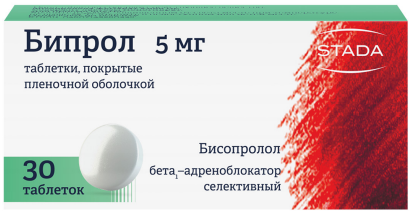
Инструкция по применению
Бипрол Таблетки покрытые оболочкой 5 мг 30 шт

Характеристики



Форма выпуска: Таблетки
Страна: Россия
Производитель: МАКИЗ-ФАРМА
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Бисопролол
Количество в упаковке: 30
Дозировка действующего вещества: 5 мг
Срок годности: 36.0

Описание

Круглые, двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета. на поперечном разрезе ядро белого или белого с едва заметным кремоватым оттенком цвета.

Действующее вещество

Бисопролол

Состав

Действующее вещество бисопролола фумарат 5,000 мг/10,000 мг, вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая 44,500 мг/ 62,400 мг, лудипресс ЛЦЕ (лактозы моногидрат 94,7-98,3%, повидон 3-4%) 40,000 мг/ 38,500 мг, крахмал кукурузный 8,000 мг/ 11,000 мг, кремния диоксид коллоидный 0,500 мг/ 0,600 мг, кросповидон (коллидон CL) 1,000 мг/ 1,250 мг, магния стеарат 1,000 мг/ 1,250 мг, оболочка: титана диоксид 0,287 мг/ 0,430 мг, макрогол (полиэтиленгликоль 4000) 0,287 мг/ 0,430 мг, гипромеллоза 1,320 мг/ 1,968 мг, тальк 0,106 мг/ 0,172 мг.

Форма выпуска

Таблетки

Фармакокинетика

Всасывание. Абсорбция — 80-90%, прием пищи не влияет на всасывание препарата. Максимальная концентрация в плазме крови наблюдается через 1-3 часа. Биодоступность — около 90%. Связь с белками плазмы крови — около 30%. Распределение. Объем распределения составляет 3,5 л/кг. Проницаемость через гематоэнцефалический и плацентарный барьеры — низкая. Метаболизм. Метаболизируется в печени при участии изоферментов CYP3A4 (до 95%) и CYP2D6. Эффект первичного прохождения через печень незначительный (около 10%). Биотрансформация бисопролола не ускоряется у пациентов с гиперфункцией щитовидной железы. Выведение. Общий клиренс составляет 15,6±3,2 л/час, почечный клиренс — 9,6±1,6 л/час. Сбалансированный клиренс бисопролола определяется равновесием между выведением его через почки в неизмененном виде (около 50%) и окислением в печени (около 50%) до неактивных метаболитов, которые затем также выводятся почками, менее 2% выводится через кишечник (с желчью).
Не накапливается в организме. Период полувыведения 9-12 часов. Зависимость фармакокинетики бисопролола от дозы носит линейный характер. Фармакокинетика бисопролола стабильная, не зависит от возраста и пола пациента. Фармакокинетика в особых клинических случаях Почечная недостаточность. В случае выраженных нарушений функции почек (клиренс креатинина менее 20 мл/мин) и у пациентов с анурией период полувыведения может увеличиться более чем в 2 раза. Печеночная недостаточность. В случае выраженной печеночной недостаточности отмечается увеличение периода полувыведения до 13-15 часов. Хроническая сердечная недостаточность. У пациентов с хронической сердечной недостаточностью (III функциональный класс по классификации NYHA) концентрация бисопролола в плазме крови выше, чем у здоровых добровольцев, а период полувыведения увеличивается до 17 часов.

Показания

Артериальная гипертензия. Ишемическая болезнь сердца: профилактика приступов стабильной стенокардии.

Способ применения и дозы

Препарат Бипрол принимают внутрь, утром, 1 раз в сутки с небольшим количеством жидкости, до завтрака, во время или после него. Таблетки не следует разжевывать или растирать в порошок. Во всех случаях режим приема и дозу подбирает врач каждому пациенту индивидуально, в частности, учитывая частоту сердечных сокращений и состояние пациента. При артериальной гипертензии и ишемической болезни сердца препарат назначают по 5 мг 1 раз в сутки. При необходимости дозу увеличивают до 10 мг 1 раз в сутки. При лечении артериальной гипертензии и стенокардии максимальная суточная доза составляет 20 мг 1 раз в сутки. Для пациентов с выраженным нарушением функции почек (клиренс креатинина менее 20 мл/мин) или с выраженным нарушением функции печени максимальная суточная доза составляет 10 мг 1 раз в сутки. Увеличение дозы у таких пациентов необходимо проводить с особой осторожностью. У пациентов пожилого возраста коррекции дозы не требуется.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к бисопрололу, другим компонентам препарата и другим бета-адреноблокаторам, шок (в том числе кардиогенный), отек легких, острая сердечная недостаточность или ХСН в стадии декомпенсации, требующая проведения инотропной терапии, AV блокада II-III степени, без электрокардиостимулятора, синоатриальная блокада, синдром слабости синусового узла, брадикардия (частота сердечных сокращений менее 60 уд/мин), стенокардия Принцметала, кардиомегалия (без признаков сердечной недостаточности), тяжелая артериальная гипотензия (систолическое АД менее 100 мм.рт.ст.), особенно при инфаркте миокарда, тяжелая бронхиальная астма и хроническая обструктивная болезнь легких (ХОБЛ) в анамнезе, одновременный прием флоктафенина, сультоприда, ингибиторов моноаминооксидазы (МАО), за исключением МАО типа В, одновременное внутривенное введение верапамила или дилтиазема, тяжелые нарушения периферического кровообращения, синдром Рейно, феохромоцитома (без одновременного использования альфа-адреноблокаторов), метаболический ацидоз, возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены). Дефицит лактазы, непереносимость лактозы, синдром мальабсорбции лактозы/изомальтозы (в состав препарата входит лактоза).

Применение при беременности и кормлении грудью

Бисопролол не оказывает прямого цитотоксического, мутагенного и тератогенного действия, но обладает фармакологическими эффектами, которые могут оказать вредное воздействие на течение беременности и/или на плод, или новорожденного. Обычно бета-адреноблокаторы снижают плацентарную перфузию, что ведет к замедлению роста плода, внутриутробной гибели плода, выкидышам или преждевременным родам. У плода и новорожденного ребенка могут возникнуть патологические реакции, такие как внутриутробная задержка развития, гипогликемия, брадикардия. Бипрол не следует применять во время беременности. Применение возможно в том случае, если польза для матери превышает риск развития побочных эффектов у плода и/или ребенка. В том случае, когда лечение препаратом Бипрол рассматривается в качестве необходимого, следует отслеживать кровоток в плаценте и матке, а также наблюдать за ростом и развитием плода. В случае появления нежелательных явлений в отношении беременности и/или плода, необходимо применять альтернативные методы терапии. Следует тщательно обследовать новорожденного после родов. Симптомы гипогликемии и брадикардии возникают, как правило, в течение первых 3 дней жизни. Данных о проникновении бисопролола в грудное молоко нет, поэтому прием препарата Бипрол не рекомендуется женщинам в период кормления грудью. При необходимости применения препарата в период лактации, грудное вскармливание необходимо прекратить.

Побочные действия

Частота приведенных ниже побочных эффектов указана в соответствии с классификацией ВОЗ: очень часто — более 10%, часто — более 1% и менее 10%, нечасто — более 0,1% и менее 1%, редко — более 0,01% и менее 0,1%, очень редко — менее 0,01%, включая отдельные случаи. Со стороны центральной и периферической нервной системы: часто — повышенная утомляемость, астения, головокружение, головная боль. Обычно эти явления развиваются в начале лечения, как правило, выражены незначительно и проходят в течение 1-2 недель, нечасто — нарушения сна, депрессия, редко — ночные кошмары, галлюцинации, потеря сознания. Со стороны сердечно-сосудистой системы: очень часто — брадикардия, ощущение сердцебиения, часто — выраженное снижение артериального давления (особенно у пациентов с ХСН), проявления ангиоспазма (усиление нарушений периферического кровообращения, ощущение холода в конечностях (парестезии), нечасто — нарушение AV проводимости (вплоть до развития полной поперечной блокады и остановки сердца), аритмии, усугубление течения ХСН с развитием периферических отеков (отечность лодыжек, стоп) и одышки, ортостатическая гипотензия, боль в груди. Со стороны пищеварительной системы: часто — тошнота, рвота, диарея, боль в животе, запор, сухость слизистой оболочки полости рта, редко — гепатит, повышение активности печеночных трансаминаз (аланинаминотрансферазы, аспартатаминотрансферазы), повышение концентрации билирубина. Со стороны дыхательной системы: нечасто — ларинго- и бронхоспазм у пациентов с бронхиальной астмой или обструктивными заболеваниями дыхательных путей, редко - аллергический ринит, заложенность носа. Со стороны опорно-двигательного аппарата: нечасто — мышечная слабость, судороги в икроножных мышцах, артралгия. Со стороны органов чувств: редко — нарушение зрения, уменьшение слезоотделения (следует учитывать при ношении контактных линз), нарушение слуха, изменение вкуса, очень редко — сухость и болезненность глаз, конъюнктивит. Со стороны кожных покровов: редко — усиление потоотделения, псориазоподобные кожные реакции, очень редко — алопеция, обострение течения псориаза. Со стороны эндокринной системы: редко — гипогликемия. Со стороны мочеполовой системы: редко — нарушение потенции, ослабление либидо. Со стороны иммунной системы: редко — появление антинуклеарных антител с необычной клинической симптоматикой волчаночноподобного синдрома, которые исчезают после окончания лечения. Аллергические реакции: редко — гиперемия кожи, кожный зуд, кожная сыпь, крапивница. Лабораторные показатели: редко — гипертриглицеридемия, очень редко — тромбоцитопения, агранулоцитоз, лейкопения. Прочие: редко — синдром отмены (усиление приступов стенокардии, повышение артериального давления).

Передозировка

Симптомы: аритмия, желудочковая экстрасистолия, выраженная брадикардия, AV блокада, выраженное снижение артериального давления, острая сердечная недостаточность, гипогликемия, акроцианоз, затруднение дыхания, бронхоспазм, головокружение, обморок, судороги. Лечение: промывание желудка, назначение адсорбирующих средств, симптоматическая терапия. При выраженной брадикардии — внутривенное введение атропина. Если эффект недостаточный, с осторожностью можно ввести средство, обладающее положительным хронотропным действием. Иногда может потребоваться временная постановка искусственного водителя ритма. При развившейся AV блокаде — внутривенное введение 1-2 мг атропина, эпинефрина или установка временного кардиостимулятора. При желудочковой экстрасистолии — лидокаин (препараты IA класса не применяются). При выраженном снижении артериального давления пациента следует перевести в положение Тренделенбурга, если нет признаков отека легких — внутривенное введение плазмозамещающих растворов, при их неэффективности — введение эпинефрина, допамина, добутамина (для поддержания хронотропного и инотропного действия и устранения выраженного снижения артериального давления). При гипогликемии может быть показано внутривенное введение раствора декстрозы (глюкозы). При сердечной недостаточности — сердечные гликозиды, диуретики. При судорогах — внутривенно диазепам. При бронхоспазме — ингаляционно бета2- адреномиметики.

Взаимодействие с другими препаратами

Флоктафенин. В случае шока или артериальной гипотензии, обусловленных флоктафенином, бета-адреноблокаторы вызывают уменьшение компенсаторных сердечно ¬ сосудистых реакций (совместное применение противопоказано). Сультоприд. Вследствие аддитивного эффекта возможно развитие выраженной брадикардии (совместное применение противопоказано). Ингибиторы МАО. Не рекомендуется одновременное применение (за исключением МАО типа В), поскольку велика вероятность значительного усиления антигипертензивного действия. Перерыв в лечении между приемом ингибиторов МАО и бисопролола должен составлять не менее 14 дней. Блокаторы «медленных» кальциевых каналов (дилтиазем и верапамил). Следует избегать этой комбинации. В период лечения препаратом Бипрол внутривенное введение верапамила или дилтиазема, других антиаритмических препаратов противопоказано. Вследствие синергизма действия возможно резкое снижение артериального давления, нарушения автоматизма (выраженная брадикардия, остановка синусового узла), нарушения AV проводимости, сердечная недостаточность. При необходимости назначения такой комбинации требуется тщательное клиническое и электрокардиографическое наблюдение

пациентов, особенно пожилого возраста и в начале лечения. Антиаритмические средства I класса (например, хинидин, дизопирамид, лидокаин, фенитоин, флекаинид, пропафенон) при одновременном применении возможно снижение AV проводимости и сократительной способности миокарда (следует избегать комбинации с бисопрололом). Антиаритмические средства III класса (например, амиодарон). При совместном применении с бисопрололом возможно нарушение сократимости, автоматизма и проводимости вследствие угнетения симпатических компенсаторных механизмов (следует избегать этой комбинации). Антигипертензивные средства центрального действия (клонидин, апраклонидин, альфа — метилдопа, гуанфанцин, моксонидин, рилменидин). При совместном применении повышение риска развития выраженной брадикардии, остановки синусового узла, нарушения AV проводимости, резкого снижения артериального давления, сердечной недостаточности (синергическое действие). Следует избегать этой комбинации. При необходимости применения требуется тщательный клинический и электрокардиографический контроль, особенно у пожилых пациентов и в начале лечения. Значительное повышение артериального давления при резкой отмене антигипертензивного препарата центрального действия. Сердечные гликозиды. Снижение частоты сердечных сокращений, нарушение проводимости. Бета-адреноблокаторы для местного применения (например, глазные капли для лечения глаукомы) могут усилить системное действие бисопролола (снижение артериального давления, урежение частоты сердечных сокращений). Блокаторы кальциевых каналов (например, нифедипин). Возможно чрезмерное снижение артериального давления. Парасимпатомиметики. При совместном применении риск развития брадикардии. Мефлохин. Совместное применение с бисопрололом повышает риск развития брадикардии (аддитивное действие). Фенитоин при внутривенном введении, лекарственные средства для ингаляционной общей анестезии (производные углеводородов) повышают выраженность кардиодепрессивного действия и вероятность снижения артериального давления. Одновременное применение с бета-адреномиметиками (например, изопреналин, добутамин) может приводить к снижению эффекта обоих препаратов. Сочетание бисопролола с адреномиметиками, влияющими на бета- и алъфа- адренорецепторы (например, норэпинефрин, эпинефрин), может усиливать вазоконстрикторное действие этих средств, возникающее с участием альфа- адренорецепторов, приводя к повышению артериального давления. Подобные взаимодействия более вероятны при применении неселективных бета-адреноблокаторов. Бисопролол может изменять эффективность инсулина и гипогликемических средств для приема внутрь, маскировать симптомы развивающейся гипогликемии (тахикардия, повышение артериального давления). Бисопролол снижает клиренс лидокаина и ксантинов (кроме дифиллина) и повышает их концентрацию в плазме, особенно у пациентов с исходно повышенным клиренсом

теофиллина под влиянием курения. Антигипертензивное действие ослабляют нестероидные противовоспалительные препараты (задержка ионов натрия и блокада синтеза простагландина почками), глюкокортикостероиды и эстрогены (задержка ионов натрия). Диуретики, симпатолитики, гидралазин и другие гипотензивные лекарственные средства. Риск чрезмерного снижения артериального давления. Бисопролол удлиняет действие недеполяризующих миорелаксантов и антикоагулянтный эффект кумаринов. Три- и тетрациклические антидепрессанты, антипсихотические лекарственные средства (нейролептики), этанол, седативные и снотворные лекарственные средства — при совместном применении с бисопрололом усиление угнетения центральной нервной системы. Негидрированные алкалоиды спорыньи повышают риск развития нарушений периферического кровообращения. Эрготамин повышает риск развития нарушения периферического кровообращения. Сульфасалазин повышает концентрацию бисопролола в плазме. Рифампицин уменьшает период полувыведения бисопролола. Аллергены, используемые для иммунотерапии, или экстракты аллергенов для кожных проб повышают риск возникновения тяжелых системных аллергических реакций или анафилаксии у пациентов, получающих бисопролол. Иодсодержащие рентгеноконтрастные диагностические средства для внутривенного введения повышают риск развития анафилактических реакций.

Особые указания

Лечение препаратом обычно является долговременным. Перед началом лечения рекомендуется проведение исследования функции внешнего дыхания у пациентов с отягощенным бронхолегочным анамнезом. Пациентам с бронхоспастическими заболеваниями можно назначать бисопролол в случае непереносимости и/или неэффективности других гипотензивных лекарственных средств, при этом следует строго следить за дозой препарата. Передозировка опасна развитием бронхоспазма. Наблюдение за пациентами, принимающими бисопролол, должно включать контроль частоты сердечных сокращений, артериального давления (в начале лечения — ежедневно, затем 1 раз в 3-4 месяца), электрокардиограммы, концентрации глюкозы в плазме крови у пациентов с сахарным диабетом (1 раз в 4-5 месяцев). У пожилых пациентов рекомендуется контролировать функцию почек (1 раз в 4-5 месяцев). Следует обучить пациента методике подсчета частоты сердечных сокращений и проинструктировать о необходимости врачебной консультации при снижении ее менее 60 уд/мин. Примерно у 20% пациентов со стенокардией бета-адреноблокаторы неэффективны. Основные причины — тяжелый коронарный атеросклероз с низким порогом ишемии (частота сердечных сокращений менее 100 уд /мин) и повышение конечного диастолического объема левого желудочка,

нарушающее субэндокардиальный кровоток. У курильщиков эффективность бета-адреноблокаторов ниже. Пациенты, пользующиеся контактными линзами, должны учитывать, что на фоне лечения возможно уменьшение продукции слезной жидкости. При использовании у пациентов с феохромоцитомой имеется риск развития парадоксальной артериальной гипертензии (если предварительно не была достигнута эффективная альфа-адреноблокада). При тиреотоксикозе бисопролол может маскировать определенные клинические признаки тиреотоксикоза (например, тахикардию). Резкая отмена у пациентов с тиреотоксикозом противопоказана, поскольку способна усилить симптоматику. При сахарном диабете может маскировать тахикардию, вызванную гипогликемией. В отличие от неселективных бета-адреноблокаторов, практически не усиливает вызванную инсулином гипогликемию и не задерживает восстановление концентрации глюкозы в крови до нормального уровня. При одновременном применении клонидина его прием может быть прекращен только через несколько дней после отмены бисопролола. Возможно усиление выраженности реакции повышенной чувствительности и отсутствие эффекта от обычных доз эпинефрина на фоне отягощенного аллергологического анамнеза. В случае необходимости проведения планового хирургического вмешательства отмену препарата проводят за 48 часов до начала общей анестезии. Если пациент принял препарат перед хирургическим вмешательством, ему следует подобрать лекарственное средство для общей анестезии с минимальным отрицательным инотропным действием. Реципрокную активацию блуждающего нерва можно устранить внутривенным введением атропина (1-2 мг). Лекарственные средства, снижающие запасы катехоламинов (например, 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. В случае появления у пациентов пожилого возраста нарастающей брадикардии (менее 60 уд /мин), артериальной гипотензии (систолическое артериальное давление ниже 100 мм рт.ст.), AV блокады, бронхоспазма, желудочковых аритмий, тяжелых нарушений функции печени и почек необходимо уменьшить дозу или прекратить лечение. Нельзя резко прерывать лечение бисопрололом из-за опасности развития тяжелых аритмий и инфаркта миокарда. Отмену проводят постепенно, снижая дозу в течение 2 недель и более (дозу снижают на 25% в 3-4 дня). Рекомендуется прекратить терапию (с постепенным снижением дозы) при развитии депрессии, вызванной приемом препарата. Препарат следует отменить перед исследованием содержания в крови и моче катехоламинов, норметанефрина и ванилинминдальной кислоты, титра антинуклеарных антител.

Условия хранения

В сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25°С. Хранить в недоступном для детей месте.