Бипрол



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 желтого цвета, двояковыпуклые; на поперечном разрезе видны два слоя, внутренний слой белого или белого с едва заметным кремоватым оттенком цвета.

	1 таб.
бисопролола фумарат	5 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, лудипресс, крахмал кукурузный, кремния диоксид коллоидный (аэросил), коллидон CL (кросповидон), магния стеарат.

Состав оболочки: титана диоксид, макрогол (полиэтиленгликоль) 4000, гидроксипропилметилцеллюлоза (гипромеллоза), тальк, тропеолин О.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (5) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (10) - пачки картонные.
100 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые оболочкой темно-желтого цвета, двояковыпуклые; на поперечном разрезе видны два слоя, внутренний слой белого или белого с едва заметным кремоватым оттенком цвета.

	1 таб.
бисопролола фумарат	10 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, лудипресс, крахмал кукурузный, кремния диоксид коллоидный (аэросил), коллидон CL (кросповидон), магния стеарат.

Состав оболочки: титана диоксид, макрогол (полиэтиленгликоль) 4000, гидроксипропилметилцеллюлоза (гипромеллоза), тальк, тропеолин О.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (5) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (10) - пачки картонные.
100 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Вегетотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Селективный бета$_1$-адреноблокатор без внутренней симпатомиметической активности, не обладает мембраностабилизирующими свойствами.

Снижает активность ренина плазмы, уменьшает потребность миокарда в кислороде, уменьшает ЧСС в покое и при нагрузке. Оказывает гипотензивное, антиаритмическое и антиангинальное действие. При применении в невысоких дозах блокирует 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.

При применении в высоких дозах 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), затем через 1-3 сут возвращается к исходному, а при длительном применении препарата - снижается.

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

Антиангинальный эффект обусловлен уменьшением потребности миокарда в кислороде в результате уменьшения 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 миокарда 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 синусового и эктопических 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 высоких дозах (200 мг и более) оказывает блокирующий эффект на оба подтипа β-адренорецепторов, главным образом, в бронхах и гладких мышцах сосудов.

Фармакокинетика

Всасывание и распределение

При приеме внутрь хорошо абсорбируется из ЖКТ (абсорбция - 80-90%); прием пищи не влияет на абсорбцию. C_{max} в плазме крови достигается через 1-3 ч. Связывание с белками плазмы крови составляет около 30%. В небольших количествах проникает через ГЭБ, плацентарный барьер, выделяется с грудным молоком.

Метаболизм и выведение

Метаболизируется в печени, $T_{1/2}$ - 10-12 ч. Выводится почками (50% - в неизмененном виде); менее 2% выводится с желчью.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия;

— ИБС: профилактика приступов 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;

— AV-блокада II и III степени;

— синоатриальная блокада;

— синдром слабости синусового узла;

— выраженная брадикардия;

— стенокардия Принцметала;

— кардиомегалия (без признаков сердечной недостаточности);

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

— бронхиальная астма и хроническая обструктивная болезнь легких в анамнезе;

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

— поздние стадии нарушения периферического кровообращения, (болезнь Рейно);

— феохромоцитома (без одновременного применения альфа-адреноблокаторов);

— метаболический ацидоз;

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

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

С *осторожностью* назначают препарат пациентам с печеночной недостаточностью, хронической почечной недостаточностью, миастенией, тиреотоксикозом, сахарным диабетом, AV-блокадой I степени, депрессией (в т.ч. в анамнезе), псориазом, а также лицам пожилого возраста.

Способ применения и дозы:

Принимают внутрь, утром, натощак, таблетки не разжевывают.

Препарат назначают в дозе 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.

Побочное действие:

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

Со стороны органа зрения: нарушение зрения, уменьшение секреции слезной жидкости, сухость и болезненность глаз, конъюнктивит.

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, стоп; одышка), снижение АД, ортостатическая гипотензия, проявление ангиоспазма (усиление нарушения периферического кровообращения, похолодание нижних конечностей, синдром Рейно), боль в груди, синдром отмены (усиление приступов стенокардии, повышение АД).

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

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

Со стороны эндокринной системы: гипергликемия (у больных сахарным диабетом 2 типа), гипогликемия (у больных, получающих инсулин), гипотиреоидное состояние.

Аллергические реакции: кожный зуд, сыпь, крапивница.

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

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

Со стороны половой системы: ослабление либидо, снижение потенции.

Прочие: боль в спине, артралгия, изменение уровня триглицеридов, синдром отмены (усиление приступов стенокардии, повышение АД).

Влияние на плод: на фоне применения препарата возможны внутриутробная задержка роста, гипогликемия, брадикардия плода.

Передозировка:

Симптомы: аритмии, желудочковая экстрасистолия, выраженная брадикардия, AV-блокада, выраженное снижение АД, хроническая сердечная недостаточность, цианоз ногтей пальцев и ладоней, затрудненное дыхание, бронхоспазм, головокружение, обморок, судороги.

Лечение: промывание желудка, назначение адсорбентов. При необходимости проводят симптоматическую терапию: при развившейся AV-блокаде в/в введение атропина (1-2 мг), эпинефрина или постановка временного кардиостимулятора; при желудочковой экстрасистолии - лидокаин (препараты I А класса не применяются). При снижении АД больной должен находиться в положении Тренделенбурга; если нет признаков отека легких, вводят в/в плазмозамещающие растворы; при неэффективности - введение эпинефрина, допамина, добутамина (для поддержания хронотропного и инотропного действия и устранения выраженного снижения АД). При сердечной недостаточности назначают 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 в том случае, если польза для матери превышает риск развития побочных эффектов у плода и ребенка.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Применение на фоне терапии Бипролом аллергенов, используемых для иммунотерапии, или экстрактов аллергенов

для кожных проб повышает риск возникновения тяжелых системных аллергических реакций или анафилаксии.

При одновременном применении с бисопрололом йодосодержащих рентгенконтрастных лекарственных средств для в/в введения повышается риск развития анафилактических реакций.

При одновременном назначении с бисопрололом фенитоин для в/в введения, лекарственные средства для ингаляционной общей анестезии (производные углеводородов) повышают выраженность кардиодепрессивного действия и вероятность снижения АД.

При одновременном применении бисопролол изменяет эффективность инсулина и пероральных гипогликемических лекарственных средств, маскирует симптомы развивающейся гипогликемии (тахикардию, повышение АД).

При одновременном применении бисопролол снижает клиренс лидокаина и ксантинов (кроме дифиллина) и повышает их концентрацию в плазме, особенно у больных с исходно повышенным клиренсом теофиллина под влиянием курения.

Гипотензивный эффект бисопролола уменьшают НПВС (задержка Na^+ и блокада синтеза простагландина почками), ГКС и эстрогены (задержка ионов Na^+).

При одновременном применении сердечные гликозиды, метилдопа, резерпин и гуанфацин, блокаторы кальциевых каналов (верапамил, дилтиазем), амиодорон и другие антиаритмические лекарственные средства повышают риск развития или усугубления брадикардии, AV-блокады, остановки сердца и сердечной недостаточности.

При одновременном применении с бисопрололом нифедипин может приводить к значительному снижению АД.

При одновременном применении с бисопрололом диуретики, клонидин, симпатолитики, гидралазин и другие гипотензивные лекарственные средства могут привести к чрезмерному снижению АД.

Бисопролол удлиняет действие недеполяризующих миорелаксантов и антикоагулянтный эффект кумаринов.

Три- и тетрациклические антидепрессанты, антипсихотические лекарственные средства (нейролептики), этанол, седативные и снотворные лекарственные средства усиливают угнетающее влияние бисопролола на ЦНС.

Не рекомендуется одновременное применение бисопролола с ингибиторами МАО вследствие значительного усиления гипотензивного действия (интервал между приемом ингибиторов МАО и бисопролола должен составлять не менее 14 дней).

При одновременном применении с бисопрололом негидрированные алкалоиды спорыньи, эрготамин повышают риск развития нарушений периферического кровообращения.

При одновременном применении сульфасалазин повышает концентрацию бисопролола в плазме.

При одновременном применении рифампицин уменьшает $T_{1/2}$ бисопролола.

Особые указания и меры предосторожности:

Контроль состояния больных, принимающих Бипрол, 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).

Перед началом лечения рекомендуется проводить исследование функции внешнего дыхания у больных с заболеваниями органов дыхания в анамнезе.

Следует обучить пациента методике подсчета ЧСС и проинструктировать о необходимости врачебной консультации при ЧСС менее 50 уд./мин.

Примерно у 20% пациентов со 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.

Пациенты, использующие контактные линзы, 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 блокада α-адренорецепторов).

При тиреотоксикозе Бипрол может замаскировать определенные клинические признаки тиреотоксикоза (например, тахикардию). Резкая отмена у больных с тиреотоксикозом противопоказана, поскольку в таком случае возможно усиление симптомов.

При сахарном диабете препарат 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 Бипрола.

Возможно усиление выраженности реакции повышенной чувствительности и отсутствие эффекта от обычных доз эпинефрина у пациентов с отягощенным аллергологическим анамнезом.

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 минимально 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.

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

В случае выявления у больных пожилого возраста нарастающей брадикардии (менее 50 уд./мин), выраженного снижения АД (систолическое АД ниже 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 (на 25% в 3-4 дня).

Препарат следует отменить 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 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* назначают препарат пациентам с хронической почечной недостаточностью.

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

При нарушениях функции печени

С *осторожностью* назначают препарат пациентам с печеночной недостаточностью.

Применение в пожилом возрасте

С *осторожностью* назначают препарат пациентам пожилого возраста.

Применение в детском возрасте

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

Условия хранения:

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

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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