Нипертен



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, овальные, двояковыпуклые, с риской на одной стороне.

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

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, карбоксиметилкрахмал натрия, повидон, кремния диоксид коллоидный безводный, магния стеарат.

Состав пленочной оболочки: гипромеллоза, макрогол, титана диоксид, тальк.

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

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с риской на одной стороне.

	1 таб.
бисопролола фумарат (2:1)	5 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, карбоксиметилкрахмал натрия, повидон, кремния диоксид коллоидный безводный, магния стеарат.

Состав пленочной оболочки: гипромеллоза, макрогол, титана диоксид, тальк.

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

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с риской на одной стороне.

	1 таб.
бисопролола фумарат (2:1)	10 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, карбоксиметилкрахмал натрия, повидон, кремния диоксид коллоидный безводный, магния стеарат.

Состав пленочной оболочки: гипромеллоза, макрогол, титана диоксид, тальк.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (10) - 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, снижает AV-проводимость и возбудимость.

При превышении терапевтической дозы оказывает бета$_2$-адреноблокирующее действие.

В начале применения препарата в первые 24 ч ОПСС увеличивается (в результате реципрокного возрастания активности α-адренорецепторов и устранения стимуляции β_2-адренорецепторов), через 1-3 сут возвращается к исходному уровню, а при длительном применении - снижается. Гипотензивный эффект связан с уменьшением минутного объема крови, симпатической стимуляции периферических сосудов, восстановлением чувствительности в ответ на снижение АД и влиянием на ЦНС. При артериальной гипертензии терапевтический эффект наступает через 2-5 дней, стабильное действие отмечается через 1-2 месяца.

Антиангинальный эффект обусловлен уменьшением потребности миокарда в кислороде в результате урежения ЧСС и снижения сократимости миокарда, удлинением диастолы, улучшением перфузии миокарда. За счет повышения конечного диастолического давления в левом желудочке и увеличения растяжения мышечных волокон желудочков может повышаться потребность 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 синусового и эктопического водителей ритма и замедлением AV-проведения (преимущественно в антеградном и, в меньшей степени, в ретроградном направлении 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

Абсорбция составляет 80-90%, прием пищи не влияет на абсорбцию. C_{max} в плазме крови наблюдается через 1-3 ч.

Распределение

Связывание с белками плазмы крови - около 30%. Проницаемость через ГЭБ и плацентарный барьер низкая.

Метаболизм и выведение

50% дозы метаболизируется в печени с образованием неактивных метаболитов.

$T_{1/2}$ составляет 10-12 ч. Около 98% выводится почками, при этом 50% выводится в неизмененном виде; менее 2% - с желчью.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия;

— ИБС: профилактика приступов стенокардии напряжения;

— хроническая сердечная недостаточность.

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Сердечная недостаточность
- Стенокардия

Противопоказания:

— шок (в т.ч. кардиогенный);

— коллапс;

— отек легких;

— острая сердечная недостаточность;

— хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации;

— AV-блокада II и III степени;

— синоатриальная блокада;

— СССУ;

— выраженная брадикардия;

— стенокардия Принцметала;

— кардиомегалия (без признаков сердечной недостаточности);

— артериальная гипотензия (систолическое АД менее 100 мм рт.ст., особенно при инфаркте миокарда);

— тяжелые формы бронхиальной астмы и ХОБЛ в анамнезе;

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

— поздние стадии нарушения периферического кровообращения;

— болезнь Рейно;

— феохромоцитома (без одновременного применения альфа-адреноблокаторов);

— метаболический ацидоз;

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

— повышенная чувствительность к компонентам препарата;

— повышенная чувствительность к другим бета-адреноблокаторам.

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

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь, утром натощак, не разжевывая, однократно.

Артериальная гипертензия и ИБС: профилактика приступов стенокардии напряжения

Рекомендуемая доза составляет 5 мг 1 раз/сут. При необходимости дозу увеличивают до 10 мг 1 раз/сут. Максимальная суточная доза - 20 мг.

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

Коррекции дозы у пациентов пожилого возраста не требуется.

Хроническая сердечная недостаточность

Начало лечения хронической сердечной недостаточности препаратом Нипертен требует обязательного проведения специального периода подбора доз. Предварительные условия для начала терапии следующие:

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

— практически неизменяемая базисная терапия в предшествующие 2 недели;

— лечение оптимальными дозами ингибиторов АПФ (и сосудорасширяющих средств, в случае непереносимости ингибиторов АПФ), диуретиков и, при необходимости, сердечных гликозидов.

Лечение назначают в соответствии с указанной схемой подбора доз. Возможна индивидуальная реакция пациента на назначенную терапию, т.е. дозу можно увеличивать только в случае хорошей переносимости предыдущей дозы.

1 неделя	1.25 мг	1/2 таб. 2.5 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

Максимальная рекомендованная доза препарата Нипертен составляет 10 мг 1 раз/сут. После начала лечения препаратом в дозе 1.25 мг (1/2 таб. 2.5 мг) пациента следует наблюдать в течение около 4 ч (контроль ЧСС, АД, нарушения проводимости на ЭКГ, симптомов ухудшения хронической сердечной недостаточности).

Во время периода подбора доз или после него может произойти временное ухудшение течения хронической сердечной недостаточности, задержка жидкости в организме, артериальная гипотензия или брадикардия. В этом случае рекомендуется, прежде всего, обратить внимание на подбор дозы сопутствующей базисной терапии (оптимизировать дозу диуретика и/или ингибитора АПФ), перед снижением дозы препарата Нипертен. Лечение препаратом следует прерывать только в случае крайней необходимости.

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

Побочное действие:

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: повышенная утомляемость, слабость, головокружение, головная боль, расстройства сна, депрессия, беспокойство, спутанность сознания или кратковременная потеря памяти, галлюцинации, астения, миастения, парестезии в конечностях (у пациентов с перемежающейся хромотой и синдромом Рейно), тремор, судороги.

Со стороны органа зрения: 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, синдром отмены (усиление приступов стенокардии, повышение АД).

Со стороны пищеварительной системы: сухость слизистой оболочки полости рта, тошнота, рвота, боль в животе, запор или диарея, нарушения функции печени (темная моча, желтушность склер или кожи, холестаз), повышение активности АЛТ и АСТ, повышение уровня билирубина, изменения вкуса.

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.

Аллергические реакции: кожный зуд, сыпь, крапивница.

Дерматологические реакции: усиление потоотделения, гиперемия кожи, экзантема, псориазоподобные кожные реакции, обострение симптомов псориаза, алопеция.

Со стороны костно-мышечной системы: судороги (в т.ч. икроножных мышц), боли в спине, артралгия.

Со стороны половой системы: ослабление либидо, снижение потенции.

Со стороны системы кроветворения: тромбоцитопения (необычные кровотечения и кровоизлияния), агранулоцитоз, лейкопения.

Со стороны обмена веществ: повышение содержания триглицеридов.

Передозировка:

Симптомы: аритмия, желудочковая экстрасистолия, выраженная брадикардия, AV-блокада, выраженное снижение АД, хроническая сердечная недостаточность, цианоз ногтей пальцев или ладоней, затруднение дыхания, бронхоспазм, головокружение, обморочные состояния, судороги.

Лечение: промывание желудка и назначение адсорбирующих средств. Симптоматическая терапия: при развившейся AV блокаде - в/в введение 1-2 мг атропина, эпинефрина или временная постановка кардиостимулятора; при желудочковой экстрасистолии - лидокаин (препараты класса I A не применяются); при снижении АД - пациент должен находиться в положении Тренделенбурга; если нет признаков отека легких - в/в введение плазмозамещающих растворов, 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$_2$-адреностимуляторы ингаляционно.

Применение при беременности и кормлении грудью:

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

Данных о выделении бисопролола с грудным молоком нет. Поэтому при необходимости применения препарата в период лактации грудное вскармливание следует прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

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

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

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

Нипертен изменяет эффективность инсулина и гипогликемических средств для приема внутрь, маскирует симптомы развивающейся гипогликемии (тахикардию, повышение АД).

Бисопролол снижает клиренс лидокаина и ксантинов (кроме теофиллина) и повышает их концентрацию в плазме крови, особенно у пациентов с исходно повышенным клиренсом теофиллина под влиянием курения.

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

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 средства могут привести к чрезмерному снижению АД.

Удлиняет действие недеполяризующих миорелаксантов и повышает антикоагулянтный эффект кумаринов.

Три- 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 уменьшает.

Особые указания и меры предосторожности:

Следует контролировать состояние пациентов, получающих Нипертен: 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 пациентов пожилого возраста 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 пациентов с отягощенным бронхолегочным анамнезом.

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

У курильщиков эффективность бета-адреноблокаторов ниже.

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

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

При тиреотоксикозе бисопролол может замаскировать определенные клинические признаки тиреотоксикоза (например, тахикардию). Резкая отмена у больных с тиреотоксикозом противопоказана, поскольку возможно усиление симптомов.

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 применении клонидина его прием может быть прекращен только через несколько дней после отмены препарата Нипертен.

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 хирургическим вмешательством, 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, снижающие запасы катехоламинов (в т.ч. резерпин), могут усилить действие бета-адреноблокаторов, поэтому пациентам, получающим такие сочетания лекарственных средств, требуется постоянное наблюдение врача на предмет выявления выраженного понижения АД или брадикардии.

Пациентам с бронхоспастическими заболеваниями можно назначать кардиоселективные бета-адреноблокаторы в случае непереносимости и/или неэффективности других гипотензивных средств. Передозировка опасна развитием бронхоспазма.

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

лечение.

Рекомендуется прекратить терапию при развитии депрессии.

Нельзя резко прерывать лечение из-за опасности развития синдрома отмены (тяжелой аритмии и инфаркта миокарда). Отмену проводят постепенно, снижая дозу в течение 2 недель и более (снижают дозу на 25% в 3-4 дня).

Нипертен следует отменить перед исследованием содержания в крови и моче катехоламинов, норметанефрина и ванилинминдальной кислоты, титров антинуклеарных антител.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Вопрос о возможности занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания и быстроты психомоторных реакций, следует решать только после оценки индивидуальной реакции пациента на препарат (особенно в начале лечения, в связи с возможностью развития головокружения).

При нарушениях функции почек

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

У пациентов с нарушением функции почек при КК менее 20 мл/мин максимальная суточная доза - 10 мг.

При нарушениях функции печени

С *осторожностью* следует применять препарат при печеночной недостаточности.

У пациентов с выраженными нарушениями функции печени максимальная суточная доза - 10 мг.

Применение в пожилом возрасте

С *осторожностью* следует применять препарат у пациентов пожилого возраста.

Применение в детском возрасте

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

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 30°С. Не использовать препарат после истечения срока годности.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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