Конкор Кор



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 белого цвета, сердцевидные, двояковыпуклые, с риской на обеих сторонах.

	1 таб.
бисопролола гемифумарат (бисопролола фумарат (2:1))	2.5 мг

Вспомогательные вещества: кальция гидрофосфат, безводный - 134.0 мг, крахмал кукурузный, мелкий порошок - 15.0 мг, кремния диоксид коллоидный, безводный - 1.5 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 10.0 мг, кросповидон - 5.5 мг, магния стеарат - 1.5 мг.

Состав пленочной оболочки: гипромеллоза 2910/15 - 2.20 мг, макрогол 400 - 0.53 мг, диметикон 100 - 0.11 мг, титана оксид (E171) - 1.22 мг.

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
25 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
30 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Вегетотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

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

Снижает активность ренина плазмы крови, 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, замедляет AV-проводимость). 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), которое через 1-3 сут возвращается к исходному, а при длительном назначении снижается.

Гипотензивный эффект связан с уменьшением минутного объема крови, симпатической стимуляцией периферических сосудов, снижением активности ренин-ангиотензиновой 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 месяца.

Антиангинальное действие обусловлено уменьшением потребности миокарда в кислороде в результате урежения ЧСС, незначительным снижением сократимости, удлинением диастолы, улучшением перфузии миокарда.

Антиаритмическое действие обусловлено 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.

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 (>90%) всасывается из ЖКТ. Его биодоступность составляет примерно 85-90% после приема внутрь; прием пищи не влияет на биодоступность. Бисопролол демонстрирует линейную кинетику, причем его концентрации в плазме крови пропорциональны введенной дозе в диапазоне доз от 5 до 20 мг. C_{max} в плазме крови достигается через 2-3 ч.

Распределение

Бисопролол распределяется довольно широко. V_d составляет 3.5 л/кг. Связь с белками плазмы крови достигает примерно 35%; захват клетками крови не наблюдается.

Метаболизм

Метаболизируется, в основном, по окислительному пути без последующей конъюгации; наблюдается незначительная метаболизация «при первом прохождении» через печень (на уровне примерно 10-15%). Все метаболиты обладают сильной полярностью. Основные метаболиты, обнаруживаемые в плазме крови и моче, не проявляют фармакологической активности. Данные, полученные в результате экспериментов с микросомами печени человека in vitro, показывают, что бисопролол метаболизируется, в первую очередь, с помощью CYP3A4 (около 95%), а CYP2D6 играет лишь небольшую роль.

Выведение

Клиренс бисопролола определяется равновесием между выведением его через почки в виде неизмененного вещества (около 50%) и окислением в печени (около 50%) до метаболитов, которые затем также выводятся почками. Общий клиренс составляет 15.6 ± 3.2 л/ч, причем почечный клиренс равен 9.6±1.6 л/ч. $T_{1/2}$ составляет 10-12 ч.

Показания к применению:

— хроническая сердечная недостаточность.

Относится к болезням:

- Сердечная недостаточность

Противопоказания:

— острая сердечная недостаточность;

— хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации;

— шок, вызванный нарушением сердечных функций (кардиогенный шок);

— коллапс;

— AV-блокада II и III степени, без электрокардиостимулятора;

— 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 использования альфа-адреноблокаторов);

— метаболический ацидоз;

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

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

— повышенная чувствительность к бисопрололу или любому из компонентов и к другим бета-адреноблокаторам.

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

Способ применения и дозы:

Таблетки следует принимать внутрь, запивая небольшим количеством жидкости утром до завтрака, во время или после него. Таблетки не следует разжевывать или растирать в порошок.

Начало лечения хронической сердечной недостаточности препаратом Конкор Кор требует обязательного проведения специальной фазы титрования и регулярного врачебного контроля.

Предварительные условия для лечения Конкором Кор

- хроническая сердечная недостаточность без признаков обострения в предшествующие 6 недель;

- практически неизменная базовая терапия в предшествующие 2 недели;

- лечение оптимальными дозами ингибиторов АПФ (или других сосудорасширяющих средств в случае непереносимости ингибиторов АПФ), диуретиков и, факультативно, сердечных гликозидов.

Лечение хронической сердечной недостаточности Конкором Кор 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.

Неделя терапии	Режим дозирования
1 неделя	1.25 мг 1 раз/сут
2 неделя	2.5 мг 1 раз/сут
3 неделя	3.75 мг 1 раз/сут
4-7 неделя	5 мг 1 раз/сут
8-11 неделя	7.5 мг 1 раз/сут
12 неделя и далее	10 мг 1 раз/сут в качестве поддерживающей терапии

*Для обеспечения выше приведенного режима дозирования на последующих стадиях лечения рекомендуется применять препарат Конкор.

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

Пациентам рекомендуется принимать подобранную врачом дозу препарата, если не возникают побочные реакции.

После начала лечения препаратом в дозе 1.25 мг (1/2 таб. препарата Конкор Кор) пациента следует наблюдать в течение 4 ч (контроль ЧСС, АД, нарушения проводимости, признаки ухудшения сердечной недостаточности).

Во время фазы титрования или после нее может произойти временное ухудшение течения сердечной недостаточности, задержка жидкости в организме, артериальная гипотензия или брадикардия. В этом случае рекомендуется обратить внимание на подбор дозировки сопутствующей базовой терапии (оптимизировать дозу диуретика и/или ингибитора АПФ) перед снижением дозировки препарата Конкор Кор. После стабилизации состояния пациента следует провести повторное титрование, либо продолжить лечение.

Лечение препаратом Конкор Кор обычно является долговременным. 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 дозировку препарата следует снижать постепенно.

При **выраженных нарушениях функции почек (КК<20 мл/мин)** и у **пациентов с тяжелыми заболеваниями печени** максимальная суточная доза препарата составляет 10 мг.

При **нарушении функции печени** или **почек легкой** или **умеренной степени** обычно не требуется коррекция дозы.

При применении препарата у **пациентов пожилого возраста** коррекции дозы не требуется.

Побочное действие:

Частота побочных реакций, приведенных ниже, определялась по следующим градациям: очень часто (≥10%); часто (>1%, <10%), нечасто (>0.1%, <1%), редко (>0.01%, <0.1%); очень редко (≤0.01%, включая отдельные сообщения).

Со стороны сердечно-сосудистой системы: очень часто - снижение ЧСС (брадикардия, особенно у пациентов с хронической сердечной недостаточностью); часто - артериальная гипотензия (особенно у пациентов с хронической сердечной недостаточностью), проявление ангиоспазма (усиление нарушения периферического кровообращения, ощущение холода в конечностях (парестезии); иногда - нарушение AV-проводимости, ортостатическая артериальная гипотензия, декомпенсация сердечной недостаточности с развитием периферических отеков.

Со стороны ЦНС: иногда - головокружение, головная боль, астения, повышенная утомляемость, нарушения сна, депрессия; редко - галлюцинации, ночные кошмары, судороги. Обычно эти явления носят легкий характер и исчезают, как правило, в течение 1-2 недель после начала лечения.

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

Со стороны дыхательной системы: иногда - бронхоспазм у пациентов с бронхиальной астмой или обструктивными заболеваниями дыхательных путей; редко - аллергический ринит.

Со стороны пищеварительной системы: часто - тошнота, рвота, диарея, запор, сухость слизистой оболочки полости рта; редко - гепатит, повышение уровня ферментов печени в крови (АСТ, АЛТ).

Со стороны костно-мышечной системы: иногда - мышечная слабость, судороги в икроножных мышцах, артралгия.

Со стороны репродуктивной системы: очень редко - нарушения потенции.

Лабораторные показатели: редко - повышение уровня триглицеридов в крови; в отдельных случаях - тромбоцитопения, агранулоцитоз.

*Аллергические реакции:*редко - кожный зуд, покраснение кожи, сыпь.

*Дерматологические реакции:*редко - потливость; очень редко - алопеция. Бета-адреноблокаторы могут обострять течение псориаза.

Передозировка:

Симптомы: аритмия, желудочковая экстрасистолия, выраженная брадикардия, AV-блокада, выраженное снижение АД, острая сердечная недостаточность, гипогликемия, акроцианоз, затруднение дыхания, бронхоспазм, головокружение, обморочные состояния, судороги.

Лечение: промывание желудка, назначение адсорбирующих лекарственных средств, симптоматическая терапия. При развившейся AV-блокаде следует в/в ввести 1-2 мг атропина, эпинефрина или установить временный кардиостимулятор. При желудочковой экстрасистолии - лидокаин (препараты класса I A не применяются). При выраженном снижении АД пациенту следует находиться в положении Тренделенбурга, если нет признаков отека легких - в/в плазмозамещающие растворы, при их неэффективности - эпинефрин, допамин, добутамин (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 - ингаляционно бета$_2$-адреностимуляторы.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение препарата Конкор Кор при беременности возможно только в том случае, когда предполагаемая польза для матери превосходит потенциальный риск для плода.

Бета-адреноблокаторы снижают кровоток в плаценте и могут повлиять на развитие плода. Следует внимательно отслеживать кровоток в плаценте и матке, а также следить за ростом и развитием будущего ребенка, и в случае опасных проявлений в отношении беременности или плода, принимать альтернативные терапевтические меры. Следует тщательно обследовать новорожденного после родов. В первые 3 дня жизни могут возникать симптомы снижения уровня глюкозы в крови и ЧСС.

Данных выделении бисопролола с грудным молоком или безопасности воздействия бисопролола на грудных детей нет. При необходимости применения препарата в период лактации следует решить вопрос о прекращении грудного вскармливания.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

На эффективность и переносимость лекарственных средств может повлиять одновременное применение других лекарств. Такое взаимодействие может происходить также в тех случаях, когда два лекарственных средства приняты через короткий промежуток времени. Врача необходимо проинформировать о приминении других лекарственных средств, даже если применение осуществляется без предписания.

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

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

Фенитоин при в/в введении, лекарственные средства для ингаляционной общей анестезии (производные углеводородов) повышают выраженность кардиодепрессивного действия и вероятность снижения АД.

Эффективность инсулина и пероральных гипогликемических лекарственных средств может меняться при лечении бисопрололом (маскирует симптомы развивающейся гипогликемии: тахикардию, повышение АД).

Клиренс лидокаина и ксантинов (кроме дифиллина) может снижаться в связи с возможным повышением их концентрации в плазме крови, особенно у пациентов с исходно повышенным клиренсом теофиллина под влиянием курения.

НПВС, ГКС и эстрогены ослабляют гипотензивный эффект бисопролола (задержка ионов натрия, блокада синтеза простагландина почками).

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 препараты 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 лекарственные 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:

Пациент не должен резко прерывать лечение и менять рекомендованную дозу без предварительной консультации с врачом, поскольку это может привести к временному ухудшению деятельности сердца. Лечение не следует прерывать внезапно, особенно у пациентов с ИБС. Если прекращение лечения необходимо, дозу следует снижать постепенно.

Контроль за состоянием пациентов, принимающих Конкор Кор, должен включать измерение ЧСС и АД (в начале лечения - ежедневно, затем 1 раз в 3-4 мес), проведение ЭКГ, определение глюкозы крови у пациентов с сахарным диабетом (1 раз в 4-5 мес). У пожилых пациентов рекомендуется следить за функцией почек (1 раз в 4-5 мес).

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

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

Примерно у 20% пациентов со стенокардией бета-адреноблокаторы неэффективны. Основные причины: тяжелый коронарный атеросклероз с низким порогом ишемии (ЧСС <100 уд./мин) и повышенный конечный диастолический объем левого желудочка, нарушающий субэндокардиальный кровоток.

У курильщиков эффективность бета-адреноблокаторов ниже.

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

При применении препарата Конкор Кор у пациентов с феохромоцитомой имеется риск развития парадоксальной артериальной гипертензии (если предварительно не достигнута эффективная альфа-адреноблокада).

При тиреотоксикозе Конкор Кор может маскировать определенные клинические признаки тиреотоксикоза (например, тахикардию). Резкая отмена препарата у пациентов с тиреотоксикозом противопоказана, поскольку способна усилить симптомы.

При сахарном диабете применение препарата может привести к маскировке тахикардии, вызванной гипогликемией. В отличие от неселективных бета-адреноблокаторов Конкор Кор практически не усиливает вызванную инсулином гипогликемию и не задерживает восстановление концентрации глюкозы в крови до нормального уровня.

При одновременном применении клонидина его прием может быть прекращен только через несколько дней после отмены препарата Конкор Кор.

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 препарат следует отменить за 48 ч до проведения общей анестезии. Если пациент 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, которые истощают депо катехоламинов (в т. ч. резерпин), могут усилить действие бета-

адреноблокаторов, поэтому пациенты, принимающие такие сочетания лекарственных средств, должны находиться под постоянным наблюдением врача на предмет выявления выраженного снижения АД или брадикардии.

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

В случае выявления у пациентов пожилого возраста нарастающей брадикардии (ЧСС <50 уд./мин), выраженного снижения АД (систолическое АД <100 мм рт.ст.), AV-блокады, необходимо уменьшить дозу или прекратить лечение.

Рекомендуется прекратить терапию препаратом Конкор Кор 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 содержания в крови и моче катехоламинов, норметанефрина, ванилинминдальной кислоты, титров антинуклеарных антител.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Бисопролол не влияет на способность управлять автомобилем при исследовании пациентов с заболеваниями коронарных сосудов сердца. Однако вследствие индивидуальных реакций способность управлять автомобилем или работать с технически сложными механизмами может быть нарушена. На это следует обратить особое внимание в начале лечения, после изменения дозы, а также при одновременном употреблении алкоголя.

При нарушениях функции почек

С осторожностью применяют препарат при хронической почечной недостаточности.

При нарушениях функции печени

С *осторожностью* применяют препарат при печеночной недостаточности.

Условия хранения:

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

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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