

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування препарату

БІСОПРОЛОЛ-ЛУГАЛ

(BISOPROLOL-LUGAL)

Склад:

діюча речовина: bisoprolol;

1 таблетка містить бісопрололу фумарату 5 мг або 10 мг;

допоміжні речовини: лактози моногідрат, таблетоза 80, целюлоза мікрокристалічна, кросповідон, магнію стеарат, барвники «Spectracol Yellow Iron Oxide» (E 172) та «Spectracol Red Iron Oxide» (E 172).

Лікарська форма. Таблетки.

Фармакотерапевтична група.

Селективні блокатори β -адренорецепторів. Бісопролол. Код АТС С07А В07.

Клінічні характеристики.

Показання.

Артеріальна гіпертензія, ішемічна хвороба серця (стабільна стенокардія), хронічна серцева недостатність.

Протипоказання.

Синусова брадикардія (частота серцевих скорочень менше 50 на хвилину), синдром слабкості синусового вузла, атріовентрикулярна блокада II і III ступеня, виражена синоатріальна блокада; кардіогенний шок, декомпенсована серцева недостатність, вазоспастична стенокардія, гострий інфаркт міокарда, артеріальна гіпотензія (систолический артеріальний тиск нижче 90 мм рт. ст.), бронхіальна астма, хронічна обструктивна хвороба легень, виражені порушення периферичного кровообігу, хвороба Рейно, депресія, одночасний прийом інгібіторів моноаміноксидази, метаболічний ацидоз, феохромоцитома, що не лікувалася; вагітність, період годування груддю, дитячий вік, підвищена чутливість до компонентів препарату.

Спосіб застосування та дози.

Препарат застосовувати дорослим внутрішньо, не розжовуючи і запиваючи невеликою кількістю рідини, вранці натще або під час їди.

Дози підбираються індивідуально з урахуванням ефективності лікування і частоти пульсу. Курс лікування – тривалий. Не припиняти лікування раптово, курс повинен закінчуватися повільно, з поступовим зниженням дози.

Рекомендована доза становить 5 мг (1 таблетка по 5 мг) на добу.

При артеріальній гіпертензії III ступеня (діастолічний артеріальний тиск до 105 мм рт. ст.) на початку лікування може бути призначена доза, яка становить 2,5 мг (½ таблетки по 5 мг) на добу.

За необхідності добова доза може бути підвищена до 10 мг (1 таблетка по 10 мг або 2 таблетки по 5 мг).

Збільшення дози допускається лише в окремих випадках.

Максимальна добова доза – 20 мг на добу.

Пацієнти з печінковою та нирковою недостатністю.

Для пацієнтів з порушенням функції печінки або нирок легкого і середнього ступеня тяжкості підбір дози зазвичай робити не потрібно.

Для хворих із вираженим зниженням функції нирок (кліренс креатиніну менше 20 мл/хв) і хворих з тяжкою формою порушень функції печінки доза не повинна перевищувати 10 мг.

Побічні реакції.

Небажані ефекти за частотою виникнення класифікують за такими категоріями:

дуже часто ($> 1/10$), часто ($\geq 1/100$ і $< 1/10$), іноді ($\geq 1/1000$ і $< 1/100$),

рідко ($\geq 1/10000$ і $< 1/1000$), дуже рідко ($< 1/10000$).

З боку серцево-судинної системи: дуже часто – брадикардія (у пацієнтів з хронічною серцевою недостатністю); часто – відчуття холоду або нерухомості кінцівок, декомпенсація серцевої недостатності на початку лікування (у пацієнтів з хронічною серцевою недостатністю), іноді – порушення AV-провідності (у пацієнтів з артеріальною гіпертензією та ішемічною хворобою серця), ортостатична гіпотензія.

З боку нервової системи: часто – запаморочення, головний біль (особливо на початку терапії, звичайно слабо виражені і зникають впродовж 1-2 тижнів); іноді – порушення сну, депресії; рідко – галюцинації, парестезії.

З боку органа зору: рідко – зниження сльозовиділення (слід враховувати при носінні контактних лінз); дуже рідко – кон'юнктивіт.

З боку органа слуху: рідко – погіршення слуху.

З боку дихальної системи: іноді – бронхоспазм (у пацієнтів з бронхіальною астмою в анамнезі та хронічними обструктивними захворюваннями дихальних шляхів); рідко – алергічний риніт.

З боку системи травлення: часто – діарея, запор, нудота, блювання; рідко – порушення метаболізму (підвищення рівня тригліцеридів у крові), підвищення активності печінкових ферментів (АСТ, АЛТ), гепатит.

З боку шкіри та кістково-м'язової системи: іноді – м'язова слабкість, судоми; рідко – свербіж, підвищена пітливість, висипання; дуже рідко – випадіння волосся, при лікуванні блокаторами β -рецепторів може спостерігатись погіршення стану хворих на псоріаз у вигляді псоріатичного висипу.

З боку статевої системи: рідко – порушення потенції.

Загальні розлади: часто – астенія (у пацієнтів з хронічною серцевою недостатністю), втомлюваність (особливо на початку терапії, звичайно слабо виражені і зникають впродовж 1-2 тижнів); іноді – астенія (у пацієнтів з артеріальною гіпертензією та ішемічною хворобою серця).

Передозування.

Симптоми: брадикардія, артеріальна гіпотензія, порушення AV-провідності, декомпенсація, загострення симптомів серцевої недостатності, бронхоспазм, гіпоглікемія, акроціаноз, судоми.

Лікування: промивання шлунка, прийом активованого вугілля, підтримуюча та симптоматична терапія.

При брадикардії: внутрішньовенне введення атропіну.

При гіпотензії: прийом судинозвужувальних препаратів, внутрішньовенне введення глюкагону.

При AV-блокаді II і III ступеня: інфузійне введення орципреналіну, при необхідності – кардіостимуляція.

Погіршення стану при серцевій недостатності: внутрішньовенне введення діуретиків.

При бронхоспазмі: бронхолітичні препарати (орципреналін), β -адреноміметики та/або еуфілін.

При гіпоглікемії: внутрішньовенне введення глюкози.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Прийом препарату під час вагітності протипоказаний. У період лікування препаратом годування груддю необхідно припинити.

Діти. Препарат протипоказаний дітям до 18 років.

Особливості застосування.

Лікування препаратом слід проводити під регулярним медичним контролем, контролюючи рівень артеріального тиску, частоту серцевих скорочень, AV-провідність за показниками електрокардіограми. При цукровому діабеті необхідний контроль рівня глюкози в крові, бо застосування блокаторів β -адренорецепторів може маскувати симптоми гіпоглікемії і модифікувати дію протидіабетичних засобів.

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- і перитонеальному діалізі, дозу необхідно зменшити.

Препарат застосовують з обережністю при АВ-блокаді I ступеня, схильності до брадикардії, порушеннях периферичного кровообігу, цукровому діабеті, гіпоглікемії, тиреотоксикозі, порушеннях функції печінки і нирок, міастенії (у т. ч. в анамнезі).

У пацієнтів, які мають тяжкі алергічні реакції (у т. ч. в анамнезі), а також у пацієнтів, котрі отримують десенсибілізуючу терапію, бісопролол застосовують з обережністю, бо послаблення адренергічної реактивності в період лікування бісопрололом може сприяти більш тяжкому перебігу алергічних реакцій. Призначення бісопрололу хворим на псоріаз (у т. ч. в анамнезі) можливе лише після ретельного визначення співвідношення очікуваного клінічного ефекту і можливих шкірних реакцій.

Застосування бісопрололу при наявності ацидозу вимагає особливої обережності.

При гіперфункції щитовидної залози бісопролол може маскувати тахікардію, спричинену тиреотоксикозом.

При необхідності призначення препарату пацієнтам з бронхообструктивним синдромом можливе одночасне застосування β_2 -адреноміметиків. Для лікування хворих з тяжкою формою фео-хромоцитоми препарат застосовують лише в поєднанні з блокаторами α -адренорецепторів.

Перед проведенням хірургічної операції препарат слід відмінити за 48 годин до введення наркозу; у разі неможливості відміни бісопрололу слід застосувати наркотичні засоби з мінімальним негативним інотропним ефектом.

Припинення приймання препарату проводять поступово під контролем артеріального тиску та частоти серцевих скорочень, бо при раптовому припиненні приймання блокаторів β -адренорецепторів спостерігається синдром відміни, який має різний ступень вираженості (підсилення артеріального тиску, посилення нападів стенокардії і порушень ритму серця).

Препарат дає позитивний результат при проведенні допінг-контролю.

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

У разі появи (особливо на початку лікування) таких побічних ефектів як стомлюваність, запаморочення, галюцинації, порушення зору, слід утриматись від діяльності, яка потребує підвищеної уваги та швидкої реакції.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Препарат підсилює дію інших антигіпертензивних препаратів (інгібіторів ангіотензинперетворюючого ферменту, антагоністів кальцію, діуретиків). На фоні прийому аміодарону, дилтіазему, верапамілу, хінідину, серцевих глікозидів, резерпіну, α -метилдофи зростає імовірність порушень автоматизму, провідності і скоротливості серця. Одночасне застосування з похідними ерготаміну потенціює порушення периферичного кровообігу. При поєднаному застосуванні бісопрололу з клонідином, гуанфацином можлива поява вираженої брадикардії, уповільнення АВ-провідності, з антиаритмічними засобами – підвищується ризик кардіодепресивної дії і брадикардії. При одночасному застосуванні з парасимпатоміметичними препаратами може збільшуватися час АВ-провідності та підвищується ризик брадикардії. Не рекомендується одночасне застосування бісопрололу і β -блокаторів (які містяться в очних краплях для лікування глаукоми) у зв'язку з можливим підсиленням дії бісопрололу. Одночасне призначення дигідропіридинових антагоністів кальцію, особливо у хворих з латентною серцевою недостатністю, підвищує ризик гіпотензії і декомпенсацій серцевої діяльності, через що внутрішньовенне введення антагоністів кальцію і антиаритмічних препаратів під час лікування бісопрололом не рекомендується. Бісопролол знижує компенсаторні серцево-судинні реакції у відповідь на застосування загальних анестетиків і йодовмісних контрастних речовин. Ефективність препарату може знижуватися на фоні прийому нестероїдних протизапальних засобів і кортикостероїдів.

Бісопролол може підсилювати дію алергенів, які застосовують для лікування та діагностики. Дія інсуліну, пероральних гіпоглікемізуючих препаратів може модифікуватись при одночасному застосуванні з бісопрололом. Бісопролол послаблює терапевтичні ефекти ксантинів, α -адреноміметиків, рифампіцину, які, у свою чергу, при одночасному застосуванні з бісопрололом скорочують період його напіввиведення.

Рифампіцин дещо прискорює метаболізм бісопрололу, проте це, як правило, не потребує корекції дозування останнього. Циметидин збільшує плазмову концентрацію бісопрололу. При одночасному застосуванні з β -симпатоміметиками (добутамін, орципреналін) знижується ефект обох засобів. Симпатоміметики, які активують α - і β -адренорецептори (адреналін, норадреналін), підвищують артеріальний тиск та підсилюють явища переміжної кульгавості.

Бісопролол несумісний з інгібіторами моноаміноксидази (ніаламід, піразидол, інказан тощо). Не рекомендується одночасне застосування бісопрололу із засобами, що пригнічують центральну нервову систему (барбітуратами, фенотіазинами, трициклічними антидепресантами, баклофеном, недеполяризуючими блокаторами нейро- і м'язової передачі, а також засобами для інгаляційного наркозу – похідними вуглеводнів).

Під час терапії не слід вживати алкоголь.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Антигіпертензивний та антиангінальний засіб. Селективний β_1 -адреноблокатор. При застосуванні в терапевтичних дозах не проявляє симпатоміметичну активність і клінічно значущі мембраностабілізуючі властивості.

Виявляє антиангінальну дію. Зменшує потребу міокарда в кисні за рахунок зниження частоти серцевих скорочень, зменшення серцевого викиду і зниження артеріального тиску. Збільшує постачання міокарда киснем за рахунок зменшення кінцевого діастолічного тиску і подовження діастолі. Зменшує автоматизм синусового вузла, збільшує тривалість рефрактерного періоду, незначно уповільнює АВ-провідність, зменшує частоту серцевих скорочень у спокої і при фізичному навантаженні.

Чинить гіпотензивну дію за рахунок зменшення серцевого викиду, гальмування секреції реніну нирками, впливаючи на барорецептори дуги аорти і каротидного синуса. При тривалому прийомі препарат знижує початково збільшений загальний периферичний опір судин.

При хронічній серцевій недостатності пригнічує активізовану симпато-адреналову і ренін-ангіотензин-альдостеронову систему, підвищена активність якої призводить до прогресу захворювання.

Препарат має дуже низьку спорідненість з β_2 -рецепторами гладенької мускулатури бронхів і судин і з β рецепторами ендокринної системи. Препарат практично не впливає на метаболізм глюкози, а також на ліпідний спектр сироватки крові.

Антигіпертензивна дія досягає максимуму через 3-4 години і триває 24 години, стабілізуючись при регулярному прийомі препарату до кінця другого тижня.

Фармакокінетика. Всмоктується із шлунково-кишкового тракту практично повністю (80-90% прийнятої дози), їжа не впливає на біодоступність. Максимальна концентрація досягається через 2-4 години. Зв'язування з білками плазми становить майже 30 %. Проникає крізь гематоенцефалічний бар'єр, виділяється з грудним молоком (менше 2 % введеної дози). При першому проходженні крізь печінку 20 % бісопрололу трансформується в неактивні метаболіти. Понад 98 % препарату екскретується нирками (50 % – у незміненому вигляді, решта – у вигляді неактивних метаболітів), 2 % – кишечником. Період напіввиведення препарату становить 10-12 годин, у пацієнтів літнього віку збільшується. Тривалий період напіввиведення забезпечує терапевтичний ефект протягом 24 годин при прийомі один раз на добу. Порушення функції нирок і печінки супроводжується збільшенням періоду напіввиведення і кумуляцією бісопрололу (при кліренсі креатиніну нижче 40 мл/хв період напіввиведення зростає у 3 рази, при цирозі печінки – до 21,7 години), тому при недостатності функції нирок та печінки потрібна корекція добової дози.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості: таблетки 5 мг – плоскоциліндричної форми з шорсткою поверхнею, з фаскою та рисою, від світло-бежевого до світло-коричневого кольору, допускаються вкраплення майже білого та червоно-коричневого кольору;

таблетки 10 мг – круглої форми з двоопуклою шорсткою поверхнею, з фаскою та рисою, від світло-бежевого до світло-коричневого кольору, допускаються вкраплення майже білого та червоно-коричневого кольору.

Термін придатності. 4 роки.

Умови зберігання.

Спеціальні умови зберігання не потрібні. Для захисту від дії вологи та світла зберігати в оригінальному пакуванні.

Зберігати в недоступному для дітей місці!

Упаковка.

По 10 таблеток у блістері. 3 блістери в пачці.

Категорія відпуску.

За рецептом.

Виробник.

ПАТ «Луганський хіміко-фармацевтичний завод».

Місцезнаходження.

Україна, 91019, м. Луганськ, вул. Кірова, 17.