

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

**BLOKBIS
БЛОКБИС**

ИЗДАНИЕ: ИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1
№ на продукта: 20100130
Разрешение № П-7046, 25. 02. 2010
Одобрение №

1. ТЪРГОВСКО ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Blokbis 10 mg tablets
Блокбис 10 mg таблетки

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всяка таблетка съдържа 10 mg bisoprolol hemifumarate (бисопрололов хемифумарат)
За пълния списък на помощните вещества, вижте раздел 6.1

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Таблетки.

Таблетките са с бежов цвят, пъстри, кръгли, изпъкнали, със следната идентификационна маркировка: ВІ в средата над делителната черта и цифрата 5 под нея.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Показания

Хипертония.
Хронична стабилна ангина пекторис.

4.2 Дозировка и начин на употреба

Bisoprolol 10 mg таблетки са предназначени за перорално приложение.

Дозировката трябва да се коригира индивидуално. Препоръчва се лечението да започне с най-ниската възможна доза. При някои пациенти, 5 mg дневно може да са достатъчни. Обичайната доза е 10 mg веднъж дневно при максимална препоръчителна доза от 20 mg дневно.

Пациенти с увредена бъбречна функция

При пациенти с тежки бъбречни нарушения, (креатининов клирънс <20 ml/min) дозата не трябва да надвишава 10 mg веднъж дневно. Тази доза може да бъде разделена на две.

Пациенти с чернодробни увреждания

Не се налага коригиране на дозата, препоръчва се, обаче, стриктно наблюдение на пациента.

Пациенти в старческа възраст

Обикновено не се налага коригиране на дозата. Препоръчва се лечението да започне с най-ниската възможна доза.



Деца под 12 години и юноши

Няма опит с това лекарство при деца, ето защо неговата употреба не се препоръчва.

Прекратяване на лечението

Лечението не трябва да се спира внезапно (вижте раздел 4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба). Дозировката трябва да се намалява бавно, чрез седмично намаляване на дозата на половина.

4.3 Противопоказания

- Остра сърдечна недостатъчност или по време на епизоди от декомпенсирана сърдечна недостатъчност, изискваща венозна инотропна терапия
- Кардиогенен шок
- AV блок от втора или трета степен (без пейсмейкър)
- Синдром на болния синусов възел
- Синоатриален блок
- Брадикардия с по-малко от 60 удара/мин преди началото на терапията
- Хипотония (систолично артериално налягане под 100 mm Hg)
- Тежка бронхиална астма или хронична обструктивна белодробна болест
- Последни стадии на периферно артериално оклузивно заболяване и синдром на Рейно
- Метаболитна ацидоза
- Свръхчувствителност към бисопролол или към някое от изброените помощни вещества
- Нелекуван феохромоцитом (вижте 4.4)
- Комбинация с флоклафенин и султопирид (вижте също раздел 4.5)

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

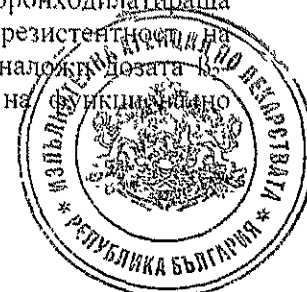
Други дозировки на бисопролол-съдържащи лекарствени продукти се използват в лечението на хронична сърдечна недостатъчност. Употребата на бета-блокери при това показание изисква много внимателен подход и трябва да започне с фаза на много стриктно титриране. В тази фаза се налага увеличаване, което не е възможно да се постигне с този лекарствен продукт. Ето защо, този продукт не трябва да се използва за лечение на хронична сърдечна недостатъчност.

Комбинацията с амиодарон трябва да се използва внимателно, като се има предвид риска от съкратителен автоматизъм и проводни нарушения (потискане на компенсаторни симпатикови реакции).

Комбинираната употреба на бисопролол с калциеви антагонисти от верапамилон и дилтиаземов тип, и с централно действащи антихипертензивни лекарства обикновено не се препоръчва (вижте също раздел 4.5).

Бисопролол трябва да се използва с повишено внимание при:

- Бронхоспазъм (бронхиална астма, заболявания с обструкция на дихателните пътища): При бронхиална астма или други хронични заболявания с обструкция на дихателните пътища, трябва да се прилага едновременно бронходилатираща терапия. Понякога може да се наблюдава увеличена резистентност на дихателните пътища при астматици, ето защо може да се наложи дозата на стимуланти да се увеличи. Препоръчва се провеждането на изследване на дишането преди началото на терапията.



- Едновременната употреба с антихолинестеразни средства (включително такрин): времето за провеждане през атриовентрикуларния възел и/или брадикардията може да се увеличат (вижте също раздел 4.5).
- Едновременната употреба с анестетици: отслабване на рефлексната тахикардия и увеличаване риска от хипотония (вижте също раздел 4.5). Продължаването на β -блокадата намалява риска от аритмия при увода в анестезия и по време на интубация. Анестезиологът трябва да е информиран, когато пациентът приема биспролол.
- Йодирани контрастни продукти: Бета-блокери могат да забавят сърдечно-съдовите реакции, свързани с хипотония или шок, индуциран от йодирани контрастни продукти.
- Захарен диабет с големи вариации в стойностите на кръвната захар: симптомите на хипогликемия може да бъдат маскирани. Нивата на кръвната захар трябва да се следят по време на лечение с биспролол.
- Тиреотоксикоза, адренергичните симптоми може да се маскират.
- Строго постене.
- Десенсибилизация: Подобно на другите β -блокери, биспролол може да увеличи чувствителността към алергени и тежестта на анафилактичните реакции. Лечението с адреналин не винаги дава очаквания терапевтичен ефект. Може да се наложи прилагането на по-високи дози епинефрин (адреналин).
- AV блок първа степен.
- Ангина на Prinzmetal: β -блокери могат да доведат до увеличаване броя и продължителността на пристъпите при пациенти с ангина на Prinzmetal. Употребата на селективни β_1 -адренорецепторни блокери е възможна в случаен на умерени форми и само в комбинация с вазодилатиращо средство.
- Периферни циркулаторни нарушения, като феномен на Рейно и клаудикацио интермитенс: засилване на оплакванията може да настъпи, особено в началото на терапията.
- При пациенти с феохромоцитом (вижте раздел 4.3), биспролол трябва да се прилага само след α -рецепторна блокада.
- При псориазис, биспролол трябва да се назначава само след щателна оценка на съотношението полза/риск.

Началото на терапията с биспролол изисква редовно мониториране, особено при лечение на болни в старческа възраст. Спирането на лечението с биспролол не трябва да става внезапно, освен ако няма ясни показания за това. Има риск от инфаркт на миокарда и внезапна смърт, ако лечението се прекрати рязко при пациенти с исхемична болест на сърцето. За повече информация, моля вижте раздел 4.2 Дозировка и начин на употреба.

Този лекарствен продукт съдържа активно вещество, което води до позитивиране на теста при антидопинг контролите.

Този лекарствен продукт съдържа 65 mg лактоза монохидрат. Ето защо той не трябва да се използва от пациенти с редки наследствени проблеми на галактозна непоносимост, лактазна непоносимост на Lapp, лактазен дефицит на Lapp или глюкозо-галактозна малабсорбция.

4.5 Лекарствени и други взаимодействия

Противопоказани комбинации

Флоктафенин: бета-блокери могат да забавят компенсаторните реакции, свързани с хипотония или шок, индуцирани от флоктафенин.
 Сулгопирид: биспролол не трябва да се прилага едновременно със сулгопирид, като има повишен риск от камерна аритмия.



Комбинации, които не се препоръчват

Калциеви антагонисти (верапамил, дилтиазем, бепридил): отрицателно влияние върху контрактилитета, атриовентрикуларното провеждане и кръвното налягане (вижте също раздел 4.4).

Клонидин и други централнодействащи антихипертензивни лекарства, напр. метилдопа, гуанфацин, моксонидин, рилменидин: Повишен риск от „повторна хипертония“, както и силно понижаване на сърдечната честота и провеждане, включително влошаване на сърдечната недостатъчност.

Моноаминооксидазни инхибитори (с изключение на MAO-B инхибиторите): Засилен хипотензивен ефект на бета-блокери, но и риск от хипертензивни кризи.

Комбинации, изискващи повишено внимание

Клас I антиаритмични средства (напр. дизопирамид, хинидин): ефектът върху времето за провеждане през атриовентрикуларния възел може се засили, а отрицателният инотропен ефект може да се увеличи. (Необходимо е стриктно клинично и ЕКГ мониториране).

Клас III антиаритмични средства (напр. амиодарон): ефектът върху атриалното проводно време може да се засили (вижте раздел 4.4).

Калциеви антагонисти (дихидропиридинови производни): увеличен риск от хипотония. При пациенти с латентна сърдечна недостатъчност, едновременната употреба на β -блокери може да доведе до сърдечна недостатъчност.

Антихолинестеразни средства (включително такрин): времето за провеждане през атриовентрикуларния възел и/или брадикардията може да се увеличат (вижте също раздел 4.4).

Други β -блокери, включително очни капки, имат адитивни ефекти.

Инсулин и орални антидиабетични средства: засилване ефекта на понижаване на кръвната захар. Блокадата на β -адренорецепторите може да маскира симптоми на хипогликемия.

Дигиталисови гликозиди: намаляване на сърдечната честота, увеличаване на времето за провеждане през атриовентрикуларния възел.

Анестетици: отслабване на рефлексната тахикардия и повишен риск от хипотония (за повече информация относно анестетици вижте също раздел 4.4).

Ерготаминови производни: влошаване на периферните циркулаторни нарушения.

Бета-симпатомиметици (напр. изопреналин, добутамин): комбинацията с бисопролол може да намали ефектите и на двете лекарства.

Трициклични антидепресанти, барбитурати, фенотиазини, както и други антихипертензивни средства: повишен ефект на намаляване на кръвното налягане.

Баклофен: повишена антихипертензивна активност.

Амифостин: повишена хипотензивна активност.

НСПВС: отслабване на антихипертензивния ефект (потискане на вазодилатативен простагландин от НСПВС и водна и солева задръжка с пиразолонови НСПВС)

Да се имат предвид и следните комбинации

Мефлокин: повишен риск от брадикардия.

Кортикостероиди: отслабване на антихипертензивния ефект поради задържане на вода и натрий).

4.6 Бременност и кърмене

Бременност:



Бисопролол има фармакологични ефекти, които могат да навредят на бременността и/или на плода/новороденото. Като цяло, β -адренорецептор блокерите намаляват плацентарната перфузия, което се свързва със забавяне на растежа, интраутеринна смърт, аборт или преждевременно раждане. Нежелани реакции (напр. хипогликемия, брадикардия) могат да настъпят в плода и новороденото. Ако лечението с β -адренорецептор блокерите е необходимо, предпочитат се β_1 -блокери.

Бисопролол не трябва да се използва по време на бременност, освен ако не е необходимо. Ако се прецени, че е нужно лечение с бисопролол, трябва да се мониторира утероплацентарния кръвоток и феталния растеж. В случай на неблагоприятни ефекти върху бременността или плода, трябва да се обмисли алтернативно лечение. Новороденото трябва да бъде под наблюдение. Симптоми на хипогликемия и брадикардия обикновено се очакват през първите 3 дни.

Кърмене:

Не е установено дали бисопролол се екскретира в човешкото мляко. Ето защо не се препоръчва кърмене, когато се приема бисопролол.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

В проучване с пациенти с коронарна болест на сърцето, бисопролол не е попречил на способността за шофиране. Въпреки това, поради индивидуалните различия в реакциите към лекарствени продукти, способността за шофиране и работа с машини може да се влоши. Това трябва да се има предвид особено в началото на терапията и при смяна на лекарствата, както и при употреба с алкохол.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Установените нежелани лекарствени реакции обикновено се обясняват с фармакологичните свойства на β -блокери.

Наблюдавани са следните нежелани лекарствени реакции по време на лечение с бисопролол със следните честоти:

Много чести ($\geq 10\%$), чести ($\geq 1\%$ и $< 10\%$), нечести ($\geq 0.1\%$ и $< 1\%$), редки ($\geq 0.01\%$ и $< 0.1\%$), много редки ($< 0.01\%$) включително изолирани съобщения.

Неврологични симптоми

Чести: Умора, изтощение, замаяност, главоболие (особено в началото на терапията, те са обикновено умерени и често изчезват за 1-2 седмици).

Съдови нарушения

Чести: Чувство на студ или изтръпване на крайниците, синдром на Рейно, влошаване на съществуващо клаудикацио интермитенс

Нечести: ортостатична хипотония

Редки: хипотония

Стомашно-чревни смущения

Чести: Гадене, повръщане, диария, коремна болка и запек

Психиатрични нарушения

Нечести: нарушения в съня, депресия

Редки: Кошмари, халюцинации

Сърдечни нарушения

Нечести: Брадикардия, нарушение на AV-стимула (забавено AV провеждане или влошаване на съществуващ AV-блок), влошаване на сърдечна недостатъчност



Дихателни, торакални и медиастинални нарушения

Честоти: Бронхоспазъм при пациенти с бронхиална астма или анамнеза за заболяване с обструкция на дихателните пътища

Мускулоскелетни нарушения и нарушения в съединителната тъкан

Честоти: Мускулна слабост и крампи, артропатия

Нарушения в слуха и равновесието

Редки: влошаване на слуха

Заболявания на кожата и подкожната тъкан

Редки: Реакции на свръхчувствителност (сърбеж, почервяване, обрив)

Много редки: β -блокери могат да причинят или влошат псориазис или индуцират псориазоподобен обрив, алоpecia

Очни нарушения

Редки: намалено сълзотечение (да се прецени ако пациентът носи лещи)

Много редки: Конюнктивит

Хепатобилиарни смущения

Редки: Повишени чернодробни ензими (ALAT, ASAT), хепатит

Метаболитни и хранителни нарушения

Редки: повишени триглицериди, хипогликемия

Много редки: хипогликемичен шок

Заболявания на репродуктивната система и гърдите

Редки: смущения в потентността

Заболявания на имунната система

Редки: Алергичен ринит, появата на антинуклеарни антитела с изключителни клинични симптоми като лупус синдром, които изчезват при спиране на лечението.

4.9 Предозиране

Най-честите признаци на предозиране на биспролол са брадикардия, хипотония, бронхоспазъм, остра сърдечна недостатъчност и хипогликемия. В случай на предозиране, лечението с биспролол трябва да се спре и да се осигури поддържащо и симптоматично лечение. Трябва да се избегне резорбцията на биспролол в стомашно-чревния тракт; стомашна промивка или прилагане на адсорбенти (напр. активен въглен) и лаксативи (напр. натриев сулфат). Дишането трябва да се мониторира и при нужда, да се предприеме изкуствено дишане. Бронхоспазмът трябва да се предотврати чрез бронходилататорна терапия като изопреналин или β_2 -симпатомиметици. Сърдечно-съдовите усложнения трябва да се лекуват симптоматично: AV-блок (втора или трета степен) трябва да се наблюдава и лекува с инфузии изопреналин или трансвенозно поставяне на пейсмейкър. Брадикардията трябва да се лекува с атропин венозно (или M-метил-атропин). Понижено кръвно налягане или шок трябва да се лекуват с плазма заместващи продукти и вазопресори. Хипогликемията може да се лекува с глюкоза интравенозно.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства



Фармакотерапевтична група: селективни β 1-блокери. АТС код: С07АВ07

Бисопролол е мощен, високо селективен β -блокери, лишен от вътрешна симпатомиметична активност. Както и при другите β -блокери, начинът на действие при хипертония не е ясен. Въпреки това, е известно, че бисопролол изразено потиска плазмената ренинова активност.

При пациенти с ангина, блокадата на β -рецепторите редуцира сърдечната дейност и по този начин намалява кислородните нужди.

Бисопролол притежава сходни с пропранолол локални анестетични свойства.

5.2 Фармакокинетични свойства

Бисопролол се резорбира почти напълно в стомашно-чревния тракт. Заедно с изключително слаб метаболитизъм при първото преминаване през черния дроб, това води до висока бионаличност от приблизително 90%. Свързването с плазмените протеини на бисопролол е около 30%. Обемът на разпределение е 3.5 l/kg. Общият клирънс е приблизително 15 l/h. Плазменният полуживот (10-12 часа) осигурява 24-часова ефикасност при дозиране веднъж дневно.

Бисопролол се екскретира от тялото по два пътя. 50% се метаболизира в черния дроб до неактивни метаболити, които впоследствие се екскретират през бъбреците. Останалите 50% се екскретират през бъбреците в неметаболизирана форма. Тъй като лекарственият продукт се елиминира през бъбреците и черния дроб в еднаква степен, не се налага коригиране на дозата за пациенти с чернодробна или бъбречна недостатъчност.

Кинетиката на бисопролол е линейна и не зависи от възрастта.

При пациенти с хронична сърдечна недостатъчност (стадий III по NYHA) плазменните нива на бисопролол са по-високи и полуживотът е удължен, в сравнение със здрави доброволци. Максималната плазмена концентрация в равновесно състояние е 64 ± 21 ng/ml при дневна доза от 10 mg, а времето на полуживот е 17 ± 5 часа.

5.2 Предклинични данни за безопасност

Предклиничните данни за безопасност не разкриват риск за хора, на базата на конвенционални проучвания на фармакологичната безопасност, дозова токсичност, генотоксичност или карциногенност. Както другите β -блокери, бисопролол води до майчина (понижен прием на храна или понижено телесно тегло) и ембрио/фетотоксичност (повишен риск от резорбция, намалено тегло при раждане, забавено физическо развитие) при високи дози, но не е тератогенен.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества и техните количества

Лактоза монохидрат

Целулоза, микрокристална

Магнезиев стеарат

Кросповидон

Бежов РВ 27215 (лактоза монохидрат и железен оксид, червен и жълт (E172))

6.2 Физико-химични несъвместимости

Не са установени.

6.3 Срок на годност



3 години.

6.4 Специални условия за съхранение

Няма специални условия за съхранение.

6.5 Данни за опаковката

Влокбис 10 mg таблетки се предлагат в:

Блистери от PVC/PVdC/алуминиево фолио, поставени в картонена кутия. Всяка кутия съдържа: 20, 28, 30, 50, 56, 60 или 100 таблетки.

6.6 Указания за употреба, работа и унищожаване

Няма специални изисквания.

7. ИМЕ И АДРЕС НА ПРИТЕЖАТЕЛЯ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Actavis Group PTC ehf
Reykjavikurvegi 76-78
220-Hafnarfjordur
Исландия

8. РЕГИСТРАЦИОНЕН НОМЕР В РЕГИСТЪРА ПО ЧЛ. 28 ОТ ЗЛАХМ

9. ДАТА НА ПОЛУЧАВАНЕ НА ПЪРВОТО РАЗРЕШЕНИЕ/ ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО

10. ДАТА НА ПОСЛЕДНА РЕДАКЦИЯ НА ТЕКСТА

Януари 2010 г.

