Кординорм Кор



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:

Форма выпуска, описание и состав

Таблетки белого или почти белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с риской на одной стороне.

	1 таб.
бисопролола фумарат	2.5 мг

Вспомогательные вещества: просолв (целлюлоза микрокристаллическая - 74.294 мг, кремния диоксид коллоидный - 1.516 мг) - 75.81 мг, кроскармеллоза натрия - 1.692 мг, карбоксиметилкрахмал натрия (тип А) - 4.25 мг, магния стеарат - 0.748 мг.

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (6) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (9) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (10) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Селективный бета$_1$-адреноблокатор, без собственной симпатомиметической активности, не обладает мембраностабилизирующим действием. Оказывает антигипертензивное, антиаритмическое и антиангинальное действие.

Снижает активность ренина плазмы крови, уменьшает потребность миокарда в кислороде, уменьшает ЧСС в покое и при нагрузке. Блокируя в невысоких дозах β_1-адренорецепторы сердца, уменьшает стимулированное катехоламинами образование циклического аденозинмонофосфата (цАМФ) из аденозинтрифосфата, 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, через 1-3 суток возвращается к исходному, а при длительной терапии снижается.

Антигипертензивный 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 развивается через 1-2 месяца.

Антиангинальное действие обусловлено уменьшением потребности миокарда в кислороде в результате уменьшения ЧСС и незначительного снижения 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 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 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 однократном применении у пациентов с ИБС без признаков хронической сердечной недостаточности (ХСН) бисопролол снижает ЧСС, ударный объем сердца и, как следствие, уменьшает фракцию выброса и потребность миокарда в кислороде.

Фармакокинетика

Всасывание

Бисопролол почти полностью (>90%) всасывается из ЖКТ. Биодоступность вследствие незначительного метаболизма при "первом прохождении" через печень (около 10%) составляет приблизительно 90% после приема внутрь. Прием пищи не влияет на биодоступность. Бисопролол демонстрирует линейную кинетику, причем его концентрации в плазме крови пропорциональны принятой 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. Связывание с белками плазмы крови достигает примерно 30%.

Метаболизм

Метаболизируется по окислительному пути без последующей конъюгации. Все метаболиты обладают полярностью и выводятся почками. 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 изофермента CYP3A4 (около 95%), а изофермент CYP2D6 играет лишь небольшую роль.

Выведение

Клиренс бисопролола определяется равновесием между выведением его через почки в неизмененном виде (около 50%) и окислением в печени (около 50%) до метаболитов, которые затем также выводятся почками. Общий клиренс составляет 15 л/ч. $T_{1/2}$ составляет 10-12 ч.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Отсутствуют данные о фармакокинетике бисопролола у пациентов с ХСН и одновременным нарушением функции печени или почек.

Показания к применению:

— хроническая сердечная недостаточность.

Относится к болезням:

- Сердечная недостаточность

Противопоказания:

— острая сердечная недостаточность;

— ХСН в стадии декомпенсации, требующая проведения инотропной терапии;

— кардиогенный шок;

— AV-блокада II и III степени без электрокардиостимулятора;

— СССУ;

— синоатриальная блокада;

— выраженная брадикардия (ЧСС <60 уд/мин);

— тяжелая артериальная гипотензия (систолическое АД <100 мм рт.ст.);

— тяжелые формы бронхиальной астмы или ХОБЛ в анамнезе;

— выраженные нарушения периферического артериального кровообращения и синдром Рейно;

— феохромоцитома (без одновременного применения альфа-адреноблокаторов);

— метаболический ацидоз;

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

— повышенная чувствительность к бисопрололу или любому из компонентов препарата.

С *осторожностью* следует назначать препарат при проведении десенсибилизирующей терапии, стенокардии Принцметала, гипертиреозе, сахарном диабете 1 типа и сахарном диабете со значительными колебаниями концентрации глюкозы в крови, AV-блокаде I степени, выраженных нарушениях функции почек (КК менее 20 мл/мин), выраженных нарушениях функции печени, псориазе, рестриктивной кардиомиопатии, врожденных пороках сердца или пороке клапана сердца с выраженными гемодинамическими нарушениями, ХСН с инфарктом миокарда в течение последних 3 месяцев, соблюдении строгой диеты.

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь, утром, независимо от приема пищи. Таблетки следует проглатывать, не разжевывая и запивая небольшим количеством жидкости.

Стандартная схема лечения ХСН включает применение ингибиторов АПФ или антагонистов рецепторов ангиотензина II (в случае непереносимости ингибиторов АПФ), бета-адреноблокаторов, диуретиков и, факультативно, сердечных гликозидов. Предварительным условием для лечения препаратом Кординорм Кор является стабильная ХСН без признаков обострения. Во время фазы титрования или после нее могут наблюдаться временное ухудшение течения сердечной недостаточности, выраженное снижение АД или брадикардия.

Фаза титрования

Начало лечения ХСН препаратом требует обязательного проведения специальной фазы титрования.

Рекомендуемая начальная доза составляет 1.25 мг (1/2 таблетки по 2.5 мг) 1 раз/сут. В зависимости от индивидуальной переносимости дозу следует постепенно повышать до 2.5 мг, 3.75 мг (1.5 таблетки по 2.5 мг), 5 мг, 7.5 мг (3 таблетки по 2.5 мг или 1.5 таблетки бисопролола по 5 мг с риской) и 10 мг 1 раз/сут. Каждое последующее увеличение дозы должно осуществляться не менее чем через 2 недели.

Во время фазы титрования рекомендуется регулярный контроль АД, ЧСС и степени выраженности симптомов ХСН. Усугубление симптомов течения ХСН возможно уже с первого дня применения препарата.

Изменение режима приема

Если пациент плохо переносит максимальную рекомендуемую дозу препарата, возможно постепенное снижение дозы.

В случае усугубления симптомов течения ХСН, при чрезмерном снижении АД и брадикардии рекомендуется, прежде всего, провести коррекцию доз препаратов сопутствующей терапии. Также может потребоваться временное снижение дозы препарата Кординорм Кор или его отмена.

После стабилизации состояния пациента следует провести повторное титрование, либо продолжить лечение.

Если требуется прекращение приема препарата, дозу препарата следует снижать постепенно, поскольку резкая его отмена может привести к внезапному ухудшению состояния пациента.

Лечение препаратом обычно является долговременным.

При **выраженных нарушениях функции почек (КК<20 мл/мин)** и у **пациентов с тяжелыми заболеваниями печени** максимальная суточная доза препарата составляет 10 мг. Увеличение дозы препарата у таких больных должно осуществляться с особой осторожностью. При **нарушении функции печени или почек легкой или умеренной степени** обычно не требуется коррекция дозы.

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

Побочное действие:

Частота побочных реакций, приведенных ниже, распределялась следующим образом: очень часто (≥1/10); часто (≥1/100, <1/10), нечасто (≥1/1000, <1/100), редко (≥1/10 000, <1/1000); очень редко (<1/10 000, включая отдельные сообщения).

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 слезоотделения (следует учитывать при ношении контактных линз); очень редко - конъюнктивит.

Со стороны органа слуха: редко - нарушения слуха.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: очень часто - брадикардия; часто - усугубление симптомов течения ХСН, ощущение похолодания или онемения в конечностях, чрезмерное снижение АД; нечасто - нарушение AV-проводимости, ортостатическая гипотензия.

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

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

Со стороны костно-мышечной системы: 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 обострять течение псориаза или вызывать псориазоподобную сыпь.

Со стороны репродуктивной системы: редко - нарушения потенции.

Со стороны лабораторных показателей: редко - повышение концентрации триглицеридов и активности печеночных трансаминаз в крови (АСТ и АЛТ).

Прочие: часто - астения, повышенная утомляемость.

Передозировка:

Наиболее частые *симптомы* передозировки: AV-блокада, выраженная брадикардия, чрезмерное снижение АД, бронхоспазм, острая сердечная недостаточность и гипогликемия.

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

Лечение

При возникновении передозировки, прежде всего, необходимо прекратить прием препарата и начать поддерживающую симптоматическую терапию.

При выраженной брадикардии - в/в введение атропина. Если 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 обострении течения ХСН - в/в 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:

Применение препарата 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, 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 брадикардии и гипогликемии.

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

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

На эффективность и переносимость бисопролола может повлиять одновременное применение других лекарственных средств. Такое взаимодействие может происходить также в тех случаях, когда два лекарственных средства приняты через короткий промежуток времени. Пациенту необходимо проинформировать врача о применении других лекарственных средств, даже если их прием осуществляется без назначения врача (препараты безрецептурного отпуска).

Нерекомендуемые комбинации

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

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

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 увеличить риск развития рикошетной артериальной гипертензии.

Комбинации, требующие особой осторожности

БМКК - производные дигидропиридина (например, нифедипин, фелодипин, амлодипин) при одновременном применении с бисопрололом могут увеличивать риск развития артериальной гипотензии. У пациентов с ХСН нельзя исключить риск последующего ухудшения сократительной функции сердца.

Антиаритмические средства III класса (например, амиодарон) могут усиливать нарушение AV-проводимости.

Действие бета-адреноблокаторов для местного применения (например, глазных капель для лечения глаукомы) может усиливать системные эффекты бисопролола (снижение АД, урежение ЧСС).

Парасимпатомиметики при одновременном применении с бисопрололом могут усиливать нарушение AV-проводимости и увеличивать риск развития брадикардии.

Гипогликемическое действие инсулина или гипогликемических средств для приема внутрь может усиливаться. Признаки гипогликемии, в частности тахикардия, могут маскироваться или подавляться. Подобное взаимодействие более вероятно при применении неселективных бета-адреноблокаторов.

Средства для проведения общей анестезии могут увеличивать риск кардиодепрессивного действия, приводя к артериальной гипотензии.

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

НПВП могут снижать гипотензивный эффект бисопролола.

Одновременное применение препарата Кординорм Кор с бета-адреномиметиками (например, изопреналин, добутамин) 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. Подобное взаимодействие более вероятно при применении неселективных бета-адреноблокаторов.

Антигипертензивные средства, также как и другие средства с возможным гипотензивным 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 типа В) могут усиливать антигипертензивный эффект бета-адреноблокаторов. Одновременное применение также может привести к развитию гипертонического криза.

Особые указания и меры предосторожности:

Лечение не следует прерывать внезапно, особенно у пациентов с ИБС. Если прекращение лечения необходимо, дозу следует снижать постепенно.

На начальных этапах лечения и в период его прерывания пациенты нуждаются в постоянном наблюдении.

Препарат следует применять с осторожностью в следующих случаях:

- сахарный диабет со значительными колебаниями концентрации глюкозы в крови (симптомы выраженного снижения концентрации глюкозы (гипогликемии) такие как тахикардия, сердцебиение или повышенная потливость могут маскироваться);

- соблюдение строгой диеты;

- проведение десенсибилизирующей терапии;

- AV-блокада I степени;

- стенокардия Принцметала;

- нарушения периферического артериального кровообращения легкой и умеренной степени (в начале терапии может возникнуть усиление симптомов);

- псориаз (в т.ч. в анамнезе).

Дыхательная система

При бронхиальной астме или ХОБЛ показано одновременное применение бронходилатирующих средств. У пациентов с бронхиальной астмой возможно повышение резистентности дыхательных путей, что требует более высокой дозы бета$_2$-адреноблокаторов.

Аллергические реакции

Бета-адреноблокаторы, включая препарат Кординорм Кор, могут повышать чувствительность к аллергенам и тяжесть анафилактических реакций из-за ослабления адренергической компенсаторной регуляции под действием бета-адреноблокаторов. Терапия эпинефрином (адреналином) не всегда дает ожидаемый терапевтический эффект.

Общая анестезия

При проведении общей анестезии следует учитывать риск возникновения блокады β-адренорецепторов. Если необходимо прекратить терапию препаратом перед хирургическим вмешательством, это следует делать постепенно, и завершать за 48 ч до проведения общей анестезии. Следует предупредить врача-анестезиолога о том, что пациент принимает препарат Кординорм Кор.

К настоящему времени недостаточно данных относительно применения бисопролола у пациентов с ХСН в сочетании с сахарным диабетом 1 типа, выраженными нарушениями функции почек и/или печени, рестриктивной кардиомиопатией, врожденными пороками сердца или пороком клапана сердца с выраженными гемодинамическими нарушениями. Также до сих пор не было получено достаточных данных относительно пациентов с ХСН с инфарктом миокарда в течение последних 3 месяцев.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Препарат Кординорм Кор не влияет на способность управлять автотранспортом согласно результатам исследования с участием пациентов с ИБС. Однако вследствие индивидуальных реакций способность управлять транспортными средствами 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.

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/Kordinorm_Kor