрина и ванилинминдальной кислоты; титров антинуклеарных антител.Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмамиВ период лечения необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Условия хранения

В сухом месте