

CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

1. NAZWA WŁASNA PRODUKTU LECZNICZEGO

Bisoblock 5 mg, tabletki

2. SKŁAD ILOŚCIOWY I JAKOŚCIOWY SUBSTANCJI CZYNNYCH

Jedna tabletka zawiera 5 mg fumaranu bisoprololu (*Bisoprololi fumaras*).

Substancje pomocnicze patrz pkt. 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Tabletki

Bładożóte tabletki, nakrapiane, okrągłe, wypukłe z centralnie wytłoczonym napisem BI powyżej rowka dzielącego i 5 poniżej.

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1. Wskazania do stosowania

Nadciśnienie tętnicze.

Stabilna, przewlekła dławica piersiowa.

4.2. Dawkowanie i sposób podawania

Bisoprolol 5 mg jest przeznaczony do stosowania doustnego.

Dawkę należy ustalać indywidualnie. Zaleca się rozpoczynanie leczenia od najmniejszej możliwej dawki. U niektórych pacjentów, dawka 5 mg na dobę może być wystarczająca. Zwykle stosowana dawka to 10 mg na dobę. Maksymalna dawka dobową to 20 mg.

Stosowanie w niewydolności nerek

U pacjentów z ciężką niewydolnością nerek (klirens kreatyniny <20 ml/min, 0,33 ml/s) nie należy przekraczać dawki 10 mg na dobę. Dawkę zazwyczaj stosowaną można podzielić na dwie dawki.

Stosowanie w niewydolności wątroby

Dostosowywanie dawkowania nie jest wymagane, jednakże należy uważnie kontrolować pacjentów.

Osoby w podeszłym wieku

Dostosowywanie dawkowania nie jest najczęściej konieczne, jednakże leczenie należy rozpoczynać od najmniejszej możliwej dawki.

Dzieci w wieku poniżej 12 lat i młodzież

Ze względu na brak doświadczenia w stosowaniu preparatu u pacjentów pediatrycznych, nie zaleca się stosowania w tej grupie wiekowej.

Przerwanie leczenia

Leczenia nie należy przerywać nagle (patrz: pkt. 4.4. Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania). Dawka powinna być zmniejszana powoli, o połowę dawki na tydzień.

4.3. Przeciwwskazania

Nadwrażliwość na bisoprolol lub którąkolwiek substancję pomocniczą

Ostra niewydolność serca lub epizody dekomensacji wymagające dożylnego podawania leków inotropowych.

Wstrząs kardiogeny.

Blok przedsionkowo-komorowy II i III stopnia (bez stymulatora serca). Zespół chorego węzła zatokowego. Blok zatokowo-predsionkowy.

Bradykardia poniżej 60 uderzeń na minutę przed rozpoczęciem leczenia.

Niedociśnienie tętnicze (ciśnienie skurczowe poniżej 100 mm Hg). Ciężka astma oskrzelowa lub ciężkie przewlekłe obturacyjne choroby płuc. Późne stadium zarostowych chorób tętnic obwodowych i zespół Raynaud. Kwasica metaboliczna.

Nie leczony guz chromochłonny nadnerczy (patrz także: pkt 4.4). Jednoczesne stosowanie floktafeniny i sultoprydu (patrz także: pkt 4.5).

4.4. Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

Niektóre leki zawierające bisoprolol są stosowane w leczeniu przewlekłej niewydolności serca. Stosowanie beta-adrenolityków w tym wskazaniu wymaga dużej ostrożności i powinno być rozpoczynane od bardzo niskiego, stopniowego zwiększania dawki. Nie jest to możliwe za pomocą tego preparatu. W związku z tym preparat ten nie powinien być stosowany w leczeniu przewlekłej niewydolności serca

Nie należy stosować jednocześnie z amiodaronem z powodu możliwości wystąpienia samoistnych skurczów i zaburzeń przewodzenia (hamowanie kompensacyjnej reakcji współczulnej).

Bisoblock 5 mg musi być stosowany z ostrożnością w przypadkach:

- Skurczu oskrzeli (astma oskrzelowa, obturacyjne choroby dróg oddechowych). W przypadku astmy oskrzelowej lub innych obturacyjnych chorób dróg oddechowych mogących spowodować skurcz oskrzeli w trakcie leczenia bisoprololem należy stosować leczenie rozszerzające oskrzela. Sporadycznie, u pacjentów z astmą oskrzelową może wystąpić w trakcie leczenia bisoprololem zwiększenie oporu oddechowego, dlatego należy zwiększyć dawkę β₂-adrenomimetyków. Zaleca się wykonanie badań czynnościowych układu oddechowego przed rozpoczęciem leczenia.
- Jednoczesnego stosowania wziewnych leków znieczulających.

- Cukrzycy z dużymi zmianami stężenia glukozy we krwi. Objawy hipoglikemii mogą być maskowane. Należy monitorować stężenie glukozy we krwi w trakcie leczenia bisoprololem.
- Nadczynności tarczycy, objawy adrenergiczne mogą być maskowane.
- Głodówki.
- Leczenia odczulającego.
- Tak jak inne leki beta-adrenolityczne bisoprolol może zwiększać zarówno wrażliwość na alergen jak i nasilać reakcje anafilaktyczne. Zastosowanie adrenaliny nie zawsze przynosi pożyteczny skutek.
- Bloku przedsionkowo-komorowego I stopnia.
- Dławicy Prinzmetala, leki beta-adrenolityczne mogą zwiększać liczbę i czas trwania napadów dławicy u pacjentów z dławicą Prinzmetala. Stosowanie selektywnych β_1 -beta-adrenolityków jest możliwe w łagodnej postaci choroby i tylko w przypadku jednoczesnego podawania leków rozkurczających naczyń.
- Zaburzeń krążenia obwodowego takich jak objaw Raynauda, chromanie przestankowe. Nasilenie objawów może wystąpić szczególnie na początku leczenia.
- Pacjentów z guzem chromochłonnym nadnerczy (patrz także: pkt 4.3), bisoprololu nie wolno stosować bez wcześniejszego zastosowania leków blokujących receptory alfa.
- Pacjentów z β -uszczykiem lub β -uszczykiem w wywiadzie, bisoprolol może być zastosowany tylko po oszacowaniu ryzyka i korzyści.

Rozpoczęcie leczenia bisoprololem wymaga regularnej kontroli, szczególnie w przypadku pacjentów w podeszłym wieku. Nie należy nagle przerywać leczenia bisoprololem, jeżeli nie jest bezwzględnie konieczne. Nagłe przerwanie leczenia zwiększa ryzyko wystąpienia zawału serca i nagłej śmierci u pacjentów z chorobą niedokrwienną serca. Więcej informacji patrz: pkt. 4.2 Dawkowanie i sposób podawania.

Preparat zawiera substancję czynną, która może powodować pozytywny wynik testów antydopingowych.

Preparat zawiera 65 mg laktozy jednowodnej.

4.5. Interakcje z innymi lekami i inne rodzaje interakcji

Leki przeciwwskazane do jednoczesnego stosowania:

- Floktafenina: leki beta-adrenolityczne mogą hamować sercowo-naczyniowe mechanizmy kompensacyjne, związane z niedocięciem tętniczym lub wstrząsem wywołanymi stosowaniem floktafeniny.
- Sultopryd: nie należy stosować bisoprololu z sultoprydem, ponieważ zwiększa się ryzyko wystąpienia komorowych zaburzeń rytmu serca.

Leki nie zalecane do jednoczesnego stosowania:

- Antagoniści kanału wapniowego (werapamil, diltiazem, beprydyl) mają niekorzystny wpływ na kurczliwość, przewodzenie przedsionkowo-komorowe oraz ciśnienie tętnicze krwi.
- Klonidyna: zwiększenie ryzyka nadciężenia z „odbicia”, nasilenie działania zwalniającego czynności serca i przewodzenie.

- Inhibitory monoaminoooksydazy (z wyjątkiem inhibitorów MAO-B) nasilenie działania hipotensyjnego leków beta-adrenolitycznych, ale także ryzyko wystąpienia przełomu nadciężeniowego.

Leki, które należy stosować z ostrożnością¹

- Leki przeciwaritmiczne klasy I (np. dizopiramid, chinidyna): wpływ na czas przewodzenia przedsionkowego może zostać nasilony oraz może nasilić się ujemne działanie inotropowe (wymagana jest ścisła kontrola stanu klinicznego i obrazu EKG).
 - Leki przeciwaritmiczne klasy III (np. amiodaron): wpływ na czas przewodzenia przedsionkowego może zostać nasilony.
- Leki parasympatykomimetyczne (w tym takryna): czas przewodzenia przedsionkowo-komorowego może zostać wydłużony.
- Inne beta-adrenolityki, w tym krople do oczu mogą nasilić działanie.
- Insulina i doustne leki przeciwcukrzycowe: nasilenie działania hipoglikemizującego.
- Blokada receptorów beta-adrenergicznych może maskować objawy hipoglikemii.
- Środki znieczulające: osłabienie odruchowej tachykardii i zwiększone ryzyko niedociężenia tętniczego.
- Kontynuowanie blokady receptorów beta-adrenergicznych zmniejsza ryzyko wystąpienia arytmii w czasie indukcji i intubacji. Należy poinformować anestezjologa o przyjmowaniu bisoprololu przez pacjenta.
- Glikozydy naparstnicy: zmniejszenie częstości serca, wydłużenie czasu przewodzenia przedsionkowo-komorowego.
 - Leki blokujące syntetazę prostaglandyn¹: zmniejszenie działania przeciwnadciężeniowego.
 - Pochodne ergotaminy: nasilenie zaburzeń krążenia obwodowego.
 - Leki sympatykomimetyczne: zmniejszenie działania obu leków. Może wystąpić przełom nadciężeniowy i nasiloną bradykardię.
 - W przypadku leczenia reakcji alergicznych może być konieczne zwiększenie dawki adrenaliny.
 - Trójpierścieniowe leki przeciwdepresyjne, barbiturany, pochodne fenotiazyny nasilają działanie hipotensyjne.
 - Ryfampicyna: może w niewielkim stopniu zmniejszyć okres półtrwania bisoprololu w mechanizmie indukcji enzymów wątrobowych. Najczęściej nie ma konieczności modyfikacji dawkowania.
 - Baklofen: nasila działanie przeciwnadciężeniowe bisoprololu.
- Jodowe środki kontrastujące: leki beta-adrenolityczne mogą hamować sercowo-naczyniowe mechanizmy kompensacyjne, związane z niedociężeniem tętniczym lub wstrząsem spowodowanymi jodowymi środkami kontrastującymi.

Leki do rozważenia:

- Meflochina: zwiększone ryzyko wystąpienia bradykardii.

- Kortykosteroidy: zmniejszenie działania przeciwnadciężeniowego na skutek retencji sodu i wody.
- Niesteroidowe leki przeciwzapalne (NLPZ) zmniejszenie działania przeciwnadciężeniowego (hamowanie naczyniorozszerzającego działania prostaglandyn przez NLPZ oraz retencja sodu i wody powodowane przez pirazolonowe NLPZ)

4.6. Ciąża lub laktacja

Ciąża:

Bisoprolol wykazuje działania farmakologiczne mogące mieć szkodliwy wpływ na ciążę i (lub) płód i (lub) noworodka. Generalnie leki beta-adrenolityczne zmniejszają przepływ łożyskowy, co może powodować zahamowanie wzrostu płodu, śmierć wewnątrzmaciczną, poronienie lub poród przedwczesny. Można się spodziewać działań niepożądanych (hipoglikemia, bradykardia) u płodu i noworodka. W razie konieczności leczenia lekami beta- adrenolitycznymi należy stosować selektywne β_1 -adrenolityki.

Bisoprololu nie należy stosować w ciąży bez zdecydowanej konieczności. W przypadku konieczności leczenia bisoprololem należy monitorować przepływ łożyskowy i wzrost płodu. W przypadku szkodliwego wpływu na ciążę lub płód należy rozważyć inne leczenie. Noworodki muszą być uważnie obserwowane. Działania niepożądanych u noworodka tj.: hipoglikemii i bradykardii należy się spodziewać w ciągu pierwszych 3 dni życia.

Okres karmienia piersią:

Nie jest wiadome czy bisoprolol przenika do pokarmu kobiecego. W związku z tym nie zaleca się karmienia piersią w przypadku stosowania bisoprololu.

4.7. Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów mechanicznych i obsługiwanie urządzeń mechanicznych w ruchu

W badaniach u pacjentów z chorobą naczyń wieńcowych bisoprolol nie zaburza zdolności do prowadzenia pojazdów i obsługiwanie urządzeń mechanicznych. Jednakże, ze względu na indywidualne reakcje pacjentów zdolność do prowadzenia i obsługiwanie urządzeń może być zaburzona. Należy to rozważyć szczególnie na początku leczenia, po zmianie leku oraz w przypadku jednoczesnego spożycia alkoholu.

4.8. Działania niepożądane

Działania niepożądane wynikają głównie z właściwości farmakologicznych leków beta- adrenolitycznych.

Często:

- Układ krążenia: uczucie zimna lub drętwienia kończyn, choroba Raynaud, nasilenie współistniejącego chromania przestankowego.
- Ośrodkowy układ nerwowy: uczucie zmęczenia lub wyczerpania, zawroty głowy, bóle głowy)
- Układ pokarmowy: nudności, wymioty, biegunka, bóle brzucha i zaparcia.

Niezbyt często:

- Ogólne: osłabienie mięśni, bolesne skurcze mięśni, zwyrodnienie stawów.
- Układ krążenia: bradykardia, zaburzenia stymulacji przedsionkowo-komorowej (zwolnienie przewodzenia przedsionkowo-komorowego, nasilenie istniejącego bloku przedsionkowo-komorowego), nasilenie niewydolności serca, niedocięnienie ortostatyczne.

- O_orodkowy uk³ad nerwowy: zaburzenia snu, depresja.
- Uk³ad oddechowy: skurcz oskrzeli u pacjentów z astmą oskrzelow¹ lub z chorobami obturacyjnymi p³uc w wywiadzie.

Rzadko:

- O_orodkowy uk³ad nerwowy: koszmary senne, omamy.
- Skóra: reakcje nadwrażliwości (o_owi¹d, nag³e zaczerwienienie twarzy, wysypka).
- W¹troba: zwiększenie aktywności enzymów w¹trobowych we krwi (AIAT, AspAT), zapalenie w¹troby.
- Metabolizm: zwiększenie st^ożenia trój glicerydów, hipoglikemia.
- Uk³ad moczowo-p³ciowy: zaburzenia potencji.
- Ucho-nos-gard³o: zaburzenia s³uchu, alergiczne zapalenie o_oluzówki nosa.
- Narz¹d wzroku: zmniejszenie wydzielania ³ez.
- Zaburzenia biologiczne: wyst¹pienie przeciwcia³ przeciw¹drowych, wyj¹tkowo z objawami klinicznymi podobnymi do objawów toczenia, ust^opuj¹cymi po zakończenu leczenia.

Pojedyncze przypadki:

- Narz¹d wzroku: zapalenie spojówek.
- Skóra i przydatki: leki beta-adrenolityczne mog¹ powodowa^o nasilenie objawów ³uszczycy lub powodowa^o wyst^opowanie ³uszczycopodobnej wysypki, ³ysienie.

4.9. Przedawkowanie

Najcz^ościej wyst^opuj¹ce objawy przedawkowania to: bradykardia, niedoci^onienie t^otnicze, skurcz oskrzeli, ostra niewydolno^oæ serca, hipoglikemia.

W przypadku przedawkowania, leczenie bisoprololem nale³y przerwa^o i rozpocz¹æ leczenie objawowe i podtrzymuj¹ce. Nale³y zapobiega^o wch³anianiu bisoprololu z przewodu pokarmowego. Nale³y przeprowadzi¹æ p³ukanie o³1dka lub poda^o substancje adsorbuj¹ce (np. w^ogiel aktywowany) i leki przeczyszczaj¹ce (np. siarczan sodu). Nale³y monitorowa^o czynno^oæ uk³adu oddechowego i w razie potrzeby zastosowa^o wspomaganie oddechu.

Skurcz oskrzeli nale³y leczy¹æ podaj¹c leki rozszerzaj¹ce oskrzela takie jak: izoprenalina lub P2-sympatykomimetyki,

Zaburzenia uk³adu sercowo naczyniowego nale³y leczy¹æ objawowo: pacjenci z blokiem przedsionkowo-komorowym II i III stopnia musz¹ by^o uwa³nie obserwowani i leczeni wlewem do³ylnym izoprenaliny lub zastosowaniem stymulatora. Bradykardi^o nale³y leczy¹æ do³ylnie podawan¹ atropin¹ (lub M-metylo-atropin¹). Obni³enie ci^onienia t^otniczego krwi lub wstrz¹s nale³y leczy¹æ stosuj¹c uzupe³nienie obj^oto^oci krwi kr¹o¹cej i leki obkurcz¹j¹ce naczynia. Hipoglikemi^o nale³y leczy¹æ podaj¹c do³ylnie roztwór glukozy.

5. W^oÅ^oCIWO^oCI FARMAKOLOGICZNE

5.1 .W³o^ociwo^oci farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: Leki selektywnie blokuj¹ce receptory kod ATC: C07AB07

Bisoprolol jest silnym, wysoce selektywnym lekiem blokującym receptory β_1 -adrenergiczne, pozbawionym wewnętrznej aktywności sympatykomimetycznej. Tak jak inne leki beta-adrenolityczne mechanizm działania w nadciśnieniu tętniczym jest niejasny. Jednakże wiadomo, że bisoprolol znacząco zmniejsza aktywność reninową osocza.

U pacjentów z dławicą piersiową, blokada receptorów β zmniejsza częstość skurczów serca i dlatego zmniejsza się zapotrzebowanie na tlen.

Bisoprolol podobnie do propranololu wywołuje miejscowe działanie znieczulające.

5.2. Właściwości farmakokinetyczne

Bisoprolol jest wchłaniany prawie w całości z przewodu pokarmowego, Biorąc dodatkowo pod uwagę niewielki efekt pierwszego przejścia przez ścianę jego biodostępność jest bardzo duża i wynosi około 90%. W 30% wiąże się z białkami osocza krwi. Objętość dystrybucji wynosi 3,5 l/kg m.c.. Klirens całkowity wynosi ok. 15 l/h.

Skutkiem osoczowego okresu półtrwania wynoszącego w fazie eliminacji 10-12 godzin jest 24 godzinne działanie po podaniu jeden raz na dobę. Bisoprolol jest wydalany dwiema drogami: 50% jest metabolizowane w ścianie do nieczynnych metabolitów, które są wydalone przez nerki. Pozostałe 50% jest wydalone przez nerki w postaci nie zmienionej,

Sposób wydalania i równy podział dawki powoduje, że u pacjentów z niewydolnością nerek lub wątroby nie ma konieczności modyfikacji dawkowania. Kinetyka bisoprololu jest liniowa i niezależna od wieku.

U pacjentów z przewlekłą niewydolnością serca (klasa III wg NYHA) stężenie bisoprololu w osoczu krwi jest większe, a okres półtrwania dłuższy w porównaniu ze zdrowymi ochotnikami. Maksymalne stężenie w osoczu w stanie stacjonarnym wynosi 64 ± 21 ng/ml po podaniu 10 mg na dobę, a okres półtrwania wynosi 17 ± 5 godzin.

5.3. Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

Dane przedkliniczne nie wykazały specjalnego ryzyka dla ludzi w standardowych badaniach oceniających bezpieczeństwo, farmakologię, toksyczność po podaniu dawek wielokrotnych, genotoksyczność i rakotwórczość. Jak inne leki beta-adrenolityczne bisoprolol podawany w dużych dawkach powodował u ciężarnych samic działania toksyczne (zmniejszenie ilości przyjmowanego pokarmu, zmniejszenie masy ciała) oraz działania toksyczne u zarodka i płodu (zwiększenie częstości występowania absorpcji płodu, zmniejszenie masy urodzeniowej, opóźnienie rozwoju fizycznego), ale nie wykazywał działania teratogennego.

6. SZCZEGÓŁOWE DANE FARMACEUTYCZNE 6.1.

Wykaz substancji pomocniczych

Laktoza jednowodna, celuloza mikrokrystaliczna, magnezu stearynian, krospowidon, yellow PB 22812 (laktoza jednowodna, żelaza tlenek żółty E 172)

6.2. Niezgodności farmaceutyczne

Nie dotyczy.

6.3. Okres ważności

3 lata.

6.4. Specjalne oerodki ostroŹnoœci przy przechowywaniu

Brak specjalnych wymagañ.

6.5 Rodzaj i zawartoœæ opakowania

Blistry z folii PVC/PVDC/A1 umieszczone w tekturowym pude³ku.

Opakowanie zawiera 10, 20, 28, 30, 50, 56, 60 lub 100 tabletek. Nie wszystkie wielkoœci opakowañ musz¹ znajdowaæ siê w obrocie.

6.6 Instrukcja dotycz¹ca przygotowania leku do stosowania i usuwania jego pozosta³oœci

Brak specjalnych wymagañ.

7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJ¹CY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Keri Pharma Ltd.

4032 Debrecen

Bartha Boldizsar u. 7
Wêgry

8. NUMER POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Pozwolenie Nr 12351

9. DATA WYDANIA PIERWSZEGO POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU / DATA PRZEDŁUŹENIA POZWOLENIA

11.08.2006

10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZÊCIOWEJ ZMIANY TEKSTU CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO

11.08.2006 r.