Арител



Код АТХ:

- C07AB07

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Бисопролол

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой светло-оранжевого цвета, круглые, двояковыпуклые; на поперечном разрезе видны 2 слоя.

	1 таб.
бисопролол (в форме фумарата)	5 мг
-"-	10 мг

Вспомогательные вещества: крахмал картофельный, повидон (коллидон-30), лактоза, целлюлоза микрокристаллическая, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат, гипромеллоза, макрогол (полиэтиленгликоль 400, 4000), титана диоксид, тальк, железа оксид желтый, железа оксид красный.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (5) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (10) - пачки картонные.
30 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Вегетотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Селективный бета$_1$-адреноблокатор. Не обладает собственной симпатомиметической активностью и клинически значимыми мембраностабилизирующими свойствами. Оказывает гипотензивное, антиаритмическое и антиангинальное действие. Снижает активность ренина плазмы, уменьшает потребность миокарда в кислороде, уменьшает ЧСС в покое и при нагрузке.

Блокируя в невысоких дозах β_1-адренорецепторы сердца, уменьшает стимулированное катехоламинами образование цАМФ из АТФ, снижает внутриклеточный ток ионов кальция, оказывает отрицательное хроно-, дромо-, батмо- и инотропное действие, угнетает проводимость и возбудимость, снижает сократимость миокарда.

ОПСС в начале применения препарата, в первые 24 ч, увеличивается (в результате реципрокного возрастания активности α-адренорецепторов и устранения стимуляции β_2-адренорецепторов), которое через 1-3 сут возвращается к исходному, а при длительном назначении снижается.

Гипотензивный эффект связан с уменьшением минутного объема крови, симпатической стимуляции периферических сосудов, снижением активности ренин-ангиотензиновой системы (имеет большое значение для пациентов с исходной гиперсекрецией ренина), восстановлением чувствительности в ответ на снижение АД и влиянием на ЦНС. При артериальной гипертензии эффект наступает через 2-5 дней, стабильное действие - через 1-2 мес.

Антиангинальный эффект обусловлен уменьшением потребности миокарда в кислороде в результате урежения ЧСС и снижения сократимости, удлинением диастолы, улучшением перфузии миокарда. За счет повышения конечного диастолического давления в левом желудочке и увеличения растяжения мышечных волокон желудочков может повышать потребность в кислороде, особенно у пациентов с хронической сердечной недостаточностью.

Антиаритмический эффект обусловлен устранением аритмогенных факторов (тахикардии, повышенной активности симпатической нервной системы, увеличенного содержания цАМФ, артериальной гипертензии), уменьшением скорости спонтанного возбуждения синусного и эктопического водителей ритма и замедлением AV-проведения (преимущественно в антеградном и, в меньшей степени, в ретроградном направлениях через AV-узел) и по дополнительным путям.

При применении в средних терапевтических дозах, в отличие от неселективных бета-адреноблокаторов, оказывает менее выраженное влияние на органы, содержащие β_2-адренорецепторы (поджелудочная железа, скелетные мышцы, гладкая мускулатура периферических артерий, бронхов и матки) и на углеводный обмен, не вызывает задержки ионов натрия в организме; выраженность атерогенного действия не отличается от действия пропранолола.

При применении в больших дозах (>200 мг) оказывает блокирующий эффект на оба подтипа β-адренорецепторов, главным образом, в бронхах и гладких мышцах сосудов.

Фармакокинетика

Всасывание

При приеме внутрь из ЖКТ всасывается 80-90% препарата; прием пищи не влияет на абсорбцию. C_{max} в плазме крови наблюдается через 1-3 ч.

Распределение

Связывание с белками плазмы крови около 30%. Проницаемость через ГЭБ и плацентарный барьер, секреция с грудным молоком - низкая.

Метаболизм

Бисопролол метаболизируется в печени.

Выведение

$T_{1/2}$ составляет10-12 ч. Выводится с мочой - 50% в неизменном виде, с желчью <2%.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия;

— профилактика приступов стенокардии при ИБС.

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Стенокардия

Противопоказания:

— шок (в т.ч. кардиогенный);

— коллапс;

— отек легких;

— острая сердечная недостаточность;

— хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации;

— AV-блокада II и III степени;

— синоатриальная блокада;

— СССУ;

— выраженная брадикардия;

— стенокардия Принцметала;

— кардиомегалия (без признаков сердечной недостаточности);

— артериальная гипотензия (систолическое АД<100 мм рт.ст., особенно при инфаркте миокарда);

— бронхиальная астма;

— ХОБЛ в анамнезе;

— одновременное применение ингибиторов МАО (за исключением МАО типа В);

— поздние стадии нарушения периферического кровообращения (болезнь Рейно);

— феохромоцитома (без одновременного использования альфа-адреноблокаторов);

— метаболический ацидоз;

— детский и подростковый возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены);

— повышенная чувствительность к компонентам препарата и другим бета-адреноблокаторам.

С *осторожностью* следует применять препарат при печеночной недостаточности, хронической почечной недостаточности, миастении, тиреотоксикозе, сахарном диабете, AV-блокаде I степени, депрессии (в т.ч. в анамнезе), псориазе, у пациентов пожилого возраста.

Способ применения и дозы:

Препарат следует принимать внутрь утром натощак, не разжевывая, в дозе 5 мг однократно. При необходимости доза может быть увеличена до 10 мг 1 раз/сут. Максимальная суточная доза - 20 мг/сут.

У пациентов с **нарушением функции почек (КК<20 мл/мин)** или с **выраженными нарушениями функции печени** максимальная суточная доза составляет 10 мг.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: повышенная утомляемость, слабость, головокружение, головная боль, нарушение сна, депрессия, беспокойство, спутанность сознания или кратковременная потеря памяти, галлюцинации, астения, миастения, парестезии в конечностях (у пациентов с перемежающейся хромотой и синдромом Рейно), тремор.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: синусовая брадикардия, сердцебиение, нарушение проводимости миокарда, AV-блокада (вплоть до развития полной поперечной блокады и остановки сердца), аритмии, ослабление сократимости миокарда, развитие (усугубление) хронической сердечной недостаточности (отечность лодыжек и стоп, одышка), снижение АД, ортостатическая гипотензия, проявление ангиоспазма (усиление нарушения

периферического кровообращения, похолодание нижних конечностей, синдром Рейно), боль в груди.

Со стороны пищеварительной системы: сухость слизистой оболочки полости рта, тошнота, рвота, боль в животе, запоры или диарея, нарушения функции печени (темная моча, желтушность склер и кожи, холестаз), изменения вкуса; изменение активности ферментов печени (повышение АЛТ, АСТ), уровня билирубина, триглицеридов.

Со стороны дыхательной системы: заложенность носа, затруднение дыхания при назначении в высоких дозах (утрата селективности) и/или у предрасположенных пациентов - ларингоспазм, бронхоспазм.

Со стороны эндокринной системы: гипергликемия (у пациентов с инсулиннезависимым сахарным диабетом), гипогликемия (у пациентов, получающих инсулин), гипотиреоидное состояние.

Со стороны органов чувств: нарушение зрения, уменьшение секреции слезной жидкости, сухость и боль в глазах, конъюнктивит.

Со стороны системы кроветворения: тромбоцитопения (необычные кровотечения и кровоизлияния), агранулоцитоз, лейкопения.

Дерматологические реакции: усиление потоотделения, гиперемия кожи, экзантема, псориазоподобные кожные реакции, обострение симптомов псориаза.

Аллергические реакции: кожный зуд, сыпь, крапивница.

Прочие: боль в спине, артралгия, ослабление либидо, снижение потенции, синдром отмены (усиление приступов стенокардии, повышение АД).

Передозировка:

Симптомы: аритмия, желудочковая экстрасистолия, выраженная брадикардия, AV-блокада, выраженное снижение АД, хроническая сердечная недостаточность, цианоз ногтей пальцев или ладоней, затруднение дыхания, бронхоспазм, головокружение, обморочные состояния, судороги.

Лечение: промывание желудка и назначение адсорбирующих лекарственных средств. Симптоматическая терапия: при развившейся AV-блокаде в/в 1-2 мг атропина, эпинефрина или постановка временного кардиостимулятора; при желудочковой экстрасистолии - лидокаин (препараты 1а класса не применяются); при снижении АД пациент должен находиться в положении Тренделенбурга, при отсутствии признаков отека легких - в/в плазмозамещающие растворы, при неэффективности - введение эпинефрина, допамина, добутамина (для поддержания хронотропного и инотропного действия и устранения выраженного снижения АД); при сердечной недостаточности - сердечные гликозиды, диуретики, глюкагон; при судорогах - в/в диазепам; при бронхоспазме — ингаляционно бета$_2$-адреностимуляторы.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение препарата при беременности и в период лактации возможно только в том случае, когда предполагаемая польза для матери превосходит потенциальный риск для плода.

При применении Арителa при беременности у плода возможны внутриутробная задержка роста, гипогликемия, брадикардия.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Аллергены, используемые для иммунотерапии, экстракты аллергенов для кожных проб повышают риск возникновения тяжелых системных аллергических реакций или анафилаксии у пациентов, получающих бисопролол.

Йодосодержащие рентгеноконтрастные лекарственные средства для в/в введения повышают риск развития анафилактических реакций.

Фенитоин при в/в введении, лекарственные средства для ингаляционной общей анестезии (производные углеводородов) повышают выраженность кардиодепрессивного действия и вероятность снижения АД.

Изменяет эффективность инсулина и пероральных гипогликемических лекарственных средств, маскирует симптомы развивающейся гипогликемии (тахикардию, повышение АД). Снижает клиренс лидокаина и ксантинов (кроме дифиллина) и повышает их концентрацию в плазме, особенно у пациентов с исходно повышенным клиренсом теофиллина под влиянием курения.

Гипотензивный эффект ослабляют НПВС (задержка натрия, блокада синтеза простагландина почками), ГКС и эстрогены (задержка натрия).

Сердечные гликозиды, метилдопа, резерпин, гуанфацин, блокаторы медленных кальциевых каналов (верапамил, дилтиазем), амиодарон и другие антиаритмические лекарственные средства повышают риск развития/усугубления брадикардии, AV-блокады, остановки сердца и сердечной недостаточности.

Нифедипин может приводить к значительному снижению АД.

Диуретики, клонидин, симпатолитики, гидралазин и другие гипотензивные лекарственные средства могут привести к чрезмерному снижению АД.

Удлиняет действие недеполяризующих миорелаксантов и антикоагулянтный эффект кумаринов.

Трициклические и тетрациклические антидепрессанты, антипсихотические лекарственные средства (нейролептики), этанол, седативные и снотворные лекарственные средства усиливают угнетение ЦНС.

Не рекомендуется одновременное применение с ингибиторами МАО вследствие значительного усиления гипотензивного действия, 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. Рифампицин укорачивает $T_{1/2}$ бисопролола.

Особые указания и меры предосторожности:

Контроль за пациентами, принимающими Арител, должен включать измерение ЧСС и АД (в начале лечения - ежедневно, затем 1 раз в 3-4 мес), проведение ЭКГ, определение содержания глюкозы в крови у пациентов с сахарным диабетом (1 раз в 4-5 мес). У пожилых пациентов 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<50 уд./мин.

Перед началом лечения рекомендуется проводить исследование функции внешнего дыхания у пациентов с отягощенным бронхолегочным анамнезом.

Примерно у 20% пациентов со стенокардией бета-адреноблокаторы неэффективны. Основные причины — тяжелый коронарный атеросклероз с низким порогом ишемии (ЧСС<100 уд./мин) и повышенный конечный диастолический объем левого желудочка, нарушающий субэндокардиальный кровоток.

При курении эффективность бета-адреноблокаторов ниже.

Пациентам, пользующиеся контактными линзами, следует 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 достигнута эффективная альфа-адреноблокада).

При тиреотоксикозе Арител может маскировать определенные клинические признаки тиреотоксикоза (например, тахикардию). Резкая отмена препарата у пациентов с тиреотоксикозом противопоказана, поскольку способна усилить симптоматику.

При сахарном диабете Арител 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 приеме клонидина его прием может быть прекращен только через несколько дней после отмены Арителя.

Возможно усиление выраженности реакции повышенной чувствительности и отсутствие эффекта от обычных доз эпинефрина на фоне отягощенного аллергологического анамнеза.

В случае необходимости проведения планового хирургического лечения отмену препарата проводят за 48 ч до начала общей анестезии. Если пациент принял препарат перед операцией, ему следует подобрать лекарственное средство для общей анестезии с минимальным 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 постоянным наблюдением врача на предмет выявления выраженного понижения АД или брадикардии.

Пациентам с бронхоспастическими заболеваниями можно назначать кардиоселективные адреноблокаторы в случае непереносимости и/или неэффективности других гипотензивных лекарственных средств. Передозировка опасна развитием бронхоспазма.

В случае выявления у пациентов пожилого возраста нарастающей брадикардии (ЧСС<50 уд./мин), выраженного понижения АД (систолическое АД<100 мм рт.ст.), AV-блокады, необходимо уменьшить дозу или прекратить лечение.

Рекомендуется прекратить терапию при развитии депрессии.

Нельзя резко прерывать лечение из-за опасности развития тяжелых аритмий и инфаркта миокарда. Отмену проводят постепенно, снижая дозу в течение 2 недель и более (снижают дозу на 25% в 3-4 дня). Следует отменять перед исследованием содержания в крови и моче катехоламинов, норметанефрина, ванилилминдальной кислоты и титров антинуклеарных антител.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

С осторожностью следует применять препарат при хронической почечной недостаточности.

При нарушениях функции печени

С осторожностью следует применять препарат при печеночной недостаточности.

Применение в пожилом возрасте

С *осторожностью* следует применять препарат у пациентов пожилого возраста.

Применение в детском возрасте

Противопоказание: детский и подростковый возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей, сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25°C.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Aritel