Биол



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-желтого цвета, круглые, двояковыпуклые, с крестообразной риской на одной стороне и гравировкой "BIS 5" на другой; на изломе - белого цвета.

	1 таб.
бисопролола гемифумарат	5 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, кальция гидрофосфат, крахмал кукурузный, кроскармеллоза натрия, магния стеарат, кремния диоксид коллоидный безводный.

Состав пленочной оболочки: лактозы моногидрат, гипромеллоза, титана диоксид, макрогол-4000, краситель железа (III) оксид желтый.

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (5) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (10) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой желтого цвета, круглые, двояковыпуклые, с крестообразной риской на одной стороне и гравировкой "BIS 10" на другой; на изломе - белого цвета.

	1 таб.
бисопролола гемифумарат	10 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, кальция гидрофосфат, крахмал кукурузный, кроскармеллоза натрия, магния стеарат, кремния диоксид коллоидный безводный.

Состав пленочной оболочки: лактозы моногидрат, гипромеллоза, титана диоксид, макрогол-4000, краситель железа (III) оксид желтый, краситель железа (III) оксид красный.

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (5) - пачки картонные.

10 шт. - блистеры (10) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Вегетотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Бисопролол - селективный бета$_1$-адреноблокатор, без собственной симпатомиметической активности, не обладает мембраностабилизирующим действием. Как и для других бета$_1$-адреноблокаторов, механизм действия при артериальной гипертензии неясен. Вместе с тем, известно, что бисопролол снижает активность ренина в плазме крови, уменьшает потребность миокарда в кислороде, урежает ЧСС. 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, угнетает все функции сердца, снижает AV-проводимость и возбудимость. При превышении терапевтической дозы оказывает бета$_2$-адреноблокирующее действие. 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 значению, а при длительном применении - снижается.

Антигипертензивный эффект связан с уменьшением минутного объема крови, симпатической стимуляции периферических сосудов, снижением активности симпатоадреналовой системы (имеет большее 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 отмечается через 1-2 мес.

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

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

Бисопролол почти полностью всасывается из ЖКТ, прием пищи не влияет на абсорбцию. Биодоступность - около 90%. T_{max} в плазме крови - 2-4 ч после приема внутрь.

Распределение и метаболизм

Связывание с белками плазмы крови - 26-33%. Метаболизируется в печени, метаболиты бисопролола не обладают фармакологической активностью. Проницаемость через ГЭБ и плацентарный барьер низкая, в небольших количествах выделяется с грудным молоком.

Выведение

$T_{1/2}$ составляет 9-12 ч, что делает возможным применение препарата 1 раз/сут. Выводится почками (50% в неизмененном виде), менее 2% - через кишечник.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия;

— ИБС: профилактика приступов стабильной стенокардии;

— хроническая сердечная недостаточность (в составе комбинированной терапии).

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Сердечная недостаточность
- Стенокардия

Противопоказания:

— острая сердечная недостаточность и хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации, требующая проведения инотропной терапии;

— кардиогенный шок;

— коллапс;

— AV-блокада II и III степени (без кардиостимулятора);

— синоатриальная блокада;

— синдром слабости синусового узла;

— брадикардия (ЧСС до начала лечения менее 50 уд./мин);

— выраженная артериальная гипотензия (систолическое АД менее 90 мм рт. ст.);

— кардиомегалия (без признаков сердечной недостаточности);

— тяжелые формы бронхиальной астмы и ХОБЛ в анамнезе;

— выраженные 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);

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

С *осторожностью:*

— проведение десенсибилизирующей терапии;

— гипертиреоз;

— сахарный диабет 1 типа и сахарный диабет со значительными колебаниями концентрации глюкозы в крови;

— выраженная почечная недостаточность (КК менее 20 мл/мин);

— выраженные нарушения функции печени;

— псориаз;

— AV-блокада I степени;

— стенокардия Принцметала;

— рестриктивная кардиомиопатия;

— врожденные пороки сердца или порок клапана сердца с выраженными гемодинамическими нарушениями;

— хроническая сердечная недостаточность с инфарктом миокарда в течение последних 3 месяцев;

— депрессия (в т.ч. в анамнезе);

— феохромоцитома (обязательно одновременное использование альфа-адреноблокаторов);

— строгая диета.

Способ применения и дозы:

Препарат Биол принимают внутрь, утром натощак, 1 раз/сути с небольшим количеством жидкости, утром до завтрака, во время или после него. Таблетки не следует разжевывать или растирать в порошок.

Во всех случаях режим приема и дозу подбирает врач каждому пациенту индивидуально, в частности, учитывая ЧСС и состояние пациента.

Артериальная гипертензия и ИБС

При артериальной гипертензии и ИБС препарат Биол применяют по 5 мг 1 раз/сут. При необходимости дозу увеличивают до 10 мг 1 раз/сут.

При лечении артериальной гипертензии и стенокардии максимальная суточная доза составляет 20 мг 1 раз/сут.

Хроническая сердечная недостаточность (ХСН)

Начало лечения ХСН препаратом Биол требует обязательного проведения специальной фазы титрования и регулярного врачебного контроля.

Предварительным условием для лечения препаратом Биол является стабильная ХСН без признаков обострения. Лечение ХСН препаратом Биол начинается в соответствии со следующей схемой титрования. При этом может потребоваться индивидуальная адаптация в зависимости от того, насколько хорошо пациент переносит назначенную дозу, т.е. дозу можно увеличивать только в том случае, если предыдущая доза хорошо переносилась.

Для обеспечения соответствующего процесса титрования на начальных стадиях лечения рекомендуется применять препарат в меньших дозах.

Рекомендуемая начальная доза составляет 1.25 мг (1/4 таб. по 5 мг) 1 раз/сут. В зависимости от индивидуальной переносимости дозу следует постепенно повышать до 2.5 мг (1/2 таб. по 5 мг), 3.75 мг (3/4 таб. по 5 мг), 5 мг (1 таб. по 5 мг или 1/2 таб. по 10 мг), 7.5 мг (3/4 таб. по 10 мг) и 10 мг 1 раз/сут с интервалом не менее 2-х или более недель. Если увеличение дозы препарата плохо переносится пациентом, возможно снижение дозы.

Максимальная суточная доза при лечении ХСН составляет 10 мг 1 раз/сут.

Во время титрования рекомендуется регулярный контроль АД, ЧСС и симптомов нарастания выраженности ХСН. Усугубление симптомов ХСН возможно уже с первого дня применения препарата.

Во время фазы титрования или после нее может возникнуть временное ухудшение течения ХСН, артериальная гипотензия или брадикардия. В этом случае рекомендуется, прежде всего, обратить внимание на подбор дозы сопутствующей стандартной терапии. Также может потребоваться временное снижение дозы препарата Биол по 5 мг или отмена лечения.

После стабилизации состояния пациента следует провести повторное титрование дозы, либо продолжить лечение.

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 больных должно осуществляться с особой осторожностью.

Пациентам пожилого возраста коррекции дозы не требуется.

К настоящему времени недостаточно данных относительно применения препарата Биол по 5 мг у пациентов с ХСН, сопряженной с сахарным диабетом 1 типа, выраженными нарушениями функции почек и/или печени, рестриктивной кардиомиопатией, врожденными пороками сердца или гемодинамически обусловленным пороком сердца. Также до сих пор не было получено достаточных данных относительно пациентов с ХСН с инфарктом миокарда в течение последних 3 месяцев.

Побочное действие:

Частота побочных реакций, приведенных ниже, определялась соответственно следующему (классификация ВОЗ): очень часто (≥ 10%); часто (≥1%, но <10%); нечасто (≥ 0.1%, но <1%); редко (≥ 0.01%, но < 0.1%); очень редко (< 0.01%, 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 (АЛТ, АСТ), повышение концентрации билирубина, изменение вкуса.

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).

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. бета$_2$-адреномиметиков и/или аминофиллина.

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 Биол 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 Биол 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 Биол не рекомендуется женщинам в период кормления грудью. При необходимости применения препарата в период лактации, грудное вскармливание необходимо прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Антиаритмические средства I класса (например, хинидин, дизопирамид, лидокаин, фенитоин, флекаинид, пропафенон) при одновременном применении с бисопрололом могут снижать AV-проводимость и сократительную способность миокарда.

Антиаритмические средства III класса (например, амиодарон) могут усиливать нарушение AV-проводимости.

Действие бета-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 Биол с бета-адреномиметиками (например, изопреналин, добутамин) может приводить к снижению эффекта обоих препаратов.

Сочетание бисопролола с адреномиметиками, влияющими на бета- и альфа-адренорецепторы (например, норэпинефрин, эпинефрин), может усиливать вазоконстрикторные эффекты этих средств, возникающих с участием α-адренорецепторов, приводя к повышению АД. Подобные взаимодействия более вероятны при применении неселективных бета-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.

Йодсодержащие рентгеноконтрастные диагностические средства для в/в введения повышают риск развития анафилактических реакций.

Фенитоин при в/в 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.

Гипотензивный эффект ослабляют НПВП (задержка ионов натрия и блокада синтеза простагландинов почками), ГКС 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 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 крови.

Рифампицин укорачивает $T_{1/2}$ бисопролола.

Особые указания и меры предосторожности:

Не следует резко прерывать лечение препаратом Биол 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 препарат Биол, 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 Биол 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 уровня.

При одновременном приеме клонидина его прием может быть прекращен только через несколько дней после отмены препарата Биол.

Возможно усиление выраженности реакции повышенной чувствительности и отсутствие эффекта от обычных доз эпинефрина 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.

Рецепрокную 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 контролем 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 Биол у таких пациентов возникает опасность развития бронхоспазма.

В случае выявления у пациентов 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.

Рекомендуется прекратить терапию препаратом Биол при развитии депрессии.

Нельзя резко прерывать лечение из-за опасности развития тяжелых аритмий и инфаркта миокарда. Отмену препарата проводят постепенно, снижая дозу в течение 2 недель и более (снижают дозу на 25% в 3-4 дня).

Следует отменять препарат перед исследованием концентрации в крови и моче катехоламинов, норметанефрина, ванилинминдальной кислоты, титров антинуклеарных антител.

У курящих пациентов эффективность бета-адреноблокаторов ниже.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения препаратом Биол необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

С осторожностью назначают препарат при почечной недостаточности. У **пациентов с тяжелой почечной недостаточностью (КК менее 20 мл/мин) или с выраженными нарушениями функции печени** максимальная суточная доза не должна превышать 10 мг.

При нарушениях функции печени

С осторожностью назначают препарат при печеночной недостаточности.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°С. Не использовать после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Срок годности:

4 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Biol