

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА

Кратка характеристика на продукта - Приложение 1

Към Рег. № 20100323/20100524

Разрешение № П - 9610 / 18. 05. 2010

Одобрение № /

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Бизор 5 mg таблетки

Бизор 10 mg таблетки

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всяка таблетка Бизор 5 mg съдържа 5 mg бисопрололов фумарат (bisoprolol fumarate).

Всяка таблетка Бизор 10 mg съдържа 10 mg бисопрололов фумарат (bisoprolol fumarate).

За пълния списък от помощни вещества виж точка 6.1.

Този продукт съдържа лактоза монохидрат.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Таблетка

Бизор 5 mg: Таблетките са на бледожълти точки, кръгли и изпъкнали и притежават следните идентификационни белези: "B1" в центъра над разделителна линия, под която стои "5".

Таблетките могат да бъдат разделени на еднакви половини.

Бизор 10 mg: Таблетките са на бежови точки, кръгли и изпъкнали, и притежават следните идентификационни белези: "B1" в центъра над разделителна линия, под която стои "10".

Таблетките могат да бъдат разделени на еднакви половини.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания:

Хипертония

Хронична стабилна ангина пекторис

4.2 Дозировка и начин на приложение

Бизор 5 mg и Бизор 10 mg таблетки са предназначени за перорално приложение.

Дозата трябва да бъде регулирана за конкретното лице. Препоръчително е да се започне с най-ниската възможна доза. При някои пациенти могат да бъдат достатъчни 5 mg на ден. Обичайната доза е 10 mg на ден, а максималната препоръчвана доза е 20 mg на ден.

Пациенти с бъбречно увреждане

При пациенти с тежко бъбречно увреждане (креатининов клирънс < 20ml/min) дозата не трябва да надхвърля 10 mg на ден. Тази доза може да бъде разделена на две равни части.

Пациенти с тежко чернодробно увреждане

Не се налага регулиране на дозата, все пак се препоръчва внимателно наблюдение.

Пациенти в напреднала възраст

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

Деца под 12 години и юноши

Липсва информация относно действието на това лекарство при деца, затова ~~не се препоръчва~~ неговата употреба.



Прекратяване на лечението

Лечението не трябва да се прекратява внезапно (вижте точка 4.4). Дозата трябва да се намалява бавно като всяка следваща седмица се намалява на половина.

4.3 Противопоказания

- при остра сърдечна недостатъчност или при случаи на декомпенсация, която изисква интравенозна 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 в минута преди началото на терапията
- хипотония (систолично кръвно налягане под 100 mm Hg)
- тежка бронхиална астма или тежка хронична обструктивна белодробна болест
- последен стадий на периферно артериално оклузивно заболяване и синдром на Рейно
- метаболитна ацидоза
- свръхчувствителност към бисопролол или към някое от изброените помощни вещества
- нелекуван фаеохромоцитом (виж точка 4.4)
- комбинации с флоктафенин и султоприд (виж т. 4.5)

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Комбинацията с амиодарон трябва да се употребява предпазливо като се има предвид риска от контрактилен автоматизъм и нарушения на проводимостта (подтискане на компенсаторните реакции на симпатиковата нервна система).

Комбинацията на бисопролол с калциеви антагонисти от типа на верапамил и дилтиазем, както и с действащи централно антихипертензивни лекарства обикновено не се препоръчва (виж също и точка 4.5).

Бисопролол трябва да се използва с повишено внимание при:

- бронхоспазъм (бронхиална астма, обструкция на дихателните пътища): при бронхиална астма или при други хронични заболявания с обструкция на дихателните пътища, които могат да причинят симптоми, трябва да се прилага едновременно терапия за разширение на бронхите. Понякога, при пациентите с астма може да се появи увеличена резистентност на дихателните пътища, поради което е възможно да се наложи дозата от β_2 -стимуланти да бъде увеличена. Препоръчва се функционално изследване на дишането преди започване на лечението;
- съпътстващо лечение с антихолинестеразни лекарства (включително такрин) - времето за атриовентрикуларна проводимост и/или брадикардията могат да бъдат увеличени (виж и точка 4.5);
- едновременна употреба с анестетици – отслабване на рефлекторната тахикардия и увеличаване на риска от хипотония (виж т. 4.5). Продължаването на β -блокадата намалява риска от аритмия по време на индукция и интубация; анестезиологът трябва да бъде информиран, когато пациентът приема бисопролол;
- йодирани контрастни продукти: бета-блокери могат да възпрепятстват компенсаторните сърдечно-съдови реакции, свързани с хипотония или шок, причинен от йодирани контрастни продукти;
- захарен диабет с големи колебания в нивото на глюкозата в кръвта; симптомите на хипогликемия могат да бъдат прикрити; по време на лечението с бисопролол, нивото на глюкозата в кръвта трябва да се следи;
- тиреотоксикоза – бисопролол може да маскира адренергичните симптоми;
- строго постене или диета;
- протичаща терапия за десензибилизация;

Както и при другите бета-блокери, бисопролол може да увеличи и чувствителността към алергени и тежестта на анафилактичните реакции. Лечението с адреналин не трябва да



очаквания терапевтичен ефект. Могат да бъдат необходими по-високи дози епинефрин (адреналин);

- AV-блок от първа степен;
- ангина на Принцметал: бета-блокери могат да увеличат броя и продължителността на пристъпите на ангина при пациенти с ангина на Принцметал. Приложението на селективни адреноцепторни β_1 -блокери е възможно в случаи на леки форми и единствено в комбинация с вазодилататор;
- нарушения на периферното кръвообращение като феномен на Рейно или периодично клаудикацио; особено в началото на терапията може да се появи засилване на оплакванията;
- при пациенти с феохромоцитом (вж точка 4.3), трябва да се прилага само след α -рецепторна блокада.
- при пациенти с псориазис, бисопролол трябва да се дава единствено след цялостна преценка на рисковете и ползите.

Започването на лечение с бисопролол налага редовно наблюдение, особено при лечението на пациенти в напреднала възраст. Терапията с бисопролол не трябва да се прекратява внезапно освен ако няма ясни показания за това. Съществува риск от инфаркт на миокарда и внезапна смърт при внезапно прекъсване на лечението при пациенти с исхемична болест на сърцето. За допълнителна информация виж точка 4.2.

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

Този лекарствен продукт съдържа лактоза монохидрат, поради което не трябва да се употребява от пациенти с редки наследствени проблеми на галактозна непоносимост, с Lapp-лактазен дефицит или глюкозно-галактозна малабсорбция.

4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Противопоказани комбинации

Флоктафенин: бета-блокери могат да затруднят компенсаторните сърдечносъдови реакции, свързани с хипотония или шок, индуцирани от флоктафенин.

Султоприд: бисопролол не трябва да се прилага съвместно със султоприд, тъй като съществува повишен риск от вентрикуларна аритмия.

Комбинации, които не се препоръчват

Калциеви антагонисти (верапамил, дилтиазем, бепридил): отрицателно въздействие върху контрактилитета, атрио-вентрикуларната проводимост и кръвното налягане (вж. точка 4.4).

Клонидин и други централно действащи антихипертензивни лекарства, т.е. метилдопа, гуанфацин, моксонидин, рилменидин – повишен риск от “активиране на хипертонията”, както и прекомерно забавяне на пулса и сърдечната проводимост, включително влошаване на сърдечната недостатъчност.

Моноамино оксидазни инхибитори (освен MAO-B инхибитори) - засилен хипотензивен ефект на бета-блокери, но също и риск от хипертензивна криза.

Комбинации, които да се прилагат с повишено внимание

Клас I - лекарства против аритмия (напр. дизопирамид, хинин) – въздействието върху времето на атриовентрикуларна проводимост може да бъде усилено, а отрицателният инотропен ефект може да бъде увеличен. (Необходимо е строго клинично и ЕКГ наблюдение).

Клас III - лекарства против аритмия (напр. амиодарон) – въздействието върху времето за атриална проводимост може да бъде усилено (вж. точка 4.4).

Калциеви антагонисти (деривати на дихидропиридина) – повишен риск от хипотония. При пациенти с латентна сърдечна недостатъчност едновременното приложение на бета-блокери може да доведе до сърдечна недостатъчност.

Антихолинестеразни лекарства (включително такрин) - времето на атриовентрикуларна проводимост и/или брадикардията могат да се увеличат (вж. и точка 4.4).

Други бета-блокери, включително капки за очи, имат адитивен ефект.

Инсулин и перорални антидиабетни лекарства – засилване на ефекта на понижаване на захара. Блокада на β -адреноцепторите може да прикрие симптоми на хипогликемия.



Дигиталисови гликозиди – забавяне на пулса, увеличаване на времето на атриовентрикуларна проводимост.

Анестетици – отслабване на рефлекторната тахикардия и увеличен риск от хипотония (за повече информация във връзка с анестезията вж точка 4.4).

Нестероидни противовъзпалителни лекарства (НСПВС) – намаляване на антихипертензивното действие (потискане на секрецията на разширяващия кръвоносните съдове простагландин от НСПВС и задържане на вода и натрий от пиразолонови НСПВС).

Деривати на ерготамина – обостряне на смущенията в периферното кръвообращение.

Бета-симпатикомиметици (изопреналин, добутамин) – комбинацията с бисопролол може да намали действието и на двата агента.

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

Баклофен: увеличена антихипертензивна активност.

Амифостин: увеличена хипотензивна активност.

Комбинации, които да се вземат под внимание

Мефлохин: повишен риск от брадикардия.

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

4.6 Бременност и кърмене

Бременност:

Бисопролол има фармакологично действие, което може да навреди на бременността и/или на зародиша/новороденото. Най-общо, β -адреноцепторните блокери намаляват перфузията на плацентата, която се свързва със забавяне в растежа, интерутеринна смърт, аборт или преждевременно раждане. Нежелани реакции (напр. хипогликемия, брадикардия) могат да се появят в зародиша и новороденото. Ако е необходимо лечение с β -адреноцепторни блокери, то β 1-адреноцепторните блокери са за предпочитане.

Бисопролол не трябва да се употребява по време на бременност освен ако не е наложително. Ако лечението с бисопролол се сметне за необходимо, маточноплацентарния кръвоток и растежа на плода трябва да бъдат наблюдавани. В случай на вредно въздействие върху бременността или плода, трябва да се обмисли алтернативно лечение. Новороденото трябва да бъде внимателно наблюдавано. Проявата на симптоми на хипогликемия и брадикардия могат да се очакват през първите 3 дни.

Кърмене:

Не е известно дали бисопролол се отделя в майчиното мляко. По тази причина кърменето не се препоръчва по време на приложение на бисопролол.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

При изследване на пациенти с исхемична болест на сърцето, бисопролол не е нарушил способността за шофиране. Въпреки това, поради индивидуалните различия по отношение на реакциите към лекарствения продукт, способността за шофиране или обслужване на машини може да бъде нарушена. Това трябва да се има предвид особено в началото на лечението, при смяна на лекарството, както и във връзка с употребата на алкохол.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Нежеланите лекарствени реакции, за които има информация са свързани основно с фармакологичните свойства на бета-блокерите.

Следните нежелани лекарствени реакции са били наблюдавани по време на лечението с бисопролол със следните честоти на проява:

Много чести ($\geq 1/10$),

Чести ($\geq 1/100 < 1/10$),

Нечести ($\geq 1/1000 < 1/100$),



Редки ($\geq 1/10\ 000 < 1/1000$),
Много редки ($< 1/10\ 000$ включително изолирани съобщения).

Нарушения на нервната система

Чести:

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

Съдови нарушения

Чести: Усещане за студенина или вкочаненост на крайниците, синдром на Рейно, влошаване на съществуващо периодично накуцване

Нечести: ортостатична хипотония

Стомашно-чревни нарушения

Чести: Гадене, повръщане, диария, болки в коремната област и констипация

Психиатрични нарушения

Нечести: нарушения на съня, депресия

Редки: Кошмари, халюцинации

Сърдечни нарушения

Нечести: Брадикардия, нарушения в AV-проводимостта (забавена AV-проводимост или увеличение на съществуващия AV-блок), влошаване на съществуваща сърдечна недостатъчност

Респираторни, гръдни и медиастинални нарушения

Нечести: бронхоспазм при пациенти с бронхиална астма или с анамнеза за заболяване с обструкция на дихателните пътища

Нарушения на мускулноскелетната система и съединителната тъкан

Нечести: слабост в мускулите и спазми, артропатия

Нарушения на слуха и равновесието

Редки: нарушения в слуха

Нарушения на кожата и подкожните тъкани

Редки: Реакции на свръхчувствителност (сърбеж, зачервяване, обриви)

Много редки: бета-блокери могат да провокират или да влошат вече съществуващ псориазис или да причинят обрив, подобен на псориазис, косопад

Очни нарушения

Редки: намалено съзрване (да се има предвид ако пациентът употребява лещи)

Много редки: Конюнктивит

Хепато-билиарни нарушения

Редки: Повишени нива на чернодробните ензими (АСАТ и АЛАТ), хепатит

Нарушения в метаболизма и храненето

Редки: Повишени стойности на триглицеридите, хипогликемия

Нарушения на репродуктивната система и гърдата

Редки: нарушения в потентността

Нарушения на имунната система

Редки: алергичен ринит, поява на антинуклеарни антитела с необичайни клинични симптоми като лупус синдром, които изчезват при прекратяване на лечението



4.9 Предозиране

Най-честите и очаквани признаци на предозиране с бисопролол са брадикардия, хипотензия, бронхоспазъм, остра сърдечна недостатъчност и хипогликемия.

В случай на предозиране, лечението с бисопролол трябва да бъде преустановено като се приложи поддържащо и симптоматично лечение. Трябва да се избегне резорбцията на бисопролол в стомашночревния тракт; могат да се приложат стомашна промивка или адсорбенти (т.е. активен въглен), както и лаксатив (натриев сулфат). Дишането трябва да бъде под наблюдение и при необходимост, да се премине на изкуствено дишане. Бронхоспазмът трябва да се предотврати посредством бронходилаторна терапия с изопреналин или β_2 -симпатикомиметични лекарства. Сърдечносъдовите усложнения трябва да се лекуват симптоматично: при наличието на AV-блок (от втора или трета степен) е необходимо внимателно наблюдение и трябва да се лекува с инфузия на изопреналин или трансвенозно поставяне на сърдечен пейсмейкър. Брадикардията трябва да се лекува с интравенозно приложен атропин (или М-метил атропин). Понижение на кръвното налягане или шок трябва да се лекуват с плазма заместители и вазопресори. Хипогликемията може да се лекува с интравенозно вкарване на глюкоза.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ ДАННИ

5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: селективни бета₁-блокери, АТС код: С07АВ07

Бисопролол е мощен, високо селективен β_1 - адреноцепторен блокер, лишен от вътрешна симпатикомиметична дейност. Подобно на други β -блокери, начинът му на действие при хипертония е неясен. Въпреки това, е известно, че бисопролол подчертано подтиска плазмената ренинова активност.

При пациенти с ангина блокирането на β -рецепторите намалява сърдечната дейност и по този начин намалява нуждата от кислород.

Бисопролол има локално анестетични свойства, подобни на пропранолол.

5.2 Фармакокинетични свойства

Бисопролол се абсорбира почти напълно в стомашночревния тракт. Заедно с много слабия ефект на първо преминаване в черния дроб, това води до висока бионаличност от приблизително 90%. Свързването на бисопролол с плазмените протеини представлява около 30 %. Обемът на разпределение е 3,5 l/kg. Общият клирънс е около 15 l/h.

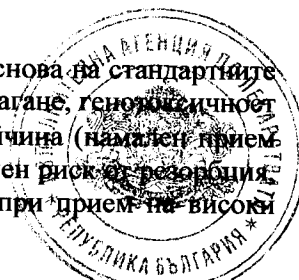
Плазменият полуживот (10-12 часа) осигурява 24-часова ефикасност след прием един път дневно. Бисопролол се екскретира от тялото по два начина, 50 % се преработва от черния дроб в неактивни метаболити, които след това се отделят чрез бъбреците. Останалите 50 % се отделят чрез бъбреците в непроменена форма. Тъй като елиминирането му се извършва от бъбреците и от черния дроб в една и съща степен, коригиране на дозата не се налага за пациенти с нарушена функция на черния дроб или бъбречна недостатъчност.

Кинетиката на бисопролол е линейна и не зависи от възрастта.

При пациенти с хронична сърдечна недостатъчност (клас III по NYHA) нивата на бисопролол в плазмата са по-високи и полуживотът е удължен в сравнение с този при здрави доброволци. Максималната плазмена концентрация в стабилно състояние е 64 ± 21 ng/ml при дневна доза от 10 mg и полуживотът е 17 ± 5 часа.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Предклиничните данни не разкриват наличието на особен риск за хората, въз основа на стандартните изследвания за фармакологична безопасност, токсичност при многократно прилагане, генотоксичност или карциногенност. Подобно на други β -блокери, бисопролол причинява майчина (намален прием на храна и намалено телесно тегло) и ембрионална/ фетална токсичност (повишен риск от резорбция, намалено тегло на поколенията при раждане, забавено физическо развитие) при прием на високи дози, но не е тератогенен.



6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Бизор 5 mg

Лактоза монохидрат

Целулоза, микрокристална E460

Магнезиев стеарат E572

Кросповидон E1201

Жълт РВ 22812 (Лактоза монохидрат и жълт железен оксид (E172))

Бизор 10 mg

Лактоза монохидрат

Целулоза, микрокристална E460

Магнезиев стеарат E572

Кросповидон E1201

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

6.2 Несъвместимости

Не са установени

6.3 Срок на годност

3 години

6.4 Специални условия на съхранение

Да се съхранява под 30°C.

6.5 Данни за опаковката

Бизор 5 mg таблетки и Бизор 10 mg таблетки са представени в:

Блистери от PVC/PVdC/алуминиево фолио, поставен в картонена кутия с печатни символи.

Всяка кутия съдържа 30 таблетки.

6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне и работа

Няма специални изисквания.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА:

„Чайкафарма Висококачествените Лекарства” АД

бул. ”Г.М.Димитров” №1

Гр. София 1172, България

8. НОМЕР НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ/ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗАЦИЯ НА ТЕКСТА

Април 2010 г.

