

Состав

действующее вещество: бисопролол;

1 таблетка содержит бисопролола фумарата в пересчете на 100% вещество 2,5 мг;

вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, кальция гидрофосфат, кросповидон, кремния диоксид коллоидный безводный, магния стеарат.

Лекарственная форма

Таблетки.

Основные физико-химические свойства: таблетки белого цвета, круглой формы с двояковыпуклой поверхностью, с наческой или без насечки. На поверхности таблеток допускается мраморность.

Фармакотерапевтическая группа

Селективные блокаторы β -адренорецепторов. Код АТХ С07А В07.

Фармакодинамика

Бисопролол – высокоселективный β 1-адреноблокатор. При применении в терапевтических дозах нет внутренней симпатомиметической активности и клинически выраженных мембраностабилизирующих свойств. Оказывает антиангинальное и гипотензивное действие. Уменьшает потребность миокарда в кислороде благодаря уменьшению частоты сердечных сокращений (ЧСС), уменьшению сердечного выброса и снижению АД, увеличивает снабжение миокарда кислородом за счет уменьшения конечного диастолического давления и удлинения диастолы. Препарат имеет очень низкое родство с β 2-рецепторами гладкой мускулатуры бронхов и сосудов, а также с β 2-рецепторами эндокринной системы. Препарат только в редких случаях может влиять на гладкую мускулатуру бронхов и периферических артерий, а также на метаболизм глюкозы.

Фармакокинетика

Абсорбция. Биодоступность составляет около 90%.

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. Общий клиренс бисопролола составляет 15 л/ч. Благодаря длительному периоду полувыведения (10–12 ч) препарат сохраняет терапевтический эффект в течение 24 ч при применении один раз в сутки.

Линейность. Фармакокинетика бисопролола линейна, ее показатели не зависят от возраста.

Особые группы пациентов. Поскольку бисопролол выводится из организма почками и печенью в равной степени, у пациентов с нарушением функций печени или нарушением функций почек коррекция дозирования не требуется. Фармакокинетика у пациентов со стабильной хронической сердечной недостаточностью и нарушением функций печени или почек не изучалась. У пациентов с хронической сердечной недостаточностью III функционального класса (в NYHA) уровень бисопролола в плазме крови выше и период полувыведения пролонгирован по сравнению со здоровыми добровольцами. Максимальная концентрация в плазме крови в равновесном состоянии составляет 64 ± 21 нг/мл при суточной дозе 10 мг и периоде полувыведения 17 ± 5 часов.

Показания

Лечение хронической сердечной недостаточности с систолической дисфункцией левого желудочка в комбинации с ингибиторами АПФ, диуретиками, при необходимости – сердечными гликозидами.

Противопоказания

- Острая сердечная недостаточность или сердечная недостаточность в стадии декомпенсации, требующей внутривенной инотропной терапии;
- кардиогенный шок;
- атриовентрикулярная блокада II и III степени;
- синдром слабости синусового узла;
- синоатриальная блокада;
- симптоматическая брадикардия;
- симптоматическая артериальная гипотензия;
- тяжелая форма бронхиальной астмы;

- поздние стадии нарушения периферического кровообращения или болезни Рейно;
- феохромоцитома, которая не лечилась;
- метаболический ацидоз;
- повышенная чувствительность к бисопрололу или другим компонентам лекарственного средства.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Комбинации, которые не рекомендуется использовать.

Антагонисты кальция (группы верапамила, в меньшей степени – дилтиазема): негативное влияние на сократительную функцию миокарда и атриовентрикулярную проводимость. Введение верапамила у пациентов с β -блокаторами может привести к выраженной гипотензии и атриовентрикулярной блокаде.

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

Гипотензивные препараты с центральным механизмом действия (клонидин, метилдопа, моксонидин, рилменидин): возможно ухудшение сердечной недостаточности вследствие снижения центрального симпатического тонуса (снижение частоты сердечных сокращений и сердечного выброса, вазодилатация).

Внезапная отмена препарата, особенно если предшествует отмена блокаторов β -адренорецепторов, может повысить риск возникновения рикошетной гипертензии.

Комбинации, которые следует применять с осторожностью.

Антагонисты кальция дигидропиридинового ряда (например, фелодипин, амлодипин): возможно повышение риска артериальной гипотензии. Не исключается возможность отрицательного воздействия на инотропную функцию миокарда у пациентов с сердечной недостаточностью.

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

β -блокаторы местного действия (например, содержащиеся 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 анестезии: ослабление рефлекторной тахикардии и повышение риска артериальной гипотензии.

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

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

β -симпатомиметики (например, изопреналин, добутамин): возможно снижение терапевтического эффекта обоих средств.

Симпатомиметики, активирующие α и β -адренорецепторы (например, адреналин, норадреналин): возможно проявление опосредованного через α -адренорецепторы 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, обладающими гипотензивным действием (например, трициклические антидепрессанты, барбитураты, фенотиазин), возможно повышение риска артериальной гипотензии.

Возможные комбинации.

Мефлохин: возможное повышение риска развития брадикардии.

Ингибиторы MAO (за исключением ингибиторов MAO типа B): 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, так как это может привести к транзиторному ухудшению состояния. Инициирование и прекращение лечения бисопрололом требует регулярного мониторинга.

В настоящее время нет достаточного терапевтического опыта лечения хронической сердечной недостаточности у пациентов со следующими заболеваниями и патологическими состояниями: сахарный диабет I типа, тяжелые нарушения функций почек, тяжелые нарушения функций печени, рестриктивная кардиомиопатия, врожденные пороки сердца, гемодинамически значимые клапаны. за последние 3 месяца.

Препарат следует применять с осторожностью пациентам при следующих состояниях:

- бронхоспазм (при бронхиальной астме, обструктивных заболеваниях дыхательных путей);
- сахарный диабет со значительными колебаниями уровня глюкозы в крови; симптомы гипогликемии могут быть скрыты; строгая диета;
- проведение десенсибилизационной 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.

Необходимо обязательно предупредить врача-анестезиолога о применении блокаторов β -адренорецепторов. У пациентов, которым планируется общая анестезия, применение β -блокаторов снижает случаи аритмии и ишемии миокарда при введении в наркоз, интубации и послеоперационного периода. Рекомендуются продолжать применение блокаторов бета во время периоперационного периода. Анестезиолог должен учитывать потенциальное взаимодействие с другими лекарствами, которое может привести к брадиаритмии, рефлекторной тахикардии и снижению возможностей рефлекторного механизма компенсации кровопотери. При отмене бисопролола перед оперативными вмешательствами дозу следует постепенно снизить и прекратить применение препарата за 48 часов до общей анестезии.

Комбинации бисопролола с антагонистами кальция 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) оказывают меньшее влияние на функцию легких по сравнению с неселективными β -блокаторами, следует избегать их применения, как и всех β -блокаторов, при обструктивных заболеваниях дыхательных путей, если нет веских причин для проведения терапии. При необходимости бисопролол следует применять с осторожностью. У пациентов с обструктивными заболеваниями дыхательных путей лечение бисопрололом следует начинать с самой низкой возможной дозы и наблюдать за пациентами по поводу возникновения новых симптомов (например, одышка, непереносимость физических нагрузок, кашель).

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

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

Пациентам с феохромоцитомой назначают бисопролол только после назначения α -адреноблокаторами.

Симптомы тиреотоксикоза могут быть маскированы на фоне применения бисопролола.

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

В ходе исследований пациентов с ишемической болезнью сердца лекарственное средство не влияло на способность управлять автомобилем.

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

Применение в период беременности или кормления грудью

Беременность. Бисопролол обладает фармакологическими свойствами, которые могут оказать вредное влияние на течение беременности и/или развитие плода/новорожденного. Как правило, β -адреноблокаторы уменьшают плацентарный кровоток, что может вызвать задержку внутриутробного развития, внутриутробную смерть, самопроизвольный 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 матери превышает потенциальный риск для плода. Необходимо контролировать маточно-плацентарный кровоток и рост плода. В случае вредного воздействия на течение беременности или плода следует рассмотреть возможность альтернативного лечения.

После родов новорожденный должен находиться под наблюдением. Симптомы гипогликемии и брадикардии можно ожидать в течение первых 3-х суток.

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

Способ применения и дозы

Препарат Бисопрол следует принимать не разжевывая, утром во время завтрака, запивая небольшим количеством жидкости.

Стандартная терапия хронической сердечной недостаточности: ингибиторы АПФ или антагонисты ангиотензина II, блокаторы β -адренорецепторов, диуретики и, при необходимости, сердечные гликозиды.

До начала лечения бисопрололом пациент не должен иметь признаков обострения. Возможно транзиторное ухудшение сердечной недостаточности, гипотензия или брадикардия в течение периода титрования и после него.

Период титрования дозы.

Лечение хронической сердечной недостаточности бисопрололом начинается в соответствии со следующей схемой титрования и может корректироваться в зависимости от индивидуальных реакций организма.

1,25 мг бисопролола фумарата 1 раз в сутки в течение 1 недели, если хорошо переносится, повысить до

2,5 мг бисопролола фумарата 1 раз в сутки в течение следующей недели, если хорошо переносится, повысить до

3,75 мг бисопролола фумарата 1 раз в сутки в течение следующей недели, если хорошо переносится, повысить до

5 мг бисопролола фумарата 1 раз в сутки в течение следующих 4 недель, если хорошо переносится, повысить до

7,5 мг бисопролола фумарата 1 раз в сутки в течение следующих 4 недель, если хорошо переносится, повысить до

10 мг бисопролола фумарата 1 раз в сутки как поддерживающая терапия.

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

В период титрования необходим тщательный надзор за показателями жизнедеятельности (артериальное давление, частота сердечных сокращений) и симптомами прогрессирования сердечной недостаточности. Симптомы могут развиваться с первого дня после начала лечения.

Модификация лечения.

Если максимальная рекомендуемая доза плохо переносится, возможно постепенное снижение дозы. Если во время титрования или после него наблюдается ухудшение сердечной недостаточности, развивается артериальная гипотензия или брадикардия, рекомендуется откорректировать дозировку препарата, что может потребовать временного снижения дозировки бисопролола или приостановления лечения. После стабилизации состояния пациента следует рассматривать возможность повторной инициации лечения бисопрололом.

Курс лечения стабильной хронической сердечной недостаточности бисопрололом длительный.

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

Пациенты с нарушением функций печени или почек.

Нет данных о фармакокинетике бисопролола у пациентов с хронической сердечной недостаточностью одновременно с нарушениями функций печени или почек, поэтому увеличивать дозу необходимо с особой осторожностью.

Пациенты пожилого возраста не нуждаются в корректировке дозы.

Дети

Клинические данные эффективности и безопасности применения препарата для лечения детей отсутствуют, поэтому бисопролол не рекомендуется применять в педиатрической практике.

Передозировка

Симптомы.

При передозировке (например, суточной дозе 15 мг вместо 7,5 мг) были зафиксированы случаи развития атриовентрикулярной блокады III степени, брадикардии и головокружения. Наиболее частыми признаками передозировки - блокаторами являются брадикардия, артериальная гипотензия, острая сердечная недостаточность, гипогликемия и бронхоспазм. В настоящее время известно несколько случаев передозировки (максимальная доза - 2000 мг) бисопролола. Отмечалась брадикардия или артериальная гипотензия. Все пациенты поправились. Есть 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 дозировки (см. Способ применения и дозы).

В случае передозировки необходимо немедленно обратиться к врачу.

Лечение.

При передозировке препарат прекращают 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 следующие общие мероприятия.

При брадикардии внутривенное введение атропина. Если отсутствует реакция, с осторожностью вводить изопреналин или другой препарат с положительным хронотропным эффектом. В исключительных случаях может потребоваться трансвенное введение искусственного водителя ритма.

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

При атриовентрикулярной блокаде II и III степени: тщательное наблюдение и инфузионное введение изопреналина или трансвенозное 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

Нежелательные эффекты по частоте возникновения классифицируют по следующим категориям:

очень часто ($>1/10$), часто ($>1/100$ и $<1/10$), нечасто ($>1/1000$ и $<1/100$), редко ($>1/10000$ и $<1/1000$), очень редко ($<1/10000$).

Со стороны сердечно-сосудистой системы.

Очень часто брадикардия.

Часто: ухудшение сердечной недостаточности, чувство холода или онемение конечностей, артериальная гипотензия.

Нечасто: нарушение атриовентрикулярной проводимости, брадикардия, ухудшение сердечной недостаточности, ортостатическая гипотензия, артериальная гипотензия.

Со стороны нервной системы.

Часто: головокружение*, головные боли*.

Редко: обморок.

Со стороны органов зрения.

Редко: снижение слезоотделения (следует учитывать при ношении контактных линз).

Очень редко: конъюнктивит.

Со стороны органов слуха.

Редко: ухудшение слуха.

Со стороны дыхательной системы.

Нечасто: бронхоспазм у пациентов с бронхиальной астмой или обструктивными заболеваниями дыхательных путей в анамнезе.

Редко: аллергический ринит.

Со стороны пищеварительного тракта.

Часто: тошнота, рвота, диарея, запор.

Со стороны кожи.

Редко: реакции гиперчувствительности (зуд, краснота, сыпь).

Очень редко: алопеция. При лечении β -блокаторами может наблюдаться ухудшение состояния больных псориазом в виде псориатической сыпи.

Со стороны костно-мышечной системы.

Нечасто: мышечная слабость, судороги.

Со стороны печени.

Редко гепатит.

Со стороны репродуктивной системы.

Редко: нарушение потенции.

Психические расстройства.

Нечасто: депрессия, нарушение сна.

Редко: ночные кошмары, галлюцинации.

Лабораторные характеристики.

Редко повышение уровня триглицеридов в крови, повышение активности печеночных ферментов в плазме крови (АСТ, АЛТ).

Общие расстройства.

Часто: астения, утомляемость*.

Нечасто: астения*.

* 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.

Срок годности

2 года.

Не применять препарат по истечении срока годности, указанного на упаковке.

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 5 блистеров в пачке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

АО «Фармак».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Украина, 04080, г. Киев, ул. Кирилловская, 74.

Источник инструкции

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