Бидоп



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 оболочкой светло-желтого цвета с желтоватыми вкраплениями, круглые, двояковыпуклые, с маркировкой "B1" по центру над риской и цифрой "5" ниже риски.

	1 таб.
бисопролола гемифумарат	5 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая, магния стеарат, кросповидон, пигмент марки РВ 22812 желтый (лактозы моногидрат 87%, железа оксид желтый 13%).

14 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые оболочкой светло-коричневого цвета с коричневатыми вкраплениями, круглые, двояковыпуклые, с маркировкой "B1" по центру над риской и цифрой "10" ниже риски.

	1 таб.
бисопролола гемифумарат	10 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая, магния стеарат, кросповидон, пигмент марки РВ 27215 бежевый (лактозы моногидрат 87%, железа оксид красный и желтый 13%).

14 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Вегетотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Селективный бета$_1$-адреноблокатор без внутренней симпатомиметической активности, не обладает мембраностабилизирующим действием. Снижает активность ренина плазмы, уменьшает потребность миокарда в кислороде, уменьшает ЧСС (в покое и при нагрузке). Оказывает гипотензивное, антиаритмическое и антиангинальное действие. 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.

При превышении терапевтической дозы оказывает бета$_2$-адреноблокирующее действие.

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

Гипотензивный эффект связан с уменьшением минутного объема крови, симпатической стимуляцией периферических сосудов, снижением активности ренин-ангиотензиновой системы (имеет большее значение для больных с исходной гиперсекрецией ренина), восстановлением чувствительности в ответ на снижение АД и влиянием на ЦНС. При артериальной гипертензии эффект развивается 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 больных 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-проводимости (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.

Фармакокинетика

Всасывание

Абсорбция - 80-90%, прием пищи не влияет на абсорбцию. C_{max} в плазме крови наблюдается через 1-3 ч.

Распределение

Связывание с белками плазмы крови - 26-33%.

Проницаемость через ГЭБ и плацентарный барьер - низкая.

Метаболизм и выведение

50% метаболизируется в печени с образованием неактивных метаболитов.

$T_{1/2}$ - 10-12 ч. Около 98% выводится почками, из них 50% в неизмененном виде, менее 2% с желчью.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия;

— ИБС: профилактика приступов стабильной стенокардии.

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, требующая проведения инотропной терапии;

— AV-блокада II и III степени без электростимулятора;

— синоатриальная блокада;

— СССУ;

— выраженная брадикардия (ЧСС менее 60 уд./мин);

— кардиомегалия (без признаков сердечной недостаточности);

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

— тяжелые формы бронхиальной астмы и ХОБЛ в анамнезе;

— одновременный прием ингибиторов МАО (за исключением МАО типа В);

— поздние стадии нарушения периферического кровообращения;

— болезнь Рейно;

— феохромоцитома (без одновременного использования альфа-адреноблокаторов);

— метаболический ацидоз;

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

— непереносимость лактозы, дефицит лактазы или синдром мальабсорбции глюкозы/галактозы (т.к в состав препарата входит лактоза);

— повышенная чувствительность к бисопрололу и другим бета-адреноблокаторам.

С *осторожностью* следует применять при печеночной недостаточности, хронической почечной недостаточности (КК менее 20 мл/мин), миастении, тиреотоксикозе, сахарном диабете, стенокардии Принцметала, AV-блокаде I степени, псориазе, депрессии (в т.ч. в анамнезе), аллергических реакциях в анамнезе, соблюдении строгой диеты, у пациентов пожилого возраста.

Способ применения и дозы:

Таблетки принимают внутрь, утром, натощак, не разжевывая, однократно. Дозу следует подбирать индивидуально.

При *артериальной гипертензии и ИБС (профилактика приступов стабильной стенокардии)* начальная доза составляет 5 мг 1 раз/сут. При необходимости дозу увеличивают до 10 мг 1 раз/сут. Максимальная суточная доза - 20 мг.

У **пациентов с нарушением функции почек при КК менее 20 мл/мин. или с выраженными нарушениями функции печени** максимальная суточная доза - 10 мг. Увеличение дозы у таких пациентов необходимо проводить с особой осторожностью.

Коррекции дозы у **пожилых пациентов** не требуется.

Побочное действие:

Побочные эффекты, наблюдаемые при применении препарата, классифицированы на категории в зависимости от частоты их возникновения: очень часто (≥ 1/10); часто (≥ 1/100, < 1/10); нечасто (≥ 1/1000, < 1/100); редко (≥ 1/10 000, < 1/1000); очень редко (< 1/10 000), включая отдельные сообщения.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: нечасто **-** повышенная утомляемость, слабость, астения, головокружение, головная боль, расстройства сна, депрессия, беспокойство, спутанность сознания или кратковременная потеря памяти; редко - галлюцинации, миастения, кошмарные сновидения, судороги (в т.ч. в икроножных мышцах), парестезии в конечностях (у больных с перемежающейся хромотой и синдромом Рейно), тремор.

Со стороны органов чувств: редко **-** нарушение зрения, уменьшение секреции слезной жидкости, сухость и болезненность глаз; очень редко - конъюнктивит.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: очень часто **-** синусовая брадикардия, сердцебиение; часто - выраженное снижение АД, проявление ангиоспазма (усиление нарушения периферического кровообращения, похолодание нижних конечностей, синдром Рейно); нечасто - ортостатическая гипотензия, нарушение проводимости миокарда, AV-блокада (вплоть до развития полной поперечной блокады и остановки сердца), аритмии, ослабление сократимости миокарда, развитие хронической сердечной недостаточности (отечность лодыжек, стоп; одышка), боль в груди.

Со стороны пищеварительной системы: часто **-** сухость слизистой оболочки полости рта, тошнота, рвота, боль в животе, запор или диарея; редко - нарушения функции печени (темная моча, желтушность склер или кожи, холестаз), изменения вкуса, гепатит, повышение активности ферментов печени (АСТ, АЛТ), гипербилирубинемия, гипертриглицеридемия.

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

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

Аллергические реакции: редко **-** кожный зуд, сыпь, крапивница.

Дерматологические реакции: редко - усиление потоотделения, гиперемия кожи; очень редко - экзантема, псориазоподобные кожные реакции, обострение симптомов псориаза, алопеция.

Со стороны системы кроветворения: в отдельных случаях **-** тромбоцитопения (необычные кровотечения и кровоизлияния), агранулоцитоз, лейкопения.

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

Влияние на плод: внутриутробная задержка роста, гипогликемия, брадикардия.

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, гипогликемия.

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 I А класса не применяются); при снижении АД - пациент должен находиться в положении Тренделенбурга; если нет 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 - бета$_2$-адреностимуляторы ингаляционно.

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 и ребенка.

Нет данных о том, проникает ли бисопролол в материнское молоко. При необходимости применения препарата в период лактации грудное вскармливание рекомендуется прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

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

Йодсодержащие 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 теофиллина) и повышает их концентрацию в плазме, особенно у больных с исходно повышенным клиренсом теофиллина под влиянием курения.

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

Сердечные гликозиды, метилдопа, резерпин и гуанфацин, блокаторы медленных кальциевых каналов (верапамил, дилтиазем), амиодарон и другие антиаритмические лекарственные 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 лекарственные средства могут привести к чрезмерному снижению АД.

Удлиняет действие недеполяризующих миорелаксантов и антикоагулянтный эффект кумаринов.

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

Не рекомендуется одновременное применение с ингибиторами МАО (за исключением МАО типа В), вследствие значительного усиления гипотензивного действия, перерыв в лечении между приемом ингибиторов МАО (за исключением МАО типа В) 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 $T_{1/2}$.

Особые указания и меры предосторожности:

Контроль за больными, принимающими бисопролол, должен включать измерение ЧСС и АД (в начале лечения - ежедневно, затем 1 раз в 3-4 мес), проведение ЭКГ, определение глюкозы крови у больных сахарным диабетом (1 раз в 4-5 мес). У пожилых пациентов рекомендуется следить за функцией 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.

Перед началом лечения рекомендуется проводить исследование функции внешнего дыхания у больных с отягощенным бронхо-легочным анамнезом.

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

У курящих пациентов эффективность бета-адреноблокаторов ниже.

Больные, пользующиеся контактными линзами, должны учитывать, что на фоне лечения возможно уменьшение продукции слезной жидкости.

При использовании у больных с феохромоцитомой имеется риск развития парадоксальной артериальной гипертензии (если предварительно не достигнута эффективная альфа-адреноблокада).

При тиреотоксикозе бисопролол может замаскировать определенные клинические признаки тиреотоксикоза (например, тахикардию). Резкая отмена у больных с тиреотоксикозом противопоказана, поскольку способна усилить симптомы.

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 уровня.

При одновременном приеме 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 на фоне отягощенного аллергологического анамнеза.

В случае необходимости проведения планового хирургического лечения отмену препарата проводят за 48 ч до начала общей анестезии. Если больной 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 больные, принимающие такие сочетания лекарственных средств, должны находиться под постоянным наблюдением врача на предмет выявления выраженного понижения АД или брадикардии.

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

В случае появления у больных пожилого возраста нарастающей брадикардии (менее 50 уд./мин), выраженного понижения АД (систолическое АД ниже 100 мм рт.ст.), AV-блокады, бронхоспазма, желудочковых аритмий, тяжелых нарушений функции печени и почек необходимо уменьшить дозу или прекратить лечение.

Рекомендуется прекращать 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 и ванилинминдальной кислоты; титров антинуклеарных антител.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения возможно головокружение, особенно в начале терапии, в связи с чем 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 при хронической почечной недостаточности.

Для пациентов с **нарушением функции почек при КК менее 20 мл/мин** максимальная суточная доза - 10 мг.

При нарушениях функции печени

С *осторожностью* следует применять при печеночной недостаточности.

Для пациентов с **нарушением функции печени** максимальная суточная доза - 10 мг.

Применение в пожилом возрасте

С *осторожностью* следует применять у пациентов пожилого возраста.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет.

Условия хранения:

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

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Bidop