Инструкция по применению
Бисопролол БЗМП Таблетки 10 мг 30 шт

Характеристики



Форма выпуска: Таблетки
Страна: Беларусь
Производитель: Борисовский Завод Медицинских Препаратов
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Бисопролол
Количество в упаковке: 1

Описание

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой розового цвета, с двояковыпуклой поверхностью, с риской. На поперечном разрезе: ядро белого или почти белого цвета.

Действующее вещество

Бисопролол

Состав

Одна таблетка содержит: действующее вещество: бисопролола фумарат - 10 мг, вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, кукурузный крахмал, кремния диоксид коллоидный безводный, магния стеарат, натрия карбоксиметилкрахмал (тип А), кальция гидрофосфат дигидрат, опадрай II (в т.ч. спирт поливиниловый, частично гидролизованный, тальк, макрогол 3350 (полиэтиленгликоль 3350), окрашивающий пигмент: белого цвета (содержит титана диоксид Е 171)- для дозировки 2,5 мг, голубого цвета (содержит титана диоксид Е 171, алюминиевый лак на основе индигокармина Е 132, алюминиевый лак на основе желтого хинолинового Е 104) - для дозировки 5 мг или розового цвета (содержит титана диоксид Е 171, кармин Е 120, алюминиевый лак на основе индигокармина Е 132, железа оксид черный Е 172) - для дозировки 10 мг).

Форма выпуска

Таблетки

Фармакокинетика

Бисопролол почти полностью (более 90%) всасывается в желудочно-кишечном тракте, прием пищи не влияет на абсорбцию. Эффект "первичного прохождения" через печень незначителен (на уровне 10-15%), что приводит к высокой биодоступности (90%). Прием пищи не влияет на биодоступность бисопролола. Бисопролол метаболизируется по окислительному пути без последующей конъюгации. Все метаболиты обладают сильной полярностью 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. Связь с белками плазмы крови около 30%. Объём распределения - 3,5 л/кг. Общий клиренс - приблизительно 15 л/ч. Максимальная концентрация в плазме крови определяется через 2-3 часа. Проницаемость через гематоэнцефалический барьер и плацентарный барьер - низкая. Период полувыведения из плазмы крови (10-12 часов) обеспечивает эффективность в течение 24 ч после приема однократной ежедневной дозы. Бисопролол выводится из организма двумя путями, 50% дозы метаболизируется в печени с образованием неактивных метаболитов. Около 98% выводится почками, из них 50% выводится в неизмененном виде, менее 2% - через кишечник (с желчью). Поскольку выведение имеет место в почках и в печени в равной степени, пациентам с нарушением функции печени или с почечной недостаточностью коррекции дозы не требуется. Фармакокинетика бисопролола линейна и не зависит от возраста. У пациентов с ХСН плазменные концентрации бисопролола выше, а период полувыведения более продолжителен по сравнению со здоровыми добровольцами. Отсутствует информация о фармакокинетике бисопролола у пациентов с ХСН и одновременным нарушением функции печени или почек.

Показания

артериальная гипертензия, ишемическая болезнь сердца (ИБС): профилактика приступов стабильной стенокардии, хроническая сердечная недостаточность.

Способ применения и дозы

Бисопролол принимают внутрь, утром натощак, однократно, не разжевывая, запивая небольшим количеством жидкости. Таблетки не следует разжевывать или растирать в порошок. Лечение артериальной гипертензии и стенокардии Во всех случаях режим приема и дозировку подбирает врач каждому пациенту индивидуально, в частности, учитывая частоту сердечных сокращений и терапевтический ответ. При артериальной

гипертензии и ишемической болезни сердца обычно начальная доза составляет 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/сут. Возможно разделение суточной дозы на 2 приема. Лечение стабильной хронической сердечной недостаточности Стандартная схема лечения ХСН включает применение ингибиторов ангиотензинпревращающего фермента (АПФ) или антагонистов рецепторов ангиотензина II (в случае непереносимости ингибиторов АПФ), бета-адреноблокаторов, диуретиков и, факультативно, сердечных гликозидов. Начало лечения ХСН бисопрололом требует обязательного проведения специальной фазы титрования и регулярного врачебного контроля. Предварительным условием для лечения бисопрололом является стабильная хроническая сердечная недостаточность без признаков обострения. Лечение ХСН бисопрололом начинается в соответствии со следующей схемой титрования. При этом может потребоваться индивидуальная адаптация в зависимости от того, насколько хорошо пациент переносит назначенную дозу, т.е. дозу можно увеличивать только в том случае, если предыдущая доза хорошо переносилась. Для обеспечения указанного ниже режима дозирования, возможно назначение препаратов бисопролола в лекарственной форме "таблетки 2,5 мг и 5 мг" с риской (для получения дозировок 1,25 мг, 2,5 мг и 3,75 мг). Рекомендуемая начальная доза составляет 1,25 мг (1/2 таблетки по 2,5 мг) один раз в день. В зависимости от индивидуальной переносимости дозу следует постепенно повышать до 2,5 мг, 3,75 мг (11/2 таблетки по 2,5 мг), 7,5 мг (3 таблетки по 2,5 мг или 11/2 таблетки бисопролола по 5 мг) и 10 мг 1 раз в день. Каждое последующее увеличение дозы должно осуществляться не менее чем через две недели. Если увеличение дозы препарата плохо переносится пациентом, возможно снижение дозы. Максимальная рекомендованная доза при ХСН составляет 10 мг бисопролола 1 раз в день. Во время титрования рекомендуется регулярный контроль АД, ЧСС и степени выраженности симптомов ХСН. Усугубление симптомов течения ХСН возможно уже с первого дня применения препарата. Если пациент плохо переносит максимально рекомендованную дозу препарата, возможно постепенное снижение дозы. 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 бисопролола или его отмена. После стабилизации состояния пациента следует провести повторное титрование дозы, либо продолжить лечение. Особые группы пациентов Нарушение функции почек или печени: При нарушении функции печени или почек легкой или умеренной степени обычно не требуется корректировать дозу. При тяжелых 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 больных должно осуществляться с особой осторожностью. К настоящему времени недостаточно данных относительно применения бисопролола у пациентов с ХСН, сопряженной 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. Также до сих пор не было получено достаточных данных относительно пациентов с ХСН с инфарктом миокарда в течение последних 3 месяцев.

Противопоказания

повышенная чувствительность к бисопрололу или к любому из вспомогательных веществ, острая сердечная недостаточность, хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации, требующая проведения инотропной терапии, кардиогенный шок, атриовентрикулярная (AV) блокада II и III степени (без электрокардиостимулятора), синоатриальная блокада, синдром слабости синусового узла, выраженная брадикардия (ЧСС тяжелая артериальная гипотензия (систолическое АД тяжелые формы бронхиальной астмы, выраженные нарушения периферического артериального кровообращения или синдром Рейно, метаболический ацидоз, феохромоцитома (без одновременного применения альфа-адреноблокаторов), детский и подростковый возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).

Применение при беременности и кормлении грудью

Бисопролол 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 (например, гипогликемия, брадикардия, артериальная гипотензия). Бисопролол не следует применять при 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 бисопрололом рассматривается в качестве необходимого, следует проводить наблюдение за маточно-плацентарным кровотоком и внутриутробным развитием плода. В случае отрицательного воздействия на беременность или плод следует рассмотреть альтернативную терапию. Симптомы гипогликемии и брадикардии, как правило, возникают в течение первых 3 дней. Следует тщательно обследовать новорожденного после родов. Данные о выделении бисопролола в грудное молоко отсутствуют. Поэтому при необходимости применения препарата в период лактации, грудное вскармливание необходимо прекратить.

Побочные действия

Частота побочных реакций, приведенных ниже, определялась соответственно следующему (классификация Всемирной организации здравоохранения): очень часто - не менее 10%, часто - не менее 1%, но менее 10%, нечасто - не менее 0,1%, но менее 1%, редко - не менее 0,01%, но менее 0,1%, очень редко - менее 0,01%, включая отдельные сообщения. Со стороны сердца и сосудов: очень часто - урежение ЧСС (брадикардия, особенно у пациентов с ХСН), ощущение сердцебиения, часто - выраженное снижение АД (особенно у пациентов с ХСН), проявление ангиоспазма (усиление нарушений периферического кровообращения, ощущение холода в конечностях (парестезии), нечасто - нарушение AV проводимости (вплоть до развития полной поперечной блокады и остановки сердца), аритмии, ортостатическая гипотензия, усугубление течения ХСН с развитием периферических отеков (отечность лодыжек, стоп, одышка), боль в груди. Со стороны нервной системы: часто - головокружение, головная боль, астения, повышенная утомляемость, нарушения сна, депрессия, беспокойство, редко - спутанность сознания или кратковременная потеря памяти, "кошмарные" сновидения, галлюцинации, миастения, тремор, судороги мышц. Обычно эти явления носят легкий характер и проходят, как правило, в течение 1-2 недель, после начала лечения. Со стороны органов чувств: редко - нарушение зрения, уменьшение слезоотделения (следует учитывать при ношении контактных линз), шум в ушах, снижение слуха, боль в ухе, очень редко - сухость и болезненность глаз, конъюнктивит, нарушения вкуса. Со стороны дыхательной системы: нечасто - бронхоспазм у пациентов с бронхиальной астмой или обструктивными заболеваниями дыхательных путей, редко - аллергический ринит, заложенность носа. Со стороны пищеварительной системы: часто - тошнота, рвота, диарея, запор, сухость слизистой оболочки полости рта, боль в животе, редко - гепатит, повышение активности ферментов печени (аланинаминотрансферазы, аспартатаминотрансферазы), повышение концентрации билирубина. Со стороны опорно-двигательного аппарата: нечасто - артралгия, боль в спине. Со стороны мочеполовой системы: очень редко - нарушение потенции, ослабление либидо. Лабораторные показатели: редко - повышение концентрации триглицеридов в крови, в отдельных случаях - тромбоцитопения, агранулоцитоз, лейкопения. Аллергические реакции: редко - кожный зуд, кожная сыпь, крапивница. Со стороны кожных покровов: редко - повышенное потоотделение, гиперемия кожи, экзантема, псориазоподобные кожные реакции, очень редко - алопеция, бета- адреноблокаторы могут обострять течение псориаза. Прочие: синдром "отмены" (учащение приступов стенокардии, повышение АД).

Передозировка

Симптомы: аритмия, желудочковая экстрасистолия, выраженная брадикардия, AV блокада, выраженное снижение АД, острая сердечная недостаточность, гипогликемия, акроцианоз, затруднение дыхания, бронхоспазм, головокружение, обморок, судороги. Лечение: при возникновении передозировки, прежде всего надо прекратить прием препарата, провести промывание желудка, назначить адсорбирующие средства, провести симптоматическую терапию. 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 выраженном снижении АД - внутривенное введение плазмозамещающих растворов и вазопрессоров. При гипогликемии может быть показано внутривенное введение декстрозы (глюкозы), а так же внутривенное введение глюкагона. При AV блокаде: пациенты должны находиться под постоянным наблюдением, и получать лечение бета-адреномиметиками, такими как эпинефрин. В случае необходимости - постановка искусственного водителя ритма. При обострении течения ХСН - внутривенное введение диуретиков, препаратов с положительным инотропным эффектом, а также вазодилататоров. При бронхоспазме - назначение бронходилататоров, в том числе бета2-адреномиметиков и/или аминофиллина.

Взаимодействие с другими препаратами

Нерекомендуемые комбинации Антиаритмические средства I класса (например, хинидин, дизопирамид, лидокаин, фенитоин, флекаинид, пропафенон) при одновременном применении с бисопрололом могут снижать AV проводимость и сократительную способность сердца. 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, внутривенное 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 осторожности 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. Одновременное применение бисопролола с бета-адреномиметиками (например, изопреналин, добутамин) может приводить к снижению эффекта обоих препаратов. Сочетание бисопролола с адреномиметиками, влияющими на бета- и альфа-адренорецепторы (например, норэпинефрин, эпинефрин), может усиливать вазоконстрикторные эффекты этих средств, возникающих с участием альфа-адренорецепторов, приводя к повышению АД. Подобные взаимодействия более вероятны при применении неселективных бета-адреноблокаторов. Мефлохин при одновременном применении с бисопрололом может увеличивать риск развития брадикардии. Аллергены, используемые для иммунотерапии, или экстракты аллергенов для кожных проб повышают риск возникновения тяжелых системных аллергических реакций или анафилаксии у пациентов, получающих Бисопролол. Йодосодержащие рентгеноконтрастные диагностические средства для внутривенного введения повышают риск развития анафилактических реакций. Фенитоин при внутривенном введении, средства для ингаляционной анестезии (производные углеводородов) повышают выраженность кардиодепрессивного действия и вероятность снижения АД. Эффективность инсулина и гипогликемических средств для приема внутрь может меняться при лечении бисопрололом (маскирует симптомы развивающейся гипогликемии: тахикардию, повышение АД). Клиренс лидокаина и ксантинов (кроме теофиллина) может снижаться в связи с возможным повышением их концентрации в плазме крови, особенно у пациентов с исходно повышенным клиренсом теофиллина под влиянием курения. Антигипертензивный эффект ослабляют нестероидные противовоспалительные препараты (НПВП) (задержка ионов натрия и блокада синтеза простагландинов почками), глюкокортикостероиды и эстрогены (задержка ионов натрия). Сердечные гликозиды, метилдопа, резерпин и гуанфацин, блокаторы "медленных" кальциевых каналов (верапамил, дилтиазем), амиодарон и другие антиаритмические средства повышают риск развития или усугубления брадикардии, AV блокады, остановки сердца и сердечной недостаточности. Нифедипин может приводить к значительному снижению АД. Диуретики, клонидин, симпатолитики, гидралазин и другие гипотензивные средства могут привести к чрезмерному снижению АД. Действие недеполяризующих миорелаксантов и антикоагулянтный эффект кумаринов в период лечения бисопрололом может удлиняться. Трициклические и тетрациклические антидепрессанты, антипсихотические средства (нейролептики), этанол, седативные и снотворные средства усиливают угнетение центральной нервной системы. Не рекомендуется одновременное применение с ингибиторами МАО (за исключением ингибиторов МАО В) вследствие значительного усиления антигипертензивного

действия. Одновременное применение также может привести к развитию гипертонического криза. Перерыв в лечении между приемом ингибиторов МАО и бисопролола должен составлять не менее 14 дней. Негидрированные алкалоиды спорыньи повышают риск развития нарушений периферического кровообращения. Эрготамин повышает риск развития нарушения периферического кровообращения. Сульфасалазин повышает концентрацию бисопролола в плазме крови. Рифампицин укорачивает период полувыведения бисопролола.

Особые указания

Контроль за состоянием пациентов, принимающих Бисопролол, должен включать измерение ЧСС и АД, проведение ЭКГ, определение концентрации глюкозы крови у пациентов с сахарным диабетом (1 раз в 4-5 мес.). У пациентов пожилого возраста рекомендуется следить за функцией почек (1 раз в 4-5 мес.). Следует обучить пациента 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 пациентов с отягощенным бронхолегочным анамнезом. Пациентам, пользующимся контактными линзами, следует учитывать, что на фоне лечения препаратом возможно уменьшение продукции слезной жидкости. При применении бисопролола у пациентов с феохромоцитомой имеется риск развития парадоксальной артериальной гипертензии (если предварительно не достигнута эффективная блокада альфа-адренорецепторов). При тиреотоксикозе Бисопролол может маскировать определенные клинические признаки тиреотоксикоза (например, тахикардию). Резкая отмена препарата 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 значения. 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 (адреналина) на фоне отягощенного аллергологического анамнеза. В случае необходимости проведения планового хирургического лечения препарат следует отменить за 48 ч до проведения общей анестезии. Если пациент принял препарат перед хирургическим вмешательством, ему следует подобрать лекарственный препарат для общей анестезии с минимально отрицательным инотропным действием. Реципрокную активацию блуждающего нерва можно устранить внутривенным введением атропина (1-2 мг). Лекарственные препараты, которые истощают депо

катехоламинов (в т. ч. резерпин), могут усилить действие бета-адреноблокаторов, поэтому пациенты, принимающие такие сочетания лекарственных препаратов, должны находиться под постоянным наблюдением врача на предмет выявления выраженного снижения АД или брадикардии. Пациентам с тяжелыми формами ХОБЛ и нетяжелыми формами бронхиальной астмы следует с осторожностью назначать кардиоселективные бета-адреноблокаторы в случае непереносимости и/или неэффективности других гипотензивных средств. На фоне приема бета-адреноблокаторов у пациентов с сопутствующей бронхиальной астмой может усиливаться сопротивление дыхательных путей. При превышении дозы бисопролола у таких пациентов возникает опасность развития бронхоспазма. У пациентов с ХОБЛ Бисопролол, назначаемый в комплексной терапии с целью лечения сердечной недостаточности, следует начинать с наименьшей возможной дозы, а пациентов тщательно наблюдать на предмет появления новых симптомов (например, одышки, непереносимости физических нагрузок, кашля). В случае выявления у пациентов нарастающей брадикардии (ЧСС менее 60 уд./мин.), выраженного снижения АД (систолическое АД менее 100 мм рт.ст.), AV блокады, необходимо уменьшить дозу или прекратить лечение. Рекомендуется прекратить терапию бисопрололом при развитии депрессии. Нельзя резко прерывать лечение из-за опасности развития тяжелых аритмий и инфаркта миокарда. Отмену препарата проводят постепенно, снижая дозу в течение 2 недель и более (снижают дозу на 25% в 3-4 дня). Следует отменять препарат перед исследованием концентрации в крови и моче катехоламинов, норметанефрина, ванилинминдальной кислоты, титров антинуклеарных антител. У курильщиков эффективность бета-адреноблокаторов ниже.Влияние на способность управлять трансп. ср. и мех.:Препарат Бисопролол не влияет на способность управлять автотранспортом согласно результатам исследования у пациентов с ИБС. Однако вследствие индивидуальных реакций способность управлять автотранспортом или работать с технически сложными механизмами может быть нарушена. На это следует обратить особое внимание в начале терапии, после изменения дозы, а также при одновременном употреблении алкоголя.

Условия хранения

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