Бисомор



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 оранжевого цвета, круглые, двояковыпуклые; на изломе видны два слоя, ядро - от белого до почти белого цвета.

	1 таб.
бисопролола фумарат	10 мг

Вспомогательные вещества: маннитол - 141.5 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 21.1 мг, кроскармеллоза натрия - 1.8 мг, магния стеарат - 3.6 мг.

Состав оболочки: краситель Винкоут WT-AQ-01620 оранжевый (гипромеллоза, макрогол 400, титана диоксид, тальк, макрогол 6000, алюминиевый лак солнечный закат желтый) - 3.6 мг.

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

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой светло-желтого цвета, круглые, двояковыпуклые, с риской на одной стороне; на изломе видны два слоя, ядро от белого до почти белого цвета.

	1 таб.
бисопролола фумарат	2.5 мг

Вспомогательные вещества: маннитол - 149 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 21.1 мг, кроскармеллоза натрия - 1.8 мг, магния стеарат - 3.6 мг.

Состав пленочной оболочки: краситель Винкоут WT-AQ-01530 желтый (гипромеллоза, макрогол 400, титана диоксид, тальк, макрогол 6000, алюминиевый лак хинолиновый желтый) - 3.6 мг.

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

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой светло-оранжевого цвета, круглые, двояковыпуклые; на изломе видны два слоя, ядро - от белого до почти белого цвета.

	1 таб.
бисопролола фумарат	5 мг

Вспомогательные вещества: маннитол - 146.5 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 21.10 мг, кроскармеллоза натрия - 1.8 мг, магния стеарат - 3.6 мг.

Состав оболочки: краситель Винкоут WT-AQ-01069 оранжевый (гипромеллоза, макрогол 400, титана диоксид, тальк,

макрогол 6000, алюминиевый лак солнечный закат желтый) - 3.6 мг.

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

Фармакотерапевтическая группа:

- Вегетотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Селективный бета$_1$-адреноблокатор, без собственной симпатомиметической активности, не обладает мембраностабилизирующим действием.

Снижает активность ренина в плазме крови, уменьшает потребность миокарда в кислороде, урежает ЧСС. Оказывает антигипертензивное, антиаритмическое и антиангинальное действие. Блокируя в невысоких дозах бета$_1$-адренорецепторы сердца, уменьшает стимулированное катехоламинами образование цАМФ из АТФ, снижает внутриклеточный ток ионов кальция, оказывает отрицательное хромо-, дромо-, батмо- и инотропное действие (угнетает проводимость и возбудимость, замедляет AVпроводимость). При увеличении дозы выше терапевтической оказывает бета$_2$-адреноблокирующее действие.

ОПСС в начале применения препарата (в первые 24 ч) несколько увеличивается (в результате реципрокного возрастания активности α-адренорецепторов и устранения стимуляции бета$_2$-адренорецепторов), которое через 1-3 суток возвращается к исходному значению, а при длительном применении снижается.

Антигипертензивный эффект связан с уменьшением минутного объема крови, симпатической стимуляцией периферических сосудов, снижением активности симпатоадреналовой 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.

Антиангинальное действие обусловлено 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 миокарда в кислороде, особенно у пациентов с хронической сердечной недостаточностью.

Антиаритмическое действие обусловлено устранением аритмогенных факторов (тахикардии, повышенной активности симпатической нервной системы, увеличенного содержания цАМФ, артериальной гипертензии), уменьшением скорости спонтанного возбуждения синусового 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 иеселективных бета-адреноблокаторов, оказывает менее выраженное влияние на органы, содержащие бета$_2$-адренорецепторы (поджелудочная железа, скелетные мышцы, гладкая мускулатура периферических артерий, бронхов и матки) и на углеводный обмен, не вызывает задержки ионов натрия в организме.

Фармакокинетика

Всасывание

Бисопролол почти полностью (> 90 %) всасывается из ЖКТ, прием пищи не влияет на абсорбцию. Бисопролол демонстрирует линейную кинетику, причем его концентрации в плазме крови пропорциональны введенной дозе в диапазоне от 5 до 20 мг. C_{max} бисопролола в плазме крови достигается через 2-3 ч.

Распределение

Vd составляет 3,5 л/кг. Связь с белками плазмы крови - около 30%.

Метаболизм

Метаболизируется по окислительному пути без последующей конъюгации; незначительно метаболизируется при "первичном прохождении" через печень (примерно 10-15 %). Все метаболиты полярны. Основные метаболиты, обнаруживаемые в плазме крови и моче, не проявляют фармакологической активности. Данные, полученные в результате экспериментов с микросомами печени человека invitro, показывают, что бисопролол метаболизируется, в первую очередь, при участии изофермента CYP3A4 (около 95 %), а изофермент CYP2D6 играет лишь небольшую роль.

Выведение

Бисопролол выводится двумя путями, 50% дозы метаболизируется в печени с образованием неактивных метаболитов. Около 98% выводится почками, из них 50% - в неизмененном виде, менее 2% - через кишечник (с желчью). Общий клиренс составляет 12-18 л/ч, причем почечный клиренс равен 8-11 л/ч, $T_{1/2}$ - 10-12 ч. Проницаемость через гематоэнцефалический и плацентарный барьер низкая. Фармакокинетика бисопролола линейна и не зависит от возраста. У пациентов с ХСН плазменная концентрация бисопролола выше, а $T_{1/2}$ более продолжителен по сравнению со здоровыми добровольцами.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия;

— ИБС: профилактика приступов стабильной стенокардии;

— хроническая сердечная недостаточность.

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Сердечная недостаточность
- Стенокардия

Противопоказания:

— повышенная чувствительность к бисопрололу или любому из компонентов, а также к другим бета-адреноблокаторам;

— острая сердечная недостаточность;

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

— кардиогенный шок;

— коллапс;

— AV блокада II и III степени без электрокардиостимулятора;

— синоатриальная блокада;

— синдром слабости синусового узла;

— брадикардия (ЧСС менее 60 уд/мин);

— тяжелая артериальная гипотензия (систолическое АД менее 100 ммрт.ст.);

— тяжелая бронхиальная астма и ХОБЛ в анамнезе;

— выраженные нарушения периферического кровообращения, синдром Рейно;

— феохромоцитома (без одновременного применения альфа-адреноблокаторов);

— метаболический ацидоз;

— кардиомегалия (без признаков сердечной недостаточности);

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

— сопутствующее применение флоктафенина и сультоприда;

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

С осторожностью: бронхиальная астма и ХОБЛ; одновременное проведение десенсибилизирующей терапии; стенокардия Принцметала; гипертиреоз; сахарный диабет; AV блокада I степени; выраженная почечная недостаточность (КК менее 20 мл/мин); выраженные нарушения функции печени; псориаз; рестриктивная кардиомиопития; врожденные пороки сердца или порок клапана сердца с выраженными гемодинамическими нарушениями; ХСН с инфарктом миокарда в течение последних 3 месяцев; строгая диета; депрессия (в т.ч. в анамнезе).

Способ применения и дозы:

Препарат Бисомор следует принимать внутрь, запивая 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 дозы подбирает врач каждому пациенту индивидуально, в частности учитывая ЧСС и состояние пациента.

Лечение артериальной гипертензии и стабильной стенокардии

Как правило, начальная доза составляет 5 мг 1 раз/ сут. При необходимости дозу можно увеличить до 10 мг 1 раз/сут.

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

Пациентам с нарушениями функции печени или почек легкой или средней тяжести, а также пациентам пожилого возраста коррекции режима дозирования, как правило, не требуется.

Для пациентов с тяжелыми нарушениями функции почек (КК менее 20 мл/мин) и пациентов с тяжелыми нарушениями функции печенимаксимальная суточная доза составляет 10 мг.

Хроническая сердечная недостаточность

Начало лечения хронической сердечной недостаточности требует обязательного проведения специальной фазы титрования и регулярного врачебного контроля. Предварительным условием лечения препаратом Бисомор является стабильная ХСН без признаков обострения.

Лечение хронической сердечной недостаточности начинается в соответствии с ниже приведенной схемой, 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.

Рекомендуемая начальная доза препарата Бисомор составляет 1,25 мг (1/2 таблетки 2,5 мг) 1 раз/сут. В зависимости от индивидуальной переносимости дозу следует постепенно повышать до 2,5 мг, 3,75 мг (1?таблетки по 2,5 мг), 5 мг, 7,5 мг (1 таблетка по 5 мг и 1 таблетка по 2,5 мг) и 10 мг 1 раз/сут с интервалом не менее 2 недель или более.

Максимальная рекомендованная доза препарата Бисомор при лечении *хронической сердечной недостаточности* составляет 10 мг 1 раз/сут.

Если увеличение дозы препарата плохо переносится пациентом, возможно снижение дозы.

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

Во время фазы титрования или после нее может возникать временное ухудшение течения хронической сердечной недостаточности, 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 Бисомор или отмена лечения. После стабилизации состояния пациента следует провести повторное титрование дозы, либо продолжить лечение.

К настоящему времени недостаточно данных относительно применения препарата Бисомор у пациентов с ХСН, сопряженной с сахарным диабетом I типа, выраженными нарушениями функции почек и/или печени, рестриктивной кардиомиопатией, врожденными пороками сердца, гемодинамически значимым пороком сердца. Также до сих пор не былополучено достаточно данных относительно пациентов с ХСН с инфарктом миокарда в течение последних 3 месяцев.

Продолжительность лечения при всех показаниях

Лечение обычно является длительным. При необходимости лечение может быть прервано и возобновлено с соблюдением определенных правил. Лечение не следует прерывать внезапно, особенно у пациентов с ИБС. Если необходимо прекращение лечения, то дозу препарата следует снижать постепенно.

Побочное действие:

Частота развития побочных реакций, приведенных ниже, определялась

соответственно следующей классификации: очень часто ≥ 1/10; часто ≥ 1/100, <1/10; нечастое ≥ 1/1000, <1/100; редко ≥ 1/10000, <1/1000; очень редко < 1/10000.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: очень часто - брадикардия (у пациентов с хронической сердечной недостаточностью (ХСН); часто- усугубление симптомов течения ХСН (у пациентов с ХСН), ощущение похолодания или онемения в конечностях, выраженное снижение АД, особенно у пациентов с ХСН; нечасто - нарушение AV проводимости; брадикардия (у пациентов с артериальной гипертензией или стенокардией); усугубление симптомов течения ХСН (у пациентов с артериальной гипертензией или стенокардией), ортостатическая гипотензия.

Со стороны ЦНС: часто - головокружение*, головная боль*; редко – потеря сознания.

Психические нарушения: нечасто - депрессия, бессонница; редко - галлюцинации, ночные кошмары.

Со стороны органа зрения: редко - уменьшение слезотечения (следует учитывать при ношении контактных линз); очень редко - конъюнктивит.

Со стороны органа слуха: редко- нарушения слуха.

Со стороны дыхательной системы: нечасто - бронхоспазм у пациентов с бронхиальной астмой или обструкцией дыхательных путей в анамнезе; редко - аллергический ринит.

Со стороны пищеварительной системы: часто - тошнота, рвота, диарея, запор; редко- гепатит.

Со стороны опорно-двигательного аппарата: нечасто - мышечная слабость, судороги мышц.

Со стороны кожных покровов: редко - реакции повышенной чувствительности, такие как кожный зуд, сыпь, гиперемия кожных покровов; очень редко:алопеция; бета-адреноблокаторы могут способствовать обострению симптомов течения псориаза или вызывать псориазоподобную сыпь.

Со стороны репродуктивной системы: редко- нарушение потенции.

Общие нарушения: часто - астения (у пациентов с ХСН), повышенная утомляемость*; нечасто - астения (у пациентов с артериальной гипертензией или стенокардией).

Лабораторные показатели: редко - повышение концентрации триглицеридов и активности «печеночных» трансаминаз в крови (аспартатаминотрансферазы и аланинаминотрансферазы).

* У пациентов с артериальной гипертензией или стенокардией данные симптомы чаще появляются в начале курса лечения, обычно носят легкий характер и проходят, как правило, в течение 1-2 недель после начала лечения.

Передозировка:

Симптомы: AV блокада, выраженная брадикардия, выраженное снижение АД, бронхоспазм, острая сердечная недостаточность и гипогликемия.

Чувствительность к однократному приему высокой дозы бисопролола сильно варьирует среди отдельных пациентов и, вероятно, пациенты с ХСН обладают более высокой чувствительностью.

Лечение: поддерживающая и симптоматическая терапия.

При выраженной брадикардии: внутривенное введение атропина. Если его 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 вазопрессорных препаратов.

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 острой сердечной недостаточности: внутривенное введение диуретиков, препаратов с положительным инотропным эффектом, а также вазодилататоров. При бронхоспазме: назначение бронходилататоров, в т.ч. бета$_2$-адреномиметиков и/или аминофиллина.

При гипогликемии: в/в введение декстрозы (глюкозы).

Применение при беременности и кормлении грудью:

При беременности препарат следует рекомендовать к применению только в том случае, если польза лечения для матери превышает риск развития побочных эффектов у плода и/или ребенка.

Как правило, бета-адреноблокаторы снижают кровоток в плаценте и могут повлиять на развитие плода. Следует контролировать 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, перейти на альтернативные методы терапии.

В случае применения бета-адреноблокаторов во время беременности следует тщательно обследовать новорожденного после родов. В первые три дня жизни могут возникать симптомы брадикардии и гипогликемии.

Данных о выделении бисопролола в грудное молоко нет. Поэтому прием препарата Бисомор не рекомендуется в период кормления грудью. Если прием препарата в период лактации необходим, грудное вскармливание следует прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Не рекомендуемые комбинации

Лечение ХСН

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

При всех показаниях

Блокаторы «медленных» кальциевых каналов типа верапамила и, в меньшей степени, дилтиазема, при одновременном применении с бисопрололом могут приводить к снижению сократительной способности миокарда и нарушению AVпроводимости. В частности, в/в введение верапамила пациентам, принимающим бета-адреноблокаторы, может привести к выраженной артериальной гипотензии и AVблокаде.

Гипотензивные средства центрального действия (такие как клонидин, метилдопа, моксонидин, рилменидин) могут привести к урежению ЧСС и снижению сердечного выброса, а также к вазодилатации вследствие снижения центрального симпатического тонуса. Резкая отмена, особенно до отмены бета-адреноблокаторов может повысить риск развития «рикошетной» артериальной гипертензии.

Комбинации, требующие применения с осторожностью

Лечение артериальной гипертензии и стабильной стенокардии

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

При всех показаниях

БМКК производные дигидропиридина (например, нифедипин, фелодипин, амлодипин) могут увеличивать риск развития артериальной гипотензии. У пациентов с хронической сердечной недостаточностью нельзя исключить риск последующего ухудшения сократительной функции миокарда. Антиаритмические средства III класса (например, амиодарон) могут усиливать нарушение AVпроводимости.

бета-адреноблокаторы для местного применения (например, глазные капли для лечения глаукомы) могут усиливать системные эффекты бисопролола (снижение АД, урежение ЧСС).

Парасимпатомиметики при одновременном применении с бисопрололом могут усиливать нарушение AVпроводимости и повышать риск развития брадикардии. Гипогликемическое действие инсулина или гипогликемических средств для приема внутрь может усиливаться. Признаки гипогликемии - в частности тахикардия - могут маскироваться или подавляться. Подобные взаимодействия более вероятны при применении неселективных бета-адреноблокаторов.

Средства для проведения общей анестезии могут повышать риск кардиодепрессивного действия, приводя к выраженному снижению АД (см. раздел «Особые указания»).

Сердечные гликозиды при одновременном применении с бисопрололом могут приводить к удлинению времени проведения импульса, и, таким образом, к развитию брадикардии.

НПВС могут снижать гипотензивный эффект бисопролола.

Одновременное применение бисопролола с бета-адреномиметиками (например, изопреналином, добутамином) может приводить к снижению эффекта обоих препаратов. Сочетание бисопролола с адреномиметиками, влияющими на β- и α-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. Гипотензивные средства, также как и другие средства с возможным антигипертензивным эффектом (например, трициклические антидепрессанты, барбитураты, фенотиазины) могут усиливать антигипертензивный эффект бисопролола.

Мефлохин при одновременном применении с бисопрололом может увеличивать риск развития брадикардии.

Ингибиторы МАО (за исключением ингибиторов МАО В) могут усиливать гипотензивный эффект бета-адреноблокаторов. Одновременное применение также может привести к развитию гипертонического криза.

Особые указания и меры предосторожности:

Контроль за пациентами, принимающими препарат Бисомор, должен включать измерение ЧСС и АД (в начале лечения - ежедневно, затем 1 раз в 3-4 мес), проведение ЭКГ, определение уровня глюкозы в 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 60 уд/мин.

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

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 препарата Бисомор.

В случае выявления у больных пожилого возраста нарастающей брадикардии (менее 60 уд/мин), выраженного понижения АД (систолическое АД ниже 100 мм рт.ст.), АВблокады, 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 препарата проводят постепенно, снижая дозу в течение 2 недель и более (снижают дозу на 25% в 3-4 дня).

На начальных этапах лечения препаратом Бисомор пациенты нуждаются в постоянном наблюдении.

Пациентам с бронхоспастическими заболеваниями можно назначать кардиоселективные бета-адреноблокаторы в случае непереносимости и/или неэффективности других гипотензивных средств. При превышении дозы препарата Бисомор возникает опасность развития бронхоспазма.

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

Пациентам, пользующимся контактными линзами, следует учитывать, что на фоне лечения препаратом Бисомор возможно уменьшение продукции слезной жидкости.

При проведении общей анестезии на фоне лечения препаратом, следует учитывать риск возникновения блокады β-адренорецепторов. В случае необходимости прекращения терапии препаратом Бисомор перед хирургическим вмешательством, отмену препарата проводят постепенно, и завершают за 48 ч до проведения общей анестезии. Если больной принял препарат перед хирургическим вмешательством, ему следует подобрать лекарственное средство для общей анестезии с минимально отрицательным инотропным действием. Следует предупредить врача-анестезиолога о лечении препаратом Бисомор.

У пациентов с феохромоцитомой препарат может быть назначен только на фоне применения альфа-адреноблокаторов.

При лечении препаратом Бисомор симптомы гиперфункции щитовидной железы (гипертиреоза) могут маскироваться (например, тахикардия). Резкая отмена у больных с тиреотоксикозом противопоказана, поскольку способна усилить симптоматику.

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

У курильщиков эффективность бета-адреноблокаторов ниже.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения препаратом Бисомор 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: выраженная почечная недостаточность (КК менее 20 мл/мин).

При нарушениях функции печени

С осторожностью: выраженные нарушения функции печени.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в возрасте до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).

Условия хранения:

Хранить в сухом, недоступном для детей и защищенном от света месте при температуре не выше 25°С.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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