Бисокард



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, круглые, двояковыпуклые, с разделительной риской с одной стороны и гравировкой "5" - с другой стороны таблетки.

	1 таб.
бисопролол (в форме фумарата)	5 мг

Вспомогательные вещества: лактоза, крахмал кукурузный, кремния диоксид коллоидный, натрия лаурилсульфат, тальк, магния стеарат, гидроксипропилметилцеллюлоза (гипромеллоза), полиоксиэтиленгликоль 400, титана диоксид, железа оксид желтый.

30 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
30 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые оболочкой светло-розового цвета, круглые, двояковыпуклые, с разделительной риской с одной стороны и гравировкой "10" - с другой стороны таблетки.

	1 таб.
бисопролол (в форме фумарата)	10 мг

Вспомогательные вещества: лактоза, крахмал кукурузный, кремния диоксид коллоидный, натрия лаурилсульфат, тальк, магния стеарат, гидроксипропилметилцеллюлоза (гипромеллоза), полиоксиэтиленгликоль 400, титана диоксид, железа оксид красный.

30 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
30 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Вегетотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Бета$_1$-адреноблокатор без собственной 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, снижает сократимость миокарда. При увеличении дозы оказывает бета$_2$-адреноблокирующее действие.

В первые 24 ч отмечается увеличение ОПСС (в результате реципрокного возрастания активности α-адренорецепторов и устранения стимуляции β_2-адренорецепторов), которое через 1-3 суток возвращается к исходному. При длительном назначении препарата ОПСС снижается.

Гипотензивный эффект связан с уменьшением минутного объема крови, симпатической стимуляции периферических сосудов, снижением активности ренин-ангиотензиновой системы (имеет большее значение для больных с исходной гиперсекрецией ренина), восстановлением чувствительности барорецепторов дуги аорты (не происходит усиления их активности в ответ на снижение АД и влиянием на ЦНС). При артериальной гипертензии эффект наступает через 2-5 дней, стабильное действие развивается 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 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 синусного и эктопического водителей ритма и замедлением атриовентрикулярного 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 и более) оказывает блокирующий эффект на оба подтипа β-адренорецепторов, главным образом, в бронхах и в гладких мышцах сосудов.

Фармакокинетика

Всасывание и распределение

Абсорбция составляет 80-90%. Прием пищи не влияет на всасывание бисопролола. C_{max} в плазме крови отмечается через 2-4 ч. Связывание с белками плазмы крови - 26-33%. Проницаемость через ГЭБ и плацентарный барьер низкая, секреция с грудным молоком - низкая.

Метаболизм и выведение

Метаболизируется в печени. $T_{1/2}$ - 9-12 ч. Выводится почками - 50% в неизмененном виде, менее 2% - с желчью.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия;

— профилактика приступов стенокардии.

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Стенокардия

Противопоказания:

— шок;

— коллапс;

— отек легких;

— острая сердечная недостаточность;

— хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации (в т.ч. кардиогенный шок);

— AV-блокада II и III степени;

— синоатриальная блокада;

— СССУ;

— выраженная брадикардия;

— стенокардия Принцметала;

— кардиомегалия (без признаков сердечной недостаточности);

— артериальная гипотензия (систолическое артериальное давление менее 90 мм рт.ст., особенно при инфаркте миокарда);

— бронхиальная астма;

— 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 использования альфа-адреноблокаторов);

— метаболический ацидоз;

— период лактации;

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

— повышенная чувствительность к бисопрололу и другим бета-адреноблокаторам.

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

Способ применения и дозы:

Препарат назначают внутрь в дозе 2.5-5 мг 1 раз/сут. При необходимости дозу увеличивают до 10 мг 1 раз/сут. Максимальная суточная доза - 20 мг/сут.

У **пациентов с нарушением функции почек при клиренсе креатинина менее 20 мл/мин или с выраженными нарушениями функции печени** максимальная суточная доза - 10 мг.

Таблетки следует принимать утром натощак, не разжевывая, запивая достаточным количеством жидкости.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС: 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 "перемежающейся" хромотой и синдромом Рейно), тремор.

Со стороны органов чувств: 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.

Со стороны пищеварительной системы: изменения вкуса, сухость слизистой оболочки полости рта, тошнота, рвота, боль в животе, запор или диарея, гепатит, нарушения функции печени (темная моча, желтушность склер или кожи,

холестаз), изменение активности ферментов печени (повышение АСТ, АЛТ), уровня билирубина, триглицеридов.

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 инсулиннезависимым сахарным диабетом), гипогликемия (у больных, получающих инсулин), гипотиреоидное состояние.

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, 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. Проводят симптоматическую терапию. При развившейся AV-блокаде - в/в введение 1-2 мг атропина, эпинефрина или постановка временного кардиостимулятора; при желудочковой экстрасистолии - лидокаин (препараты 1а класса не применяются); при снижении АД - больной должен находиться в положении Тренделенбурга; если нет признаков отека легких - в/в вводят 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$_2$-адреномиметики ингаляционно.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение препарата Бисокард при беременности и в период лактации возможно в том случае, когда потенциальная польза для матери превышает риск развития побочных эффектов у плода и ребенка.

Установлено, что при приеме бисопролола при беременности у плода отмечается внутриутробная задержка роста, гипогликемия, брадикардия.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Не рекомендуется одновременное применение Бисокарда с ингибиторами МАО вследствие значительного усиления гипотензивного действия. Перерыв в лечении между приемом ингибиторов МАО и бисопролола должен составлять не менее 14 дней.

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

При одновременном применении с Бисокардом йодосодержащие рентгеноконтрастные лекарственные средства для в/в введения повышают риск развития анафилактических реакций.

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

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

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

НПВС (за счет задержки ионов натрия и блокады синтеза простагландина почками), ГКС и эстрогены (за счет задержки ионов натрия) ослабляют гипотензивный эффект Бисокарда.

При одновременном применении с Бисокардом 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.

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

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

Бисокард удлиняет действие недеполяризующих миорелаксантов и антикоагулянтный эффект кумаринов.

При одновременном применении с Бисокардом три- и тетрациклические антидепрессанты, антипсихотические лекарственные средства (нейролептики), этанол, седативные и снотворные лекарственные средства усиливают угнетение ЦНС.

При одновременном применении с Бисокардом негидрированные алкалоиды спорыньи повышают риск развития нарушений периферического кровообращения.

При одновременном применении с Бисокардом эрготамин повышает риск развития нарушения периферического кровообращения.

При одновременном применении с Бисокардом сульфасалазин повышает концентрацию бисопролола в плазме крови.

При одновременном применении с Бисокардом рифампицин укорачивает период полувыведения бисопролола.

Особые указания и меры предосторожности:

При назначении Бисокарда следует регулярно измерять ЧСС и АД (в начале лечения - ежедневно, затем - 1 раз в 3-4 мес), проводить ЭКГ, определять уровень глюкозы в крови у больных сахарным диабетом (1 раз в 4-5 мес). У пожилых пациентов рекомендуется контролировать функцию почек (1 раз в 4-5 мес).

Следует обучить пациента 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.

Следует учитывать, что примерно у 20% больных стенокардией бета-адреноблокаторы неэффективны из-за тяжелого коронарного атеросклероза с низким порогом ишемии (ЧСС менее 100 уд./мин) и повышенного конечного диастолического объема левого желудочка, нарушающего субэндокардиальный кровоток.

У курящих пациентов эффективность бета-адреноблокаторов снижается.

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

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

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

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 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 в дозе 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 снижения АД или брадикардии.

Больным с сопутствующими 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 снижения АД (систолическое АД ниже 100 мм рт.ст.), AV-блокады, бронхоспазма, желудочковых аритмий, тяжелых нарушений функции печени и почек необходимо уменьшить дозу препарата 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 отменить препарат перед проведением исследования содержания в крови и моче катехоламинов, метанефринов 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 занятиях другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

С *осторожностью* следует назначать препарат при хронической почечной недостаточности.

При нарушениях функции печени

С *осторожностью* следует назначать препарат при печеночной недостаточности.

Применение в детском возрасте

Эффективность и безопасность применения препарата до 18 лет не установлены.

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить в сухом, защищенном от света, недоступном для детей месте при комнатной температуре от 15° до 25°С.

Условия отпуска из аптек

Препарат отпускается по рецепту.

Срок годности:

3 года.

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