

БИСОТЕКСА таблетки 10мг N30

Категория

Сердечно-сосудистые

Страна происхождения:

- Чешская Республика

Фармакотерапевтическая группа:

- Антигипертензивное средство (бета-адреноблокатор)

Активное вещество:

- Бисопролол

Количество в упаковке:

- 30

Производитель:

- Pro. Med. CS Praha a.s.

Представитель:

- PRO.MED. CS Praha a.s.

Код АТХ:

- C07AB07



Подробная информация о препарате

1. Форма выпуска

Лекарственная форма выпуска: Таблетки 2,5 мг, 5 мг, 10 мг. По 10 таблеток помещают в контурные ячейковые упаковки из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой. По 3 контурных упаковки вместе с инструкцией по медицинскому применению на государственном и русском языках вкладывают в пачку картонную

СОСТАВ:

Одна таблетка 2,5 мг содержит:

Активное вещество - бисопролола фумарат – 2,5 мг.

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая гранулированная, целлюлоза микрокристаллическая, кросповидон, магния стеарат, железа оксид желтый.

Одна таблетка 5 мг содержит:

Активное вещество - бисопролола фумарат – 5 мг.

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая гранулированная, целлюлоза микрокристаллическая, кросповидон, магния стеарат.

Одна таблетка 10 мг содержит:

Активное вещество - бисопролола фумарат – 10 мг.

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая гранулированная, целлюлоза микрокристаллическая, кросповидон, магния стеарат, железа оксид желтый, железа оксид красный.

Описание:

Таблетки круглой формы, двояковыпуклые, желтого цвета, с риской для разлома, диаметром 7 мм (для дозировки 2,5 мг).

Таблетки круглой формы, двояковыпуклые, белого цвета, с риской для разлома, диаметром 7 мм (для дозировки 5 мг).

Таблетки круглой формы, двояковыпуклые, темно-розового цвета, с риской для разлома, диаметром 7 мм (для дозировки 10 мг).

2. Фармокологическое действие

Бисопролол - высокоселективный β_1 - адреноблокатор адренергических рецепторов без собственной симпатомиметической активности и мембраностабилизирующего эффекта. Обладает очень низким сродством к β_2 - адренорецепторам гладкой мускулатуры бронхов, сосудов и β_2 - адренорецепторам, отвечающим за внутриклеточную регуляцию активности ферментов, и следовательно не влияет на тонус дыхательных путей и метаболические процессы.

Общее периферическое сосудистое сопротивление в начале применения препарата, в первые 24 ч, несколько увеличивается (в результате реципрокного возрастания активности альфа-адренорецепторов), которое через 1-3 суток возвращается к исходному, а при длительном назначении снижается.

Оказывает гипотензивное, антиаритмическое и антиангинальное действие.

Гипотензивный эффект связан с уменьшением минутного объема крови, симпатической стимуляции периферических сосудов, снижением активности ренин-ангиотензиновой системы (имеет большое значение для больных с исходной гиперсекрецией ренина), восстановлением чувствительности в ответ на снижение артериального давления (АД) и влиянием на центральную нервную систему (ЦНС). При артериальной гипертензии эффект наступает через 2-5 дней, стабильное действие - через 1-2 месяца.

Антиангинальный эффект обусловлен уменьшением потребности миокарда в кислороде в результате урежения ЧСС, незначительного 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 атриовентрикулярного (AV) проведения (преимущественно в антеградном и, в меньшей степени, в ретроградном направлениях через атриовентрикулярный узел) и по дополнительным путям.

При применении в средних терапевтических дозах, в отличие от неселективных бета-адреноблокаторов, не оказывает выраженное влияние на органы, содержащие бета₂-адренорецепторы (поджелудочная железа, скелетные мышцы, гладкая мускулатура периферических артерий, бронхов и матки) и на углеводный обмен, не вызывает задержки ионов натрия (Na⁺) в организме.

3. Лекарственная форма

Таблетки 2,5 мг; 5,0 мг; 10,0 мг N30 (3x10) (блистеры)

4. Фармакокинетика

Абсорбция

Бисопролол практически полностью всасывается из желудочно-кишечного тракта, и по причине своего невысокого пресистемного метаболизма после первого прохождения печени (около 10%) его биодоступность примерно 90% после перорального приема.

Распределение

Около 30% Бисопролола связывается с белками плазмы. Объем распределения составляет 3.5 л/кг. Общий клиренс бисопролола составляет 15 л/ч. Период полувыведения бисопролола равен 10-12 часам, что обеспечивает 24-часовой эффект действия при одноразовом приеме препарата.

Метаболизм и выведение

Бисопролол выводится из организма двумя способами. 50 % метаболизируется в печени до неактивных метаболитов, которые затем выводятся почками. 50% выводится через почки в неизменном виде. По этой причине нет необходимости в коррекции дозы у пациентов с почечной или печеночной недостаточностью.

У пациентов с хронической сердечной недостаточностью (III класс по NYHA) плазматические концентрации бисопролола выше, а период полувыведения более длительный по сравнению со здоровыми добровольцами. Максимальная концентрация в плазме крови в равновесном состоянии составляет 64 ± 21 нг/мл при суточной дозе 10 мг, а период полураспада

составляет 17 ± 5 часов.

5. Побочные действия

Для характеристики частоты побочных эффектов используется следующая терминология:

Очень часто ($\geq 1/10$)

Часто ($\geq 1/100$, но $< 1/10$)

Нечасто ($\geq 1/1000$, но $< 1/100$)

Редко ($\geq 1/10000$, но $< 1/1000$)

Очень редко ($< 1/10000$)

Частота неизвестна (невозможно определить по имеющимся данным)

При обследовании:

Редко: повышение уровня триглицеридов, повышение уровня ферментов печени (АЛТ, АСТ).

Со стороны сердечно-сосудистой системы:

Очень часто: брадикардия.

Часто: усугубление существующей сердечной недостаточности.

Нечасто: нарушение атриовентрикулярной проводимости.

Часто: ощущение холода или онемения в конечностях (парестезии).

Нечасто: артериальная гипотензия.

Нарушения со стороны нервной системы

Часто: головокружение*, головная боль*.

Редко: обморок.

А также психические расстройства: нечасто: нарушения сна, депрессии.

Редко: ночные кошмары, галлюцинации.

Часто: астения (у пациентов с хронической сердечной недостаточностью), усталость

Нечасто: астения (у пациентов с гипертонией или стенокардией)

Нарушения со стороны органов зрения:

Редко: уменьшение слезоотделения (следует учитывать при ношении контактных линз)

Очень редко: конъюнктивит.

Нарушения со стороны слухового и вестибулярного аппарата:

Редко: Нарушения слуха.

Нарушения со стороны дыхательной системы:

Нечасто: бронхоспазм у пациентов с бронхиальной астмой или обструктивными заболеваниями дыхательных путей.

Редко: аллергический ринит.

Желудочно-кишечные нарушения:

Часто: тошнота, рвота, понос, запор.

Нарушения со стороны кожи и подкожной клетчатки:

Редко: зуд, покраснение, сыпь.

Очень редко: алопеция. Бета-адреноблокаторы могут обострять течение псориаза.

Нарушение со стороны опорно-двигательного аппарата и соединительной ткани:

Нечасто: мышечная слабость и судороги.

Нарушение со стороны печени и желчных путей:

Редко: гепатит.

Нарушения со стороны репродуктивной системы и молочных желез:

Редко: Нарушения потенции.

* Относятся только к гипертонии или к стенокардии: Эти симптомы в основном возникают в начале лечения. Они, как правило, носят умеренный

характер и обычно исчезают в течение 1-2 недель.

6. **Особые условия**

С осторожностью применять препарат при следующих сопутствующих состояниях:

- сахарный диабет со значительными колебаниями уровня глюкозы в крови: симптомы явно сниженного уровня глюкозы (гипогликемии) такие как тахикардия, сердцебиение или потливость могут маскироваться
- строгая диета для уменьшения массы тела;
- продолжающаяся десенсибилизирующая терапия;
- умеренные нарушения атриовентрикулярной проводимости (первая степень AV-блокады);
- нарушения кровотока в коронарных сосудах по причине сосудистого спазма (стенокардия Принцметала);
- периферические окклюзионные поражения артерий (после начала терапии может произойти усиление симптомов);
- пациенты, страдающие псориазом, или имеющие псориаз в анамнезе;
- при бронхиальной астме или других симптоматических хронических обструктивных заболеваниях легких показана сопутствующая бронхорасширяющая терапия. У пациентов с астмой может иногда случаться повышение резистентности дыхательных путей, что требует более высокой дозировки бета2-симпатомиметиков;
- бета-блокаторы, включая Бисотекса®, могут повышать чувствительность к аллергенам и тяжесть анафилактических реакций из-за ослабления адренергической обратной регуляции под действием бета-блокаторов. Лечение адреналином не всегда дает ожидаемый терапевтический эффект.

При общей анестезии анестезиолог должен с осторожностью применять бета-блокаторы у пациентов, подвергающихся общей анестезии. Если необходимо назначить пациенту Бисотекса® перед операцией, это следует делать постепенно, и за полные 48 часов до анестезии.

У пациентов с опухолью надпочечников (феохромцитомой) Бисотекса® может быть назначен только после предшествующей блокады альфа-рецепторов.

При лечении препаратом Бисотекса® больных тиреотоксикозом симптомы гиперфункции щитовидной железы могут маскироваться.

Бисопролол не влиял на способность управлять автомобилем при

исследовании пациентов, страдающих 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.

7. Показания

- артериальная гипертензия;
- ишемическая болезнь сердца: профилактика приступов стенокардии;
- хроническая сердечная недостаточность.

8. Противопоказания

Бисопролол противопоказан в следующих случаях:

Гиперчувствительность к активному веществу препарата или к какому-либо из вспомогательных веществ препарата;
острая сердечная недостаточность или декомпенсация сердечной недостаточности требует в/в инотропной терапии;
кардиогенный шок;
АВ-блокада второй или третьей степени (без кардиостимулятора) ;
синдром слабости синусового узла;
синоатриальная блокада;
симптоматическая брадикардия;
симптоматическая гипотония;
тяжелая бронхиальная астма или тяжелое хроническое обструктивное заболевание легких;
поздние стадии периферических окклюзивных заболеваний артерий, или тяжелые формы синдрома Рейно;
нелеченная феохромоцитома;
метаболический ацидоз.

9. Лекарственное взаимодействие

Не рекомендуемые комбинации

Антиаритмические препараты класса I (например, дизопирамид, хинидин, лидокаин, фенитоин, флекаинид, пропafenон): воздействие на время AV проведения может быть потенцировано, а отрицательный инотропный эффект может быть увеличен.

Антагонисты кальция типа верапамила и в меньшей степени, типа дилтиазема: Отрицательное влияние на сократимость и AV проводимость. Внутривенное введение верапамила у пациентов, получавших бета-блокаторы может привести к тяжелой артериальной гипотензии и AV блокаде.

Центрально действующие антигипертензивные препараты (например, клонидин, метилдопа, моксонодин, рилменидин): одновременное применение антигипертензивных препаратов может ухудшить сердечную недостаточность за счет снижения центрального симпатического тонуса (уменьшение частоты сердечных сокращений и сердечного выброса, вазодилатации). Резкая отмена, особенно перед окончанием лечения бета-блокаторами, может увеличить риск "ребаунд" гипертонии.

Комбинации, которые следует использовать с осторожностью

Относятся только к артериальной гипертензии или к ИБС:

Бета-симпатомиметики (например, изопреналин, добутамин): комбинация с бисопрололом может снизить эффект обоих препаратов.

Относится ко всем показаниям:

Антагонисты кальция типа дигидропиридина (например, нифедипин, фелодипин, амлодипин): одновременное использование может увеличить риск гипотонии и нельзя исключить повышение риска дальнейшего ухудшения насосной функции желудочков у больных с сердечной недостаточностью.

Антиаритмические препараты класса III (например, амиодарон): воздействие на время AV проведения может быть потенцировано.

Локальные бета-блокаторы (например, глазные капли для лечения глаукомы) могут иметь аддитивные системные эффекты.

Парасимпатомиметики: одновременное использование может продлить время AV проводимости и повысить риск развития брадикардии.

Инсулин и пероральные противодиабетические препараты: повышение гипогликемического воздействия. Блокада бета-адренорецепторов может маскировать симптомы гипогликемии.

анестезирующие препараты: ослабление рефлекторной тахикардии и увеличение риска гипотензии

Сердечные гликозиды: уменьшение частоты сердцебиения, увеличение времени AV проведения.

Нестероидные противовоспалительные препараты (НПВП): НПВП могут снижать гипотензивное воздействие бисопролола.

Симпатомиметики, которые активируют как бета, так и альфа-адренорецепторы (например, норадrenalин, адреналин): комбинация с бисопрололом может демаскировать сосудосуживающие эффекты этих веществ, опосредованные альфа-адренорецепторы и вызывать повышение артериального давления и усугублять перемежающуюся хромоту. Эти взаимодействия более вероятны для неселективных бета-блокаторов.

Одновременное применение с антигипертензивными средствами, а также другими препаратами, которые снижают артериальное давление (например, трициклические антидепрессанты, барбитураты, фенотиазины) могут увеличить риск артериальной гипотензии.

Комбинации, требующие осторожности

Мефлохин: повышенный риск развития брадикардии.

Ингибиторы моноаминоксидазы (за исключением MAO-B): повышенный гипотензивный эффект бета-блокаторов и при этом повышенный риск гипертонического криза.

10. Особые условия хранения

В сухом месте при температуре не 15-25°C. Хранить в недоступном для детей месте!

СРОК ГОДНОСТИ:

4 года от даты производства. Не использовать после истечения срока годности.

11. Описание

Бисотекса® 2,5 мг: желтые, круглые, двояковыпуклые таблетки с риской,

делящей ее пополам, диаметром 7 мм. Бисотекса® 5 мг: белые, круглые, двояковыпуклые таблетки с риской, делящей ее пополам, диаметром 7 мм. Бисотекса® 10 мг: темно-розовые, круглые, двояковыпуклые таблетки с риской, делящей ее пополам, диаметром 7 мм. Разделительная риска способствует разламыванию таблетки с целью облегчения ее проглатывания, а не для деления ее на две одинаковые дозы.

12. Дозировка

Таблетки следует принимать с небольшим количеством жидкости утром до завтрака, во время или после него. Таблетки не следует разжевывать или растирать в порошок. Режим приема и дозировку подбирает врач каждому пациенту индивидуально, в частности, учитывая ЧСС.

Лечение артериальной гипертензии и стенокардии

Начальная доза составляет 5 мг один раз в день. При необходимости дозу можно увеличить до 10 мг один раз в день. Максимальная рекомендуемая доза составляет 20 мг Бисотекса® один раз в день.

Лечение хронической сердечной недостаточности

Стандартное лечение ХСН состоит из ингибитора АПФ (или, в случае непереносимости ингибиторов АПФ, блокатора рецепторов к ангиотензину), бета-блокатора, диуретиков, и в случае необходимости сердечных гликозидов. Пациенты в начале лечения Бисотекса® должны быть стабилизированы (без признаков обострения сердечной недостаточности).

Желательно, чтобы лечащий врач имел опыт лечения пациентов с хронической сердечной недостаточностью.

Лечение хронической сердечной недостаточности Бисотекса® начинается в соответствии со следующей схемой титрования. Может потребоваться индивидуальная адаптация в зависимости от того, насколько хорошо пациент переносит назначенную дозу, т.е. дозу можно увеличивать лишь в том случае, если предыдущая доза хорошо переносилась.

Первая неделя: 1,25 мг один раз в день.

Вторая неделя: 2,5 мг один раз в день.

Третья неделя: 3,75 мг один раз в день.

Четвертая - седьмая неделя: 5 мг один раз в день.

Восьмая -Одиннадцатая неделя: 7,5 мг один раз в день.

Двенадцатая неделя и далее: 10 мг один раз в день в качестве поддерживающей терапии.

Максимальная рекомендованная доза при лечении хронической сердечной недостаточности составляет 10 мг Бисотекса® 1 раз в день.

После начала лечения препаратом в дозе 1,25 за пациентом следует наблюдать в течение около 4-х часов (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, прежде всего, обратить внимание на подбор дозы сопутствующей базовой терапии (диуретик и/или ингибитор АПФ), затем снизить дозу Бисотекса®.

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

Лечение препаратом Бисотекса® является длительным, решение об отмене или изменении дозировки препарата принимает только врач! Особенно не следует внезапно прерывать терапию у пациентов с ишемической болезнью сердца. Если приостановка лечения необходима, ежедневная доза должна снижаться постепенно.

13. Применение у детей

В связи с отсутствием опыта по использованию бисопролола у детей, не рекомендуется применять препарат для лечения детей.

14. Передозировка

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

Лечение: прекратить прием препарата Бисотекса®, промыть желудок и назначить адсорбирующие лекарственные средства.

Симптоматическая терапия:

- Брадикардия – внутривенно атропин, при недостаточной реакции с осторожностью можно применить изопреналин или другие средства с положительным хронотропным эффектом. При определенных условиях может быть необходимо трансвенозное введение кардиостимулятора;
- Гипотония – внутривенное введение жидкости и сосудосуживающих препаратов, а также глюкагона;
- Атриовентрикулярная блокада - внутривенное введение 1-2 мг атропина, эпинефрина или постановка временного кардиостимулятора;
- Желудочковая экстрасистолия – лидокаин (препараты IA класса не применяются);

- Сердечная недостаточность - сердечные гликозиды, диуретики, глюкагон;
- Судороги - внутривенно диазепам;
- Бронхоспазм - бета2 – адреностимуляторы ингаляционно;
- Гипогликемия – внутривенное введение глюкозы.

15. При беременности и кормлении

В период беременности Бисотекса® следует рекомендовать только в том случае, если польза для матери превышает риск развития побочных эффектов у плода.

Как правило, 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 три дня жизни могут возникать симптомы снижения уровня глюкозы в крови и ЧСС.

Данных об экскреции бисопролола в грудное молоко или безопасности воздействия бисопролола на грудных детей нет. Поэтому прием препарата Бисотекса® не рекомендуется женщинам в период кормления грудью.

16. При нарушениях функции печени

При выраженных нарушениях функции почек (клиренс креатинина менее 20 мл/мин.) и у пациентов с тяжелыми заболеваниями печени максимальная суточная доза составляет 10 мг.

17. При нарушениях функции почек

При выраженных нарушениях функции почек (клиренс креатинина менее 20 мл/мин.) и у пациентов с тяжелыми заболеваниями печени максимальная суточная доза составляет 10 мг.