Бисопролол-Лугал



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]

Фармакотерапевтическая группа:

- Вегетотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Селективный бета$_1$-адреноблокатор без внутренней симпатомиметической активности, не обладает мембраностабилизирующей активностью. Снижает активность ренина плазмы, уменьшает потребность миокарда в кислороде, уменьшает ЧСС (в покое и при нагрузке) и сердечный выброс, при этом ударный объем существенно не уменьшается. Угнетает AV-проводимость. Оказывает антиангинальное и гипотензивное действие. В высоких дозах (200 мг и более) может вызывать блокаду и β_2-адренорецепторов главным образом в бронхах и в гладких мышцах сосудов.

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.

Антиангинальный эффект обусловлен уменьшением потребности миокарда в кислороде в результате урежения ЧСС и снижения сократимости, удлинением диастолы, улучшением перфузии миокарда.

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.

Фармакокинетика

Абсорбция - 80-90%, прием пищи не влияет на абсорбцию.

C_{max} в плазме крови достигается через 2-4 ч. Связывание с белками плазмы - 26-33%. Бисопролол в небольшой степени проникает через ГЭБ и плацентарный барьер; выделяется с грудным молоком.

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, хроническая сердечная недостаточность.

Относится к болезням:

- Гипертензия
- Стенокардия

Противопоказания:

Острая сердечная недостаточность, хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации, кардиогенный шок, коллапс, AV-блокада II и III степени (без кардиостимулятора), СССУ; синоатриальная блокада, выраженная брадикардия (ЧСС <50 уд./мин), стенокардия Принцметала, выраженное снижение АД (систолическое АД <90 мм рт.ст.), тяжелые формы бронхиальной астмы и ХОБЛ в анамнезе, поздние стадии нарушения периферического кровообращения, болезнь Рейно, феохромоцитома (без одновременного применения альфа-адреноблокаторов), метаболический ацидоз, одновременный прием ингибиторов МАО (за исключением ингибиторов МАО типа В), детский и подростковый возраст до 18 лет, повышенная чувствительность к бисопрололу и к другим бета-адреноблокаторам.

Способ применения и дозы:

Индивидуальный. Для приема внутрь суточная доза составляет 2.5-10 мг, частота приема - 1 раз/сут. Максимальная суточная доза - 10 мг.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: слабость, утомляемость, головокружение, головная боль, расстройства сна, нарушения со стороны психики (депрессия, редко - галлюцинации), ощущение холода и парестезии в конечностях.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: ортостатическая гипотензия, брадикардия, нарушение AV-проводимости, появление симптомов сердечной недостаточности, усугубление перемежающейся хромоты и основных клинических симптомов при синдроме Рейно.

Со стороны органа зрения: уменьшение секреции слезной жидкости, конъюнктивит.

Со стороны системы пищеварения: диарея, запоры, тошнота, боли в животе.

Со стороны костно-мышечной системы: мышечная слабость, судороги мышц.

Дерматологические реакции: кожный зуд; в отдельных случаях - усиление проявлений псориаза, появление псориазоподобных высыпаний.

Со стороны дыхательной системы: у предрасположенных пациентов возможно появление симптомов бронхиальной обструкции.

Прочие: потливость, приливы, нарушение потенции, снижение толерантности к глюкозе у больных с сахарным диабетом, аллергические реакции.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение при беременности и в период лактации не рекомендуется и возможно в том случае, когда ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск развития побочных эффектов у плода и ребенка.

В исключительных случаях применения при беременности бисопролол следует отменить за 72 ч до ожидаемого срока

родов ввиду возможности брадикардии, артериальной гипотензии, гипогликемии и угнетения дыхания у новорожденного. Если отмена невозможна, то необходимо тщательно контролировать состояние новорожденного в течение 72 ч после родов.

При необходимости применения бисопролола в период лактации грудное вскармливание необходимо прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении антацидных и противодиарейных средств возможно уменьшение абсорбции бета-адреноблокаторов.

При одновременном применении антиаритмических средств возможно резкое уменьшение АД, снижение ЧСС, развитие аритмии и/или сердечной недостаточности.

При одновременном применении антигипертензивных средств возможно усиление антигипертензивного действия.

При одновременном применении сердечных гликозидов возможны нарушения проводимости.

При одновременном применении симпатомиметиков (в т.ч. входящих в состав средств от кашля, капель в нос, глазных капель) уменьшается эффективность бисопролола.

При одновременном применении верапамила, дилтиазема возможно резкое уменьшение АД, снижение ЧСС, развитие аритмии и/или сердечной недостаточности.

При одновременном применении гуанфацина возможны выраженная брадикардия, нарушения проводимости.

При одновременном применении инсулина, гипоглигемических средств для приема внутрь усиливается действие инсулина или других гипоглигемических средств (необходим регулярный контроль уровня глюкозы в плазме крови).

При одновременном применении клонидина возможны выраженная брадикардия, артериальная гипотензия, нарушения проводимости.

В случае внезапной отмены клонидина у пациентов, получающих бисопролол, возможно резкое повышение АД.

При одновременном применении нифедипина, других блокаторов кальциевых каналов, производных дигидропиридина усиливается антигипертензивное действие бисопролола.

При одновременном применении резерпина, альфа-метилдопы возможна выраженная брадикардия.

При одновременном применении рифампицина возможно незначительное уменьшение $T_{1/2}$ бисопролола.

При одновременном применении производных эрготамина (в т.ч. средств для лечения мигрени, содержащих эрготамин) усиливаются симптомы нарушения периферического кровообращения.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применяют при псориазе и при указаниях на псориаз в семейном анамнезе, сахарном диабете в фазе декомпенсации, при предрасположенности к аллергическим реакциям. При феохромоцитоме применение бисопролола возможно только после приема альфа-адреноблокаторов. Не допускать внезапной отмены бисопролола, курс лечения следует заканчивать медленно с постепенным уменьшением дозы. Перед хирургическим вмешательством следует поставить в известность анестезиолога о лечении бисопрололом.

Бисопролол в дозе более 10 мг/сут следует применять лишь в исключительных случаях.

Не следует превышать эту дозу при почечной недостаточности (КК менее 20 мл/мин) и тяжелых нарушениях функции печени.

В период лечения не допускать употребления алкоголя.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

С осторожностью применяют у пациентов, деятельность которых связана с необходимостью концентрации внимания и высокой скорости психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Не следует превышать дозу 10 мг/сут при почечной недостаточности (КК менее 20 мл/мин).

При нарушениях функции печени

Не следует превышать дозу 10 мг/сут при тяжелых нарушениях функции печени.

Применение в детском возрасте

Не рекомендуется применение у детей.

Источник: http://drugs.thead.ru/Bisoprolol-Lugal