

Состав

действующее вещество: бисопролол;

10 мг: 1 таблетка содержит бисопролола фумарата 10 мг;

вспомогательные вещества: лактоза, моногидрат; целлюлоза микрокристаллическая; кросповидон; магния стеарат; красители железа оксид желтый (E 172) и железа оксид красный (E 172).

Лекарственная форма

Таблетки.

Основные физико-химические свойства: 10 мг: таблетки круглой формы с двояковыпуклой поверхностью, с риской, коричневатого-розового цвета; на поверхности таблеток допускаются вкрапления.

Фармакотерапевтическая группа

Селективные блокаторы β -адренорецепторов. Бисопролол. Код АТХ С07А В07.

Фармакодинамика

Бисопролол – высокоселективный β_1 -адреноблокатор. При применении в терапевтических дозах не имеет внутренней симпатомиметической активности и клинически выраженных мембраностабилизирующих свойств. Оказывает антиангинальное и гипотензивное действие. Уменьшает потребность миокарда в кислороде благодаря уменьшению ЧСС и сердечного выброса, а также снижению артериального давления, увеличивает снабжение миокарда кислородом за счет уменьшения конечного диастолического давления и удлинения диастолы. Препарат имеет очень низкое сродство с β_2 -рецепторами гладкой мускулатуры бронхов и сосудов, а также с β_2 -рецепторами эндокринной системы.

Максимальный эффект бисопролола наступает через 3-4 часа после приема. Период полувыведения из плазмы крови составляет 10-12 часов, что приводит к 24-часовой эффективности после однократного приема. Максимальный антигипертензивный эффект достигается через 2 недели приема.

Фармакокинетика

Всасывание. После приема внутрь препарат хорошо абсорбируется из желудочно-кишечного тракта. Биодоступность составляет около 90% после

перорального применения и не зависит от приема пищи. Фармакокинетика бисопролола и концентрация в плазме крови линейные в диапазоне доз от 5 мг до 20 мг. Максимальная концентрация в плазме крови (C_{max}) достигается через 2-3 часа.

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.

Исследования *in vitro* с использованием микросом печени человека показали, что бисопролол метаболизируется при участии CYP3A4 (~ 95%), CYP2D6 играет лишь небольшую роль. Общий клиренс бисопролола составляет 15 л/час. Период полувыведения составляет 10-12 часов.

Показания

- артериальная гипертензия;
- ишемическая болезнь сердца (стенокардия);
- хроническая сердечная недостаточность с систолической дисфункцией левого желудочка, в комбинации с ингибиторами АПФ, диуретиками, в случае необходимости – с сердечными гликозидами.

Противопоказания

- острая сердечная недостаточность или сердечная недостаточность в состоянии декомпенсации, требующая инотропной терапии;
- кардиогенный шок;
- атриовентрикулярная блокада II и III степени (за исключением таковой у пациентов с искусственным водителем ритма);
- синдром слабости синусового узла;
- выраженная синоатриальная блокада;
- симптоматическая брадикардия;
- симптоматическая артериальная гипотензия;
- тяжелая форма бронхиальной астмы или тяжелые хронические обструктивные заболевания легких;
- поздние стадии нарушения периферического кровообращения или болезни Рейно;
- феохромоцитомы, которая не лечилась;
- метаболический ацидоз;

- повышенная чувствительность к бисопрололу или к другим компонентам препарата.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Комбинации, которые не рекомендуется применять.

Лечение хронической сердечной недостаточности.

Антиаритмические средства I класса (например, хинидин, дизопирамид, лидокаин, фенитоин, флекаинид, пропafenон): возможно потенцирование эффекта относительно атриовентрикулярной проводимости и усиление отрицательного инотропного эффекта.

Все показания.

Антагонисты кальция (группы верапамила, в меньшей степени – дилтиазема): отрицательное влияние на сократительную функцию миокарда и атриовентрикулярную проводимость. Внутривенное введение верапамила у пациентов, принимающих β -блокаторы, может привести к выраженной артериальной гипотензии и атриовентрикулярной блокаде.

Гипотензивные препараты с центральным механизмом действия (клонидин, метилдопа, моксонидин, рилменидин): возможно ухудшение течения сердечной недостаточности в результате снижения центрального симпатического тонуса (снижение частоты сердечных сокращений и сердечного выброса, вазодилатация). Внезапная отмена препарата, особенно если ему предшествует отмена блокаторов β -адренорецепторов, может повысить риск возникновения рикошетной гипертензии.

Комбинации, которые следует применять с осторожностью.

Лечение артериальной гипертензии или ишемической болезни сердца (стенокардии).

Антиаритмические средства I класса (например, хинидин, дизопирамид, лидокаин, фенитоин, флекаинид, пропafenон): возможно потенцирование эффекта относительно атриовентрикулярной проводимости и усиления отрицательного инотропного эффекта.

Все показания.

Антагонисты кальция по типу дигидропиридинового ряда (например, нифедипин, фелодипин, амлодипин): возможно повышение риска возникновения

артериальной гипотензии. Не исключается возможность увеличения отрицательного влияния на инотропную функцию миокарда у пациентов с сердечной недостаточностью.

Антиаритмические препараты III класса (например, амиодарон): возможно потенцирование влияния на атриовентрикулярную проводимость.

β-блокаторы местного действия (например, которые содержатся в глазных каплях для лечения глаукомы): возможно усиление системных эффектов бисопролола.

Парасимпатомиметики: возможно увеличение времени атриовентрикулярной проводимости и повышение риска брадикардии.

Инсулин и пероральные гипогликемизирующие средства: усиление гипогликемического действия. Блокада β-адренорецепторов может маскировать симптомы гипогликемии.

Средства для анестезии: повышается риск угнетения функции миокарда и возникновения артериальной гипотензии (см. раздел «Особенности применения»).

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

Нестероидные противовоспалительные средства (НПВС): возможно ослабление гипотензивного эффекта бисопролола.

β-симпатомиметики (например, орципреналин, изопреналин, добутамин): применение в комбинации с препаратом Бисопролол-КВ может привести к снижению терапевтического эффекта обоих средств. Для лечения аллергических реакций могут потребоваться высшие дозы адреналина.

Симпатомиметики, активирующие α- и β-адренорецепторы (например, адреналин, норадреналин): возможно проявление опосредованного из-за α-адренорецептора сосудосуживающего эффекта, что приводит к повышению артериального давления и усилению перемежающейся хромоты. Подобное взаимодействие более вероятно при применении неселективных β-блокаторов.

При совместном применении с антигипертензивными средствами и средствами, проявляющими гипотензивный эффект (например, трициклические антидепрессанты, барбитураты, фенотиазин) возможно повышение риска артериальной гипотензии.

Возможные комбинации.

Мефлохин: возможно повышение риска развития брадикардии.

Ингибиторы МАО (за исключением ингибиторов МАО типа В): повышение гипотензивного эффекта β -блокаторов, но есть риск развития гипертонического криза.

Особенности применения

Лечение стабильной хронической сердечной недостаточности с применением бисопролола следует начинать с фазы титрования.

Пациентам с ишемической болезнью сердца лечение не следует прекращать внезапно без крайней необходимости, потому что это может привести к транзиторному ухудшению состояния. Инициирование и прекращение лечения бисопрололом требует регулярного мониторинга.

На сегодня нет достаточного терапевтического опыта лечения сердечной недостаточности у пациентов со следующими заболеваниями и патологическими состояниями: сахарный диабет I типа (инсулинозависимый), тяжелые нарушения функции почек, тяжелые нарушения функции печени, рестриктивная кардиомиопатия, врожденные пороки сердца, гемодинамически значимые приобретенные клапанные пороки сердца, инфаркт миокарда на протяжении последних 3 месяцев.

Препарат следует применять с осторожностью пациентам при таких состояниях:

- бронхоспазм (при бронхиальной астме, обструктивных заболеваниях дыхательных путей);
- сахарный диабет со значительными колебаниями уровня глюкозы в крови, при этом симптомы гипогликемии (тахикардия, сердцебиение, потливость) могут быть скрытыми;
- строгая диета;
- проведение десенсибилизирующей терапии. Как и другие β -блокаторы, бисопролол может усиливать чувствительность к аллергенам и увеличивать тяжесть анафилактических реакций. В таких случаях лечение адреналином не всегда дает положительный терапевтический эффект;
- атриовентрикулярная блокада I степени;
- стенокардия Принцметала;
- облитерирующие заболевания периферических артерий (в начале терапии возможно усиление жалоб);
- общая анестезия.

У пациентов, которым планируется общая анестезия, применение β -блокаторов снижает случаи аритмии и ишемии миокарда на протяжении введения в наркоз, интубации и послеоперационного периода. Рекомендуется продолжать применение β -блокаторов во время периоперационного периода. Необходимо обязательно предупредить врача-анестезиолога о приеме блокаторов β -адренорецепторов, так как врач должен учитывать потенциальное взаимодействие с другими лекарствами, которое может привести к брадиаритмии, рефлекторной тахикардии и снижению возможностей рефлекторного механизма компенсации кровопотери. В случае отмены бисопролола перед оперативными вмешательствами дозу следует постепенно снизить и прекратить прием препарата за 48 часов до общей анестезии.

Комбинации бисопролола с антагонистами кальция группы верапамила или дилтиазема, с антиаритмическими препаратами I класса и с гипотензивными средствами центрального действия не рекомендуются (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»).

Несмотря на то, что кардиоселективные β -блокаторы (β_1) меньше влияют на функцию легких по сравнению с неселективными β -блокаторами, следует избегать их применение, как и всех β -блокаторов, при обструктивных заболеваниях дыхательных путей, если нет весомых причин для проведения терапии. В случае необходимости препарат Бисопролол-КВ следует применять с осторожностью. У пациентов с обструктивными заболеваниями дыхательных путей лечение бисопрололом следует начинать с наиболее низкой возможной дозы и следует следить за состоянием пациентов относительно возникновения новых симптомов (таких как, одышка, непереносимость физических нагрузок, кашель).

При бронхиальной астме или других хронических обструктивных заболеваниях легких, которые могут вызывать симптомы, показана сопутствующая терапия бронходилататорами. В некоторых случаях на фоне приема препарата пациенты с бронхиальной астмой из-за повышения резистентности дыхательных путей могут потребовать более высоких доз β_2 -симпатомиметиков.

Больным псориазом (в т. ч. в анамнезе) β -блокаторы (например, бисопролол) назначают после тщательного соотношения польза/риск.

Пациентам с феохромоцитомой назначают препарат только после назначения терапии α -адреноблокаторами. Симптомы тиреотоксикоза могут быть замаскированы на фоне приема препарата.

При применении препарата Бисопролол-КВ может отмечаться положительный результат при проведении допинг-контроля.

Препарат содержит лактозу, поэтому его не следует назначать пациентам с редкими наследственными формами непереносимости галактозы, дефицитом лактазы или синдромом глюкозо-галактозной мальабсорбции.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

В индивидуальных случаях препарат может влиять на способность управлять автотранспортом или работать со сложными механизмами. Особенное внимание необходимо уделять в начале лечения, при изменении дозы препарата или при взаимодействии с алкоголем.

Применение в период беременности или кормления грудью

Беременность. Бисопролол имеет фармакологические свойства, которые могут вызвать вредное воздействие на течение беременности и/или развитие плода/новорожденного. Как правило, β -адреноблокаторы уменьшают плацентарный кровоток, что может вызвать задержку внутриутробного развития, внутриутробную смерть, непроизвольный аборт или преждевременные роды. Могут развиваться побочные эффекты у плода и новорожденного (например, гипогликемия, брадикардия). Если лечение β -блокаторами необходимо, желательно, чтобы это был β_1 -селективный адреноблокатор.

В период беременности препарат применяют только тогда, когда ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода. Необходимо контролировать маточно-плацентарный кровоток и увеличение плода. В случае вредного влияния на протекание беременности или плод следует рассмотреть возможность альтернативного лечения.

После родов новорожденный должен находиться под тщательным наблюдением. Симптомы гипогликемии и брадикардии можно ожидать на протяжении первых 3 суток.

Период кормления грудью. Данных относительно экскреции бисопролола в грудное молоко нет, поэтому не рекомендуется применять препарат во время кормления грудью.

Способ применения и дозы

Таблетки следует принимать не разжевывая, утром, натощак или во время завтрака, запивая небольшим количеством жидкости.

Артериальная гипертензия; ишемическая болезнь сердца (стенокардия)

Рекомендованная доза составляет 5 мг (1 таблетка препарата Бисопролол-КВ 5 мг) в сутки. В случае умеренной гипертензии (диастолическое давление до 105 мм рт.ст.) приемлемой является дозировка 2,5 мг (½ таблетки 5 мг).

При необходимости суточная доза может быть повышена до 10 мг (1 таблетка препарата Бисопролол-КВ 10 мг) в сутки. Максимальная рекомендованная доза составляет 20 мг в сутки.

Изменение и корректировка дозы устанавливается врачом индивидуально, в зависимости от состояния пациента.

Бисопролол-КВ обязательно применять с осторожностью пациентам с артериальной гипертензией или ишемической болезнью сердца, сопровождающейся сердечной недостаточностью.

Хроническая сердечная недостаточность с систолической дисфункцией левого желудочка, в комбинации с ингибиторами АПФ, диуретиками, при необходимости – сердечными гликозидами

Стандартная терапия хронической сердечной недостаточности: ингибиторы АПФ (или блокаторы ангиотензиновых рецепторов в случае непереносимости ингибиторов АПФ), блокаторы β-адренорецепторов, диуретики и, при необходимости, сердечные гликозиды.

Бисопролол-КВ назначать для лечения пациентов с хронической сердечной недостаточностью без признаков обострения.

Лечение хронической сердечной недостаточности препаратом Бисопролол-КВ следует начинать согласно представленной ниже схеме титрования и можно корректировать в зависимости от индивидуальных реакций организма.

- 1,25 мг** бисопролола фумарата 1 раз в сутки в течение 1 недели, повышая до
- 2,5 мг* бисопролола фумарата (½ таблетки 5 мг) 1 раз в сутки в течение следующей 1 недели, повышая до
- 3,75 мг** бисопролола фумарата 1 раз в сутки в течение следующей 1 недели, повышая до
- 5 мг бисопролола фумарата 1 раз в сутки в течение следующих 4-х недель, повышая до

- 7,5 мг бисопролола фумарата (1 ½ таблетки 5 мг) 1 раз в сутки в течение следующих 4-х недель, повышая до
- 10 мг бисопролола фумарата (1 таблетка 10 мг или 2 таблетки 5 мг) 1 раз в сутки в качестве поддерживающей терапии.

* В начале терапии хронической сердечной недостаточности рекомендуется применять препарат в дозировке 2,5 мг;

** Применять в соответствующей дозировке.

Максимальная рекомендованная доза бисопролола фумарата составляет 10 мг 1 раз в сутки.

В начале лечения стойкой хронической сердечной недостаточности необходимо проводить регулярный мониторинг. В течение фазы титрования необходим контроль показателей жизнедеятельности (артериальное давление, частота сердечных сокращений) и симптомов прогрессирования сердечной недостаточности.

Модификация лечения

Если во время фазы титрования или после нее наблюдается ухудшение сердечной недостаточности, развивается артериальная гипотензия или брадикардия, рекомендуется коррекция дозы препарата, что может потребовать временного снижения дозы бисопролола или, возможно, приостановления лечения. После стабилизации состояния пациента лечение препаратом можно продолжать.

Курс лечения препаратом Бисопролол-КВ длительный.

Не следует прекращать лечение внезапно и изменять рекомендованную дозу без консультации с врачом, поскольку это может привести к ухудшению состояния пациента. В случае необходимости лечение препаратом следует завершать медленно, постепенно снижая дозу.

Пациенты с печеночной и почечной недостаточностью

Артериальная гипертензия; ишемическая болезнь сердца. Для пациентов с нарушением функций печени или почек легкой и средней степени тяжести подбор дозы обычно делать не нужно. Для пациентов с тяжелой формой почечной недостаточности (клиренс креатинина менее 20 мл/мин) и пациентов с тяжелой формой печеночной недостаточности суточная доза не должна превышать 10 мг бисопролола.

Хроническая сердечная недостаточность. Нет данных относительно фармакокинетики бисопролола у пациентов с хронической сердечной

недостаточностью одновременно с нарушениями функции печени и/или почек, поэтому увеличивать дозу необходимо с осторожностью.

Пациенты пожилого возраста не нуждаются в коррекции дозы.

Дети

Клинические данные относительно эффективности и безопасности применения препарата для лечения детей отсутствуют, поэтому не следует применять препарат этой категории пациентов.

Передозировка

Симптомы. При передозировке (например, применение суточной дозы 15 мг вместо 7,5 мг) были зафиксированы случаи развития атриовентрикулярной блокады III степени, брадикардии и головокружения. Наиболее частыми признаками передозировки β -блокаторами являются брадикардия, артериальная гипотензия, острая сердечная недостаточность, гипогликемия и бронхоспазм. В настоящее время известно несколько случаев передозировки у пациентов с артериальной гипертензией и/или ишемической болезнью сердца (максимальная доза – 2000 мг бисопролола). Отмечались брадикардия и/или артериальная гипотензия. Все пациенты выздоровели. Существует широкая вариабельность индивидуальной чувствительности к однократной высокой дозе бисопролола, пациенты с сердечной недостаточностью могут быть более чувствительны к препарату. Поэтому лечение следует начинать с постепенным увеличением доз (см. раздел «Способ применения и дозы»).

Лечение. При передозировке прекращают лечение препаратом и проводят поддерживающую и симптоматическую терапию. Есть ограниченные данные, что бисопролол тяжело поддается диализу. При подозрении на передозировку в соответствии с ожидаемым фармакологическим действием и основываясь на рекомендациях для других β -блокаторов следует рассмотреть нижеперечисленные общие мероприятия.

При брадикардии: внутривенное введение атропина. Если реакция отсутствует, с осторожностью вводят изопrenalин или другой препарат с положительным хронотропным эффектом. В исключительных случаях может потребоваться трансвенозное введение искусственного водителя ритма.

При артериальной гипотензии: внутривенное введение жидкости и сосудосуживающих препаратов. Внутривенное введение глюкагона может быть полезным.

При атриовентрикулярной блокаде II и III степени: тщательное наблюдение и инфузионное введение изопреналина или трансвенное введение кардиостимулятора.

При обострении хронической сердечной недостаточности: внутривенное введение диуретических средств, инотропных препаратов, вазодилататоров.

При бронхоспазме: бронхолитические препараты (например, изопреналин), β_2 -адреномиметики и/или аминофиллин.

При гипогликемии: внутривенное введение глюкозы.

Побочные реакции

Со стороны сердца: брадикардия (у пациентов с хронической сердечной недостаточностью, у пациентов с артериальной гипертензией или ишемической болезнью сердца), признаки ухудшения сердечной недостаточности (у пациентов с хронической сердечной недостаточностью, с артериальной гипертензией или ишемической болезнью сердца), нарушение атриовентрикулярной проводимости.

Со стороны нервной системы: головокружение*, головная боль*, синкопе.

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

Со стороны органов слуха: ухудшение слуха.

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

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

Со стороны кожи и соединительных тканей: реакции гиперчувствительности, включая зуд, покраснение, сыпь, алопеция. При лечении β -блокаторами может наблюдаться ухудшение состояния больных псориазом в виде псориазических высыпаний.

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

Со стороны печени: гепатит.

Со стороны сосудистой системы: ощущение холода или онемения в конечностях, артериальная гипотензия (у пациентов с хронической сердечной недостаточностью, с артериальной гипертензией или ишемической болезнью

сердца), ортостатическая гипотензия (у пациентов с хронической сердечной недостаточностью).

Со стороны репродуктивной системы: нарушение потенции.

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

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

Общие расстройства: астения (у пациентов с хронической сердечной недостаточностью, с артериальной гипертензией или ишемической болезнью сердца), утомляемость*.

*Касается только пациентов с артериальной гипертензией или ишемической болезнью сердца. Эти симптомы обычно возникают в начале терапии, слабо выражены и исчезают в течение первых 1-2 недель.

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

Срок годности

3 года.

Условия хранения

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

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 10 таблеток в блистере, по 3 блистера в пачке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

ПАО «Киевский витаминный завод».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

04073, Украина, г. Киев, ул. Копыловская, 38.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).