Инструкция по применению
Бисопролол-Озон Таблетки 5 мг 50 шт

Характеристики

Форма выпуска: Таблетки
Страна: Россия
Производитель: Озон
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Бисопролол
Количество в упаковке: 50
Дозировка действующего вещества: 5 мг



Описание

Таблетки цилиндрические, двояковыпуклой формы, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета. На изломе видны два слоя - ядро белого или почти белого цвета и пленочная оболочка.

Действующее вещество

Бисопролол

Состав

Каждая таблетка 5,0 мг содержит: Активное вещество: бисопролола фумарат 5,0 мг. Вспомогательные вещества (ядро): лактозы моногидрат (сахар молочный) 71,5 мг, целлюлоза микрокристаллическая 18,0 мг, магния стеарат 0,75 мг, крахмал прежелатинизированный 1,25 мг, повидон (поливинилпирролидон) 3,5 мг. Вспомогательные вещества (оболочка): гипромеллоза 1,65 мг, макрогол 4000 0,45 мг, титана диоксид 0,9 мг.

Форма выпуска

Таблетки

Фармакокинетика

Всасывание. Бисопролол почти полностью (> 90%) всасывается из желудочно-кишечного тракта. Его биодоступность вследствие незначительной метаболизации "при первичном прохождении" через печень (на уровне примерно 10%) составляет около 90% после приема внутрь. Прием пищи не влияет на биодоступность. Бисопролол демонстрирует линейную кинетику причем его концентрации в плазме крови пропорциональны введенной дозе в диапазоне доз от 5 до 20 мг. Максимальная концентрация в плазме крови достигается через 2-3 часа. Распределение. Бисопролол распределяется довольно широко. Объем распределения составляет 35 л/кг. Связь с белками плазмы крови достигает примерно 30%. Метаболизм. Метаболизируется 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. Выведение. Клиренс бисопролола определяется равновесием между выведением почками в неизмененном виде (около 50%) и метаболизмом в печени (около 50%) до метаболитов которые затем также выводятся почками. Общий клиренс составляет 15 л/час. Период полувыведения (T1 /2) составляет 10-12 часов.

Показания

- Артериальная гипертензия, - ишемическая болезнь сердца: профилактика приступов стабильной стенокардии, - хроническая сердечная недостаточность (в составе комбинированной терапии).

Способ применения и дозы

Внутрь утром натощак не разжевывая однократно. Артериальная гипертензия и ишемическая болезнь сердца: профилактика приступов стенокардии напряжения. Рекомендуется принимать 5 мг однократно. При необходимости дозу увеличивают до 10 мг 1 раз в сутки. Максимальная суточная доза - 20 мг. У пациентов с нарушением функции почек при клиренсе креатинина (КК) менее 20 мл/мин или с выраженными нарушениями функции печени максимальная суточная доза - 10 мг. Коррекции дозы у пожилых пациентов не требуется. Хроническая сердечная недостаточность Начало лечения ХСН препаратом Бисопролол требует обязательного проведения специального периода подбора доз. Предварительные условия для начала терапии следующие: ХСН без признаков обострения в предшествующие шесть недель

практически неизменяемая базисная терапия в предшествующие две недели лечение оптимальными дозами ингибиторов ангиотензинпревращающего фермента (АПФ) (и сосудорасширяющих средств в случае непереносимости ингибиторов АПФ) диуретиков и при необходимости сердечных гликозидов. Лечение назначается в соответствии с указанной схемой подбора доз: 1я неделя - 125 мг* 1 раз в день 2я неделя - 25 мг 1 раз в день 3я неделя - 375 мг 1 раз в день 4я-7я неделя - 5 мг 1 раз в день 8я-11я неделя - 75 мг 1 раз в день 12я неделя и далее - 10 мг 1 раз в день в качестве поддерживающей терапии. *Для осуществления данного режима дозирования следует использовать бисопролол других производителей в лекарственной форме и дозировке позволяющей получить дозу 125 мг (например 1/2 таблетки по 25 мг). Максимальная рекомендованная доза препарата Бисопролол составляет 10 мг 1 раз в день. После начала лечения препаратом в дозе 125 мг пациента следует наблюдать в течение около 4 ч (контроль ЧСС АД нарушения проводимости на ЭКГ признаков ухудшения хронической сердечной недостаточности). Возможна индивидуальная реакция пациента на назначенную терапию т.е. дозу можно увеличивать только в том случае если предыдущая доза хорошо переносилась. Во время периода подбора доз или после нее может произойти временное ухудшение течения ХСН задержка жидкости в организме артериальная гипотензия или брадикардия. В этом случае рекомендуется прежде всего обратить внимание наподбор дозы сопутствующей базисной терапии (оптимизировать дозу диуретика и/или ингибитора АПФ) перед снижением дозы препарата Бисопролол. Лечение препаратом следует прерывать только в случае крайней необходимости. После стабилизации состояния пациента следует провести повторный подбор дозы либо продолжить лечение. Особые группы пациентов Нарушение функции почек или печени Нарушения функции печени или почек легкой или умеренной степени обычно не требует корректировки дозы. 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 должно осуществляться с особой осторожностью. Пациентам пожилого возраста коррекции дозы не требуется. К настоящему времени недостаточно данных относительно применения препарата Бисопролол 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 компонентам препарата и к другим бета-адреноблокаторам, - острая сердечная недостаточность и хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации требующая проведения инотропной терапии, - кардиогенный шок, - коллапс, - атриовентрикулярная (AV) блокада II и III степени (без электрокардиостимулятора), - синоатриальная блокада, - синдром слабости синусового узла, - тяжелая брадикардия (ЧСС до начала лечения менее 50 уд. /мин), - тяжелая артериальная гипотензия (систолическое АД менее 90 мм рт. ст.), - кардиомегалия (без признаков сердечной недостаточности), - тяжелые формы бронхиальной астмы и хронической обструктивной болезни легких (ХОБЛ) в анамнезе, - тяжелые нарушения периферического кровообращения, - синдром Рейно, - метаболический ацидоз, - феохромоцитома (без одновременного применения альфа-адреноблокаторов), - сопутствующее применение флоктафенина и сультоприда, - возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).

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 на 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. Препарат 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 препаратом Бисопролол рассматривается в качестве необходимого следует отслеживать кровоток в плаценте и матке а также наблюдать за ростом и развитием будущего ребенка и в случае появления нежелательных явлений в отношении беременности и/или плода принимать альтернативные методы терапии. Следует тщательно обследовать новорожденного после родов. Симптомы гипогликемии и брадикардии как правило возникают в течение первых 3 дней жизни. Данных о проникновении бисопролола в грудное молоко нет. Поэтому применение препарата Бисопролол не рекомендуется женщинам в период кормления грудью. При необходимости применения препарата в период лактации грудное вскармливание необходимо прекратить.

Побочные действия

Частота побочных реакций приведенных ниже определялась соответственно следующему (классификация ВОЗ): очень часто (≥ 10%), часто (≥1% но <10%), нечасто (≥ 01% но <1%), редко (≥ 001% но < 01%), очень редко (< 001% включая отдельные сообщения). Со стороны сердечно-сосудистой системы: 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 (аланинаминотрансфераза (АЛТ) аспартатаминотрансфераза (АСТ)) повышение концентрации билирубина. Со стороны костно-мышечной системы: нечасто - артралгия боль в спине. Со стороны мочеполовой системы: очень редко - нарушение потенции ослабление либидо. Со стороны лабораторных показателей: редко - повышение концентрации триглицеридов в крови, в отдельных случаях - тромбоцитопения агранулоцитоз лейкопения. Аллергические реакции: редко - кожный зуд сыпь крапивница. Со стороны кожных покровов: редко - усиление потоотделения гиперемия кожи экзантема псориазоподобные кожные реакции, очень редко - алопеция бета-адреноблокаторы могут обострять течение псориаза. Прочие: синдром "отмены" (учащение приступов стенокардии повышение АД). Проинформируйте Вашего лечащего врача если Вы обнаружите у себя какие-либо из перечисленных побочных эффектов или любые другие нежелательные или непредвиденные эффекты.

Передозировка

Симптомы: аритмия желудочковая экстрасистолия выраженная брадикардия AV-блокада выраженное снижение АД острая сердечная недостаточность гипогликемия акроцианоз затруднение дыхания бронхоспазм головокружение обморок судороги. Лечение: прежде всего надо прекратить прием препарата провести промывание желудка следует принять адсорбирующие средства провести 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 выраженном снижении АД - в/в введение плазмозамещающих растворов и вазопрессоров. При гипогликемии может быть показано в/в введение глюкагона или в/в введение декстрозы (глюкозы). 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 - в/в введение диуретиков препаратов с положительным инотропным эффектом а также вазодилататоров. При бронхоспазме - назначение бронходилататоров в т.ч. 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 #-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 #-адреноблокаторов может увеличить риск развития "рикошетной" артериальной гипертензии. Комбинации требующие осторожности Антиаритмические средства III класса (например амиодарон) могут усиливать нарушение AV проводимости. Действие #-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 препарата Бисопролол с #-адреномиметиками (например изопреналин добутамин) может приводить к снижению эффекта обоих препаратов. Сочетание бисопролола с адреномиметиками влияющими на #- и #-адренорецепторы (например норэпинефрин эпинефрин) может усиливать вазоконстрикторные эффекты этих средств возникающих с участием #-адренорецепторов приводя к повышению АД. Подобные взаимодействия более вероятны при применении неселективных #-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

Не следует резко прерывать лечение препаратом Бисопролол из-за опасности развития тяжелых аритмий и инфаркта миокарда. Отмену проводят постепенно снижая дозу на 25% каждые 3-4 дня. Контроль за состоянием пациентов принимающих Бисопролол должен включать измерение ЧСС и АД (в начале лечения - ежедневно затем - 1 раз в 3-4 мес) проведение ЭКГ определение концентрации глюкозы крови у пациентов с сахарным диабетом (1 раз в 4-5 мес). У пациентов пожилого 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. В случае выявления у пациентов пожилого возраста нарастающей брадикардии (ЧСС менее 50 уд/мин) выраженного снижения АД (систолическое АД менее 100 мм рт.ст.) AV-блокады необходимо уменьшить дозу или прекратить лечение. Перед началом лечения рекомендуется проводить исследование функции внешнего дыхания у больных с отягощенным бронхолегочным анамнезом. Пациентам пользующимся контактными линзами следует учитывать что на фоне лечения препаратом возможно уменьшение продукции слезной жидкости. При применении препарата Бисопролол у пациентов с феохромоцитомой имеется риск развития парадоксальной артериальной гипертензии (если предварительно не достигнута эффективная блокада альфа-адренорецепторов). При гипертиреозе бисопролол может маскировать определенные клинические признаки гипертиреоза (например тахикардию). Резкая отмена препарата у пациентов с гипертиреозом противопоказана поскольку способна усилить симптоматику. При сахарном диабете бисопролол 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 приеме клонидина его прием может быть прекращен только через несколько дней после отмены препарата Бисопролол. Возможно усиление выраженности реакции повышенной чувствительности и отсутствие эффекта от обычных доз эпинефрина (адреналина) на фоне отягощенного аллергологического анамнеза. В случае необходимости проведения хирургического вмешательства отмену препарата

проводят за 48 ч до начала проведения общей анестезии. Если пациент принял препарат перед хирургическим вмешательством ему следует подобрать препарат для общей анестезии с минимально отрицательным инотропным действием. 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 регулярным наблюдением врача на предмет выявления выраженного снижения АД или брадикардии. Пациентам с бронхоспастическими заболеваниями можно 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 препарата Бисопролол у таких пациентов возникает опасность развития бронхоспазма. Рекомендуется прекратить терапию препаратом Бисопролол при развитии депрессии. Следует отменять препарат перед исследованием концентрации в крови и моче катехоламинов норметанефрина ванилилминдальной кислоты титров антинуклеарных антител. У курящих пациентов эффективность бета-адреноблокаторов ниже. Влияние на способность управлять трансп. ср. и мех.: В период лечения препаратом Бисопролол необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятии другими потенциально опасными видами деятельности требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Условия хранения

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