

ІНСТРУКЦІЯ ДЛЯ МЕДИЧНОГО ЗАСТОСУВАННЯ ПРЕПАРАТУ

БІСОПРОЛОЛ-КВ

Склад.

Діюча речовина: bisoprolol;

5 мг: 1 таблетка містить бісопрололу фумарату 5 мг;

допоміжні речовини: лактози моногідрат, целюлоза мікрокристалічна, кросповідон, магнію стеарат; барвник заліза оксид жовтий (E 172);

10 мг: 1 таблетка містить бісопрололу фумарату 10 мг;

допоміжні речовини: лактози моногідрат, целюлоза мікрокристалічна, кросповідон, магнію стеарат; барвники заліза оксид жовтий (E 172) і заліза оксид червоний (E 172).

Лікарська форма. Таблетки.

Фармакотерапевтична група. Селективні блокатори β -адренорецепторів. Бісопролол. Код АТС C07A B07.

Клінічні характеристики.

Показання.

- Артеріальна гіпертензія;
- ішемічна хвороба серця (стенокардія);
- хронічна серцева недостатність із систолічною дисфункцією лівого шлуночка у комбінації з інгібіторами АПФ, діуретиками, у разі необхідності – з серцевими глікозидами.

Протипоказання.

Брадикардія з частотою серцевих скорочень менше 60 ударів на хвилину перед початком терапії, синдром слабкості синусового вузла, виражена синоатріальна блокада, AV-блокада II-III ступеня (крім пацієнтів зі штучним водієм ритму), кардіогенний шок, гостра серцева недостатність або серцева недостатність у стадії декомпенсації (які потребують інотропної терапії), артеріальна гіпотензія (сistolічний артеріальний тиск нижче 100 мм рт. ст.), тяжка форма бронхіальної астми або тяжкі хронічні обструктивні захворювання легень, пізні стадії порушення периферичного кровообігу та синдром Рейно, метаболічний ацидоз, феохромоцитома (що не лікувалася), комбінація з флоктафеніном та сультопридом, підвищена чутливість до бісопрололу або до інших компонентів препарату.

Спосіб застосування та дози.

Препарат слід приймати, не розжовуючи, вранці натщесерце або під час сніданку, запиваючи невеликою кількістю рідини.

Артеріальна гіпертензія; ішемічна хвороба серця (стенокардія).

Рекомендована доза становить 5 мг на добу. При необхідності добову дозу можна підвищити до

10 мг на добу. Максимальна рекомендована доза становить 20 мг на добу.

Зміна та коригування дози встановлюється лікарем індивідуально залежно від стану пацієнта.

Препарат обов'язково застосовувати з обережністю пацієнтам з артеріальною гіпертензією або ішемічною хворобою серця, що супроводжується серцевою недостатністю.

Хронічна серцева недостатність із систолічною дисфункцією лівого шлуночка у комбінації з інгібіторами АПФ, діуретиками, при необхідності – серцевими глікозидами.

Стандартна терапія хронічної серцевої недостатності: інгібітори АПФ (або блокатори ангіотензинових рецепторів у разі непереносимості інгібіторів АПФ), блокатори β -адренорецепторів, діуретики і, при необхідності, серцеві глікозиди.

Бісопролол призначати для лікування пацієнтів з хронічною серцевою недостатністю без ознак загострення.

Лікування хронічної серцевої недостатності бісопрололом розпочинається відповідно до поданої нижче схеми титрування та може коригуватися залежно від індивідуальних реакцій організму.

| | | |
|-------------------------------|---------|---|
| 1-й тиждень | 1,25 мг | бісопрололу фумарату 1 раз на добу*. |
| 2-й тиждень | 2,5 мг | бісопрололу фумарату (½ таблетки 5 мг) 1 раз на добу. |
| 3-й тиждень | 3,75 мг | бісопрололу фумарату 1 раз на добу*. |
| 4-7-й тиждень | 5 мг | бісопрололу фумарату (1 таблетка 5 мг) 1 раз на добу. |
| 8-11-й тиждень | 7,5 мг | бісопрололу фумарату (1 ½ таблетки 5 мг) 1 раз на добу. |
| 12 тиждень і подальша терапія | 10 мг | бісопрололу фумарату (1 таблетка 10 мг або 2 таблетки 5 мг) 1 раз на добу як підтримуюча терапія. |

* При необхідності застосування доз 1,25 мг та 3,75 мг використовувати іншу лікарську форму бісопрололу.

Максимальна рекомендована доза бісопрололу фумарату становить 10 мг 1 раз на добу.

На початку лікування стійкої хронічної недостатності необхідно проводити регулярний моніторинг. Протягом фази титрування необхідний контроль за наступними показниками життєдіяльності (артеріальний тиск, частота серцевих скорочень) і симптомами прогресування серцевої недостатності.

Модифікація лікування.

Якщо під час фази титрування або після неї спостерігається погіршення серцевої недостатності, розвивається артеріальна гіпотензія або брадикардія, рекомендується коригування дози препарату, що може потребувати тимчасового зниження дози бісопрололу або, можливо, призупинення лікування. Після стабілізації стану пацієнта лікування препаратом можна продовжувати. Курс лікування препаратом Бісопролол-КВ тривалий.

Не слід припиняти лікування раптово та змінювати рекомендовану дозу без консультації з лікарем, оскільки це може призвести до погіршення стану пацієнта. У разі необхідності лікування препаратом слід завершувати повільно, поступово знижуючи дозу.

Пацієнти з печінковою та нирковою недостатністю.

Артеріальна гіпертензія; ішемічна хвороба серця. Для пацієнтів із порушенням функцій печінки або нирок легкого і середнього ступеня тяжкості підбір дози зазвичай робити не потрібно. Пацієнтам із тяжкою формою ниркової недостатності (кліренс креатиніну менше 20 мл/хв) і пацієнтам із тяжкою формою печінкової недостатності доза не повинна перевищувати добову дозу 10 мг бісопрололу.

Хронічна серцева недостатність. Немає даних щодо фармакокінетики бісопрололу у пацієнтів із хронічною серцевою недостатністю одночасно з порушеннями функції печінки та/або нирок, тому збільшувати дозу необхідно з обережністю.

Пацієнти літнього віку не потребують коригування дози.

Побічні реакції.

Побічні реакції, що іноді можуть виникнути при застосуванні препаратів бісопрололу, класифікуються за такими категоріями:

З боку імунної системи: алергічний риніт, поява антинуклеарних антитіл з такими специфічними клінічними симптомами як вовчакоподібний синдром, що зникав після припинення лікування.

З боку психіки: порушення сну, депресія, нічні кошмари, галюцинації.

З боку метаболізму: підвищення рівня тригліцеридів у крові, гіпоглікемія.

З боку нервової системи: втомлюваність, виснаження, запаморочення, головний біль (особливо на початку лікування, зазвичай слабо виражені і минають протягом 1-2 тижнів), втрата свідомості, парестезії.

З боку органів зору: зниження слезовиділення (що треба враховувати при користуванні контактними лінзами), кон'юнктивіт.

З боку серцево-судинної системи: відчуття холоду або нерухомості кінцівок, артеріальна гіпотензія, погіршення перебігу хвороби Рейно, посилення наявної переміжної кульгавості, брадикардія, порушення атріовентрикулярної провідності, поява/посилення ознак серцевої недостатності, ортостатична гіпотензія.

З боку дихальної системи: бронхоспазм (у пацієнтів з бронхіальною астмою або з хронічними обструктивними захворюваннями легень в анамнезі).

З боку шлунково-кишкового тракту: нудота, блювання, діарея, біль у животі, запор.

З боку гепатобіліарної системи: підвищення активності печінкових ферментів (АлАТ, АсАТ), гепатит.

З боку шкіри та підшкірної тканини: реакції гіперчутливості (висипання, свербіж, еритема, підвищена пітливість), випадання волосся, при лікуванні блокаторами β -рецепторів може спостерігатися погіршення стану хворих на псоріаз у вигляді псоріатичного висипання.

З боку кістково-м'язової системи: м'язова слабкість, судоми.

Інші: погіршення слуху, порушення потенції.

У разі виникнення побічних явищ або небажаних реакцій необхідно негайно проінформувати

лікаря..

Передозування.

Симптоми: артеріальна гіпотензія, брадикардія, гостра серцева недостатність, бронхоспазм, гіпоглікемія. Також були зафіксовані випадки розвитку атріовентрикулярної блокади III ступеня та запаморочення.

Лікування: припинити прийом препарату та провести підтримуюче та симптоматичне лікування. Є обмежені дані, що бісопролол тяжко піддається діалізу. У разі необхідності забезпечити моніторинг дихальної функції; може бути показане штучне дихання.

При бронхоспазмі: бронхолітичні препарати (наприклад ізопреналін) або β 2-адреноміметики та/або амінофілін.

При атріовентрикулярній блокаді II та III ступеня: інфузійне введення ізопреналіну; у разі необхідності – кардіостимуляція.

Погіршення стану при серцевій недостатності: внутрішньовенне введення діуретичних засобів, вазодилататорів.

При брадикардії: внутрішньовенне введення атропіну.

При гіпотензії: прийом судинозвужувальних препаратів та плазмозамінників, внутрішньовенне введення глюкагону. При гіпоглікемії: внутрішньовенне введення глюкози.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Застосування бісопрололу вагітним можливе лише при наявності крайньої необхідності після оцінки співвідношення користі і ризику для матері та плода. Як правило, β -адреноблокатори зменшують кровотік у плаценті та можуть вплинути на розвиток плода. Необхідно контролювати кровотік у плаценті та матці. Після пологів новонароджений повинен знаходитися під ретельним наглядом. Симптоми гіпоглікемії та брадикардії можна очікувати протягом перших 3 діб. Даних щодо проникнення бісопрололу у грудне молоко немає, тому прийом препарату не рекомендується у період годування груддю.

Діти.

Не застосовувати дітям через відсутність клінічного досвіду застосування препарату даній категорії пацієнтів.

Особливості застосування.

Застосовувати з обережністю при AV-блокаді I ступеня, схильності до брадикардії, варіантній стенокардії (Принцметала), порушеннях периферичного кровообігу (у т.ч. синдромі Рейно або переміжній кульгавості), хронічних обструктивних захворюваннях легенів, бронхіальній астмі, цукровому діабеті, гіпоглікемії, тиреотоксикозі, псоріазі, порушеннях функції печінки та нирок, при дотриманні суворої дієти. При необхідності призначення препарату пацієнтам із бронхообструктивним синдромом можливе одночасне застосування β 2-адреноміметиків.

При цукровому діабеті необхідний ретельний контроль рівня глюкози у крові, оскільки

застосування блокаторів β -адренорецепторів може маскувати симптоми гіпоглікемії та потенціювати дію протидіабетичних засобів. При гіперфункції щитовидної залози може маскувати тахікардію, спричинену тиреотоксикозом.

При нирковій недостатності слід контролювати кліренс креатиніну, при порушенні функції печінки – активність печінкових ферментів (аспартатамінотрансферази, аланінамінотрансферази).

При тяжких порушеннях функції печінки, гострій нирковій недостатності (кліренс креатиніну менше 20 мл/хв) хворим, які перебувають на гемо- та перитонеальному діалізі, дозу препарату необхідно зменшити. Бісопролол знижує компенсаторні серцево-судинні реакції у відповідь на застосування загальних анестетиків і йодомістких контрастних речовин.

Як і інші β -блокатори, бісопролол може посилювати чутливість до алергенів та збільшувати анафілактичні реакції. Лікування адреналіном не завжди забезпечує очікуваний терапевтичний ефект.

Для лікування хворих із феохромоцитомою препарат застосовувати лише у поєднанні з блокаторами α -адренорецепторів.

Перед оперативним втручанням необхідно обов'язково попередити лікаря-анестезіолога про прийом блокаторів β -адренорецепторів. Перед проведенням хірургічної операції препарат слід відмінити за 48 годин до введення у наркоз; у разі неможливості відміни бісопрололу слід застосовувати наркотичні засоби з мінімальним негативним інотропним ефектом.

Відміну препарату проводити поступово, упродовж приблизно 2 тижнів, оскільки у хворих на стенокардію при різкій відміні блокаторів β -адренорецепторів спостерігається синдром відміни різного ступеня вираженості (від почастишання та підсилення інтенсивності нападів стенокардії до інфаркту міокарда та порушень ритму серця).

На час терапії рекомендується виключити прийом алкоголю.

Препарат містить лактозу, тому його не слід призначати пацієнтам з рідкісними спадковими формами непереносимості галактози, дефіцитом лактази або синдромом глюкозо-галактозної мальабсорбції. Препарат може давати позитивний результат при проведенні допінг-контролю.

З обережністю застосовувати препарат хворим з артеріальною гіпертензією або стенокардією, які супроводжуються серцевою недостатністю. На даний час немає достатнього терапевтичного досвіду лікування хронічної серцевої недостатності у пацієнтів з такими захворюваннями і патологічними станами: цукровий діабет I типу, тяжкі порушення функції нирок та/або печінки, рестриктивна кардіоміопатія, вроджені пороки серця, гемодинамічно значимі набуті клапанні пороки серця, інфаркт міокарда за останні 3 місяці.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами.

З обережністю застосовувати під час роботи водіям транспортних засобів та особам, робота яких пов'язана з підвищеною концентрацією уваги. Особливу увагу необхідно приділяти на початку лікування, при зміні дози препарату або при взаємодії з алкоголем.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Сумісне застосування препарату з іншими лікарськими засобами може впливати на ефективність і переносимість цих препаратів. Така взаємодія також може виникнути, якщо між прийомами лікарських засобів був короткий проміжок часу. Якщо Ви приймаєте будь-які інші лікарські засоби, включаючи ліки, які Ви придбали без рецепта, обов'язково повідомте про це лікаря.

Комбінації, які не рекомендовано застосовувати.

Лікування хронічної серцевої недостатності.

- Антиаритмічні засоби I класу (наприклад хінідин, дизопірамід, лідокаїн, фенітоїн, флекаїнід, пропафенон): негативний вплив на атріовентрикулярну провідність та інотропну функцію міокарда.

Усі показання.

- Антагоністи кальцію типу верапамілу, меншою мірою – дилтіазему: негативний вплив на скорочувальну функцію міокарда та атріовентрикулярну провідність. Внутрішньовенне введення верапамілу може призвести до вираженої гіпотензії та атріовентрикулярної блокади у пацієнтів, які приймають β-блокатори.

- Гіпотензивні препарати з центральним механізмом дії (клонідин, метилдопа, моксинідин, рилменідин): можуть призвести до погіршення серцевої недостатності. При комбінованій терапії раптова відміна цих засобів може підвищити ризик рефлекторної гіпертензії.

Комбінації, які слід застосовувати з обережністю.

Лікування артеріальної гіпертензії або ішемічної хвороби серця (стенокардії).

- Антиаритмічні засоби I класу (наприклад хінідин, дизопірамід, лідокаїн, фенітоїн, флекаїнід, пропафенон): можуть підвищувати негативний вплив на атріовентрикулярну провідність та інотропну функцію міокарда.

Усі показання.

- Антагоністи кальцію типу дигідропіридину (наприклад ніфедипін, фелодипін, амлодипін): можуть підвищувати ризик виникнення артеріальної гіпотензії. Не виключається можливість зростання негативного впливу на інотропну функцію міокарда у пацієнтів із серцевою недостатністю.

- Антиаритмічні препарати III класу (наприклад аміодарон): можуть підвищувати негативний вплив на атріовентрикулярну провідність.

- β-блокатори місцевої дії (наприклад які містяться в очних краплях для лікування глаукоми): дія бісопрололу може підсилюватися.

- Парасимпатоміметики: може збільшуватися час атріовентрикулярної провідності та підвищується ризик брадикардії.

- Інсулін та пероральні гіпоглікемізуючі засоби: посилюється дія цих препаратів. Ознаки гіпоглікемії можуть бути замасковані. Подібна взаємодія більш вірогідна при застосуванні

неселективних β -блокаторів.

- Засоби для анестезії: підвищується ризик пригнічення функції міокарда і виникнення артеріальної гіпотензії.
- Серцеві глікозиди (препарати наперстянки): можуть знижувати частоту серцевих скорочень, збільшують час атріовентрикулярної провідності.
- Нестероїдні протизапальні засоби (НПЗЗ): можуть послаблювати гіпотензивний ефект бісопрололу.
- β -симпатоміметики (наприклад ізопреналін, добутамін): застосування у комбінації з бісопрололом може призвести до зниження терапевтичного ефекту обох засобів.
- Симпатоміметики, які активують α - і β -адренорецептори (наприклад адреналін, норадреналін): підвищують артеріальний тиск. Подібна взаємодія більш вірогідна при застосуванні неселективних β -блокаторів.
- Антигіпертензивні засоби (наприклад трициклічні антидепресанти, барбітурати, фенотіазин): підвищують ризик гіпотензії.

Потребує підвищеної уваги застосування.

- Мефлохін: може підвищувати ризик розвитку брадикардії.
- Інгібітори MAO (за винятком інгібіторів MAO типу B): підвищують гіпотензивний ефект β -блокаторів. Є ризик розвитку гіпертонічного кризу.

При сумісному застосуванні з похідними ерготаміну посилюється порушення периферичної перфузії. При сумісному застосуванні з рифампіцином можливе незначне зниження часу напіввиведення бісопрололу. Зазвичай немає необхідності у регулюванні дози.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Бісопролол – селективний блокатор β_1 -адренорецепторів без внутрішньої симпатоміметичної активності. Має антигіпертензивну та антиангінальну дію. Механізм антигіпертензивної дії полягає у зниженні хвилинного об'єму серця, зменшенні симпатичної стимуляції периферичних судин і пригніченні вивільнення реніну нирками. Антиангінальна дія пов'язана з блокадою β_1 -адренорецепторів, що призводить до зниження потреби міокарда у кисні за рахунок негативної хронотропної та іотропної дії. Таким чином, бісопролол усуває або зменшує симптоми ішемії.

Фармакокінетика.

Після прийому внутрішньо препарат добре адсорбується зі шлунково-кишкового тракту. Ефект першого проходження через печінку виражений незначною мірою, що сприяє високій біодоступності – близько 90 %. Зв'язування з білками плазми становить близько 30 %. Об'єм розподілу становить 3,5 л/кг. Загальний кліренс бісопрололу становить 15 л/год. Завдяки тривалому періоду напіввиведення – 10-12 годин препарат зберігає терапевтичний ефект

протягом 24 годин після одноразового прийому препарату.

Бісопролол виводиться з організму двома шляхами. Близько 50 % метаболізується у печінці з утворенням неактивних метаболітів, які виводяться нирками. Решта 50 % виводиться нирками у незмінену вигляді. Через приблизно однакову участь нирок та печінки у виведенні цього препарату хворим із нирковою або печінковою недостатністю дозу коригувати не потрібно.

Кінетика бісопрололу лінійна і не залежить від віку.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості:

- 5 мг: таблетки круглої форми з двоопуклою поверхнею, з рисою, коричнювато-жовтого кольору. На поверхні таблеток допускаються вкраплення;
- 10 мг: таблетки круглої форми з двоопуклою поверхнею, з рисою, коричнювато-рожевого кольору. На поверхні таблеток допускаються вкраплення.

Термін придатності. 2 роки.

Умови зберігання. Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С.
Зберігати у недоступному для дітей місці!

Упаковка. По 10 таблеток у блістері; по 3 блістери в пачці.

Категорія відпуску. За рецептом.

