ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА
Кратка характеристика на продукта Приложение 1
Към Рег. № 20100325/26
Разрешение № BG/MA/MP - 73164-5 / 14-10-2026
Одобрение № /

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Блокбис Кор 2,5 mg таблетки
Blokbis Cor 2,5 mg tablets

Блокбис Кор 5 mg таблетки
Blokbis Cor 5 mg tablets

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всяка таблетка съдържа 2,5 mg или 5 mg бизопрололов фумарат (bisoprolol fumarate).

Помощно вещество с известно действие: лактоза монохидрат.
Всяка таблетка от 2,5 mg съдържа 68,15 mg лактоза монохидрат.
Всяка таблетка от 5 mg съдържа 136,2 mg лактоза монохидрат.

За пълния списък на помощните вещества, вижте точка 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Таблетка
Блокбис Кор 2,5 mg таблетки: бели на цвят, овални, необвити таблетки, с делителна черта от двете страни, с маркировка "BI" и "2.5" от двете страни на делителната черта.

Блокбис Кор 5 mg таблетки: бледожълти на цвят, мозаечни, кръгли, необвити, изпъкнали таблетки, с делителна черта от едната страна и маркировка "BI" и "5" от двете страни на делителната черта, гладки от обратната страна.

Таблетката може да бъде разделена на две равни дози.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

Лечение на стабилна умерена до тежка хронична сърдечна недостатъчност с намалена систолична камерна функция (фракция на изтласкване <35%, доказана ехокардиографски) в комбинация с АСЕ инхибитори и диуретици, и при необходимост със сърдечни гликозиди (за допълнителна информация вж. точка 5.1).

4.2 Дозировка и начин на приложение

Дозировка
Преди началото на лечението пациентите трябва да са стабилизирани (без прояви на остра недостатъчност). Препоръчва се лекуващият лекар да има опит в лечението на хронична сърдечна недостатъчност.

Титрационна фаза
Лечението на стабилна хронична сърдечна недостатъчност с бизопролол изисква фаза на титриране.

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА * РЕПУБЛИКА БЪЛГАРИЯ *

Препоръчителната начална доза е 1,25 mg веднъж дневно. В зависимост от индивидуалната поносимост, дозата се повишава на 2,5 mg, 3,75 mg, 5 mg, 7,5 mg и 10 mg веднъж дневно през интервал от две седмици или повече. Ако повишената доза не се понася добре лечението може да се продължи с по-ниската доза. След стабилизиране на състоянието на пациента може да се пристъпи към подновяване на лечението и/или повишаване на дозата на бизопролол.

Максималната препоръчителна доза е 10 mg еднократно дневно.

През титрационната фаза се препоръчва проследяване на жизнените показатели (сърдечен ритъм, кръвно налягане), както и за поява на симптоми на влошаване на сърдечната недостатъчност.

Модифициране на лечението
Ако максималната препоръчителна доза не се понася добре, лечението може да продължи с постепенно понижаване на дозата.

При преходно влошаване на сърдечната недостатъчност, хипотония или брадикардия, се препоръчва преоценка на дозата и на съпътстващото лечение. Може да е необходимо временно да се понижи дозата на бизопролол или да се обмисли преустановяване на лечението. След стабилизиране на състоянието на пациента може да се пристъпи към подновяване на лечението и/или повишаване на дозата на бизопролол.

Ако е необходимо преустановяване на лечението, се препоръчва постепенно понижаване на дозата, тъй като внезапното спиране на терапията може да доведе до рязко влошаване на състоянието на пациента.

Продължителност на терапията
По принцип лечението с бизопролол е продължително.
Лечението с бизопролол не трябва да се спира внезапно, тъй като това може да доведе до рязко влошаване на състоянието, особено при пациенти с исхемична болест на сърцето. Препоръчва се постепенно понижаване на дозата.

Специални популации

Пациенти с бъбречно и чернодробно увреждане
Няма информация за фармакокинетиката на бизопролол при пациенти с хронична сърдечна недостатъчност и увредена бъбречна или чернодробна функция. Повишаването на дозата в тези случаи изисква допълнително внимание.

Старческа възраст
Не се изисква адаптиране на дозата.

Педиатрична популация
Няма опит с бизопролол при деца, поради което използването му при деца не се препоръчва.

Начин на приложение
Перорално приложение
Бизопролол таблетки се приемат сутрин, със или без храна. Могат да се поглъщат с малко течност.

4.3 Противопоказания

Бизопролол е противопоказан при пациенти със:
- свръхчувствителност към бизопролол или към някое от помощните вещества, изброени в точка 6.1;

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА * РЕПУБЛИКА БЪЛГАРИЯ *

- остра сърдечна недостатъчност или с декомпенсирана сърдечна недостатъчност, изискваща интравенозно приложение на лекарства с инотропно действие;
- кардиогенен шок;
- атриовентрикуларен (AV) блок втора или трета степен (без пейсмейкър);
- синдром на болния синусов възел;
- синоатриален (SA) блок;
- симптоматична брадикардия;
- симптоматична хипотония;
- тежка бронхиална астма или тежка хронична обструктивна белодробна болест (ХОББ);
- тежка форма на периферни артериални оклузивни заболявания или тежка форма на синдром на Рейно;
- нелекуван феохромоцитом (вж. точка 4.4);
- метаболитна ацидоза.

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Лечението на стабилна сърдечна недостатъчност с бизопролол трябва да започне със специална титрационна фаза.

Прекратяването на лечението с бизопролол не трябва да се извършва внезапно, особено при пациенти с исхемична болест на сърцето, освен при наличието на категорични индикации, тъй като това може да доведе до влошаване на сърдечния статус.

Бизопролол трябва да се използва с внимание при:
- захарен диабет с големи колебания в стойностите на кръвната захар; симптомите на хипогликемия могат да бъдат маскирани; бета блокерите могат допълнително да повишат риска от тежка хипогликемия, когато се използват едновременно със сулфонилурейни производни. Пациентите с диабет трябва да бъдат посъветвани да проследяват внимателно нивата на кръвната глюкоза (вж. точка 4.5).
- строга диета (постене);
- в хода на десенсибилизираща терапия. Подобно на другите бета-блокери, бизопролол може да увеличи чувствителността към алергени, както и тежестта на анафилактичните реакции. Лечението с адреналин не винаги дава очаквания терапевтичен ефект.
- AV блок първа степен;
- ангина на Prinzmetal: наблюдавани са случаи на коронарен вазоспазъм. Въпреки високата бета1-селективност на бизопролол, при пациенти с ангина на Prinzmetal, които го приемат не могат да бъдат изключени пристъпи на стенокардия.
- периферни артериални оклузивни заболявания (може да се наблюдава влошаване на оплакванията особено в началото на лечението);
- обща анестезия.

При пациенти, подложени на обща анестезия, бета-блокадата намалява честотата на аритмии и миокардна исхемия по време на въвеждането в анестезия и интубацията, и в постоперативния период. Препоръчва се поддържащата бета-блокада да бъде продължена периоперативно. Анестезиологът трябва да бъде добре запознат с бета-блокадата, тъй като възможността на бизопролол да взаимодействия с други лекарства води до брадиаритмия, отслабване на рефлекторната тахикардия и намаляване на рефлекторната способност за компенсация на кръвозагубата. Ако въпреки всичко е необходимо прекратяване на терапията с бета-блокери преди хирургичната интервенция, това трябва да се извършва постепенно и да завърши около 48 часа преди анестезията.
Въпреки, че кардиоселективните (бета1) бета-блокери могат да оказват по-слаб ефект върху белодробната функция, отколкото неселективните бета-блокери, използването им също трябва да се избягва при пациенти с обструктивни заболявания на дихателните пътища, освен ако не съществуват убедителни клинични причини за употребата им. Ако такива причини съществуват, бизопролол трябва да се използва с повишено внимание.

При бронхиална астма или други хронични обструктивни белодробни заболявания, които могат да предизвикат симптоми се препоръчва едновременно приложение на бронходилатираща терапия. В някои случаи при пациенти с астма може да се наблюдава повишаване на резистентността на дихателните пътища, което може да наложи повишаване на дозата на бета2-стимулантите.

Няма терапевтичен опит в лечението с бизопролол на сърдечна недостатъчност при пациенти със следните заболявания и състояния:

- инсулинозависим захарен диабет (тип I)
- тежко нарушена бъбречна функция
- тежко нарушена чернодробна функция
- рестриктивна кардиомиопатия
- вродени сърдечни заболявания
- хемодинамично значими органични клапни заболявания
- инфаркт на миокарда през последните 3 месеца.

Комбинацията на бизопролол с калциеви антагонисти от групата на верапамил или дилтиазем, с антиаритмици клас I и с антихипертензивни продукти с централно действие по принцип не се препоръчва (за подробности вж. точка 4.5).

Пациентите с псориазис или с анамнеза за псориазис трябва да приемат бета-блокери (вкл. бизопролол) само след внимателна оценка на съотношението полза/риск.

По време на лечение с бизопролол симптомите на тиреотоксикоза могат да бъдат маскирани.

При пациенти с феохромоцитом бизопролол трябва да се прилага след алфа-рецепторна блокада.

Бизопролол може да даде позитивни резултати по време на антидопингов контрол.

В началото на терапията с бизопролол и при прекратяването ѝ се изисква редовно проследяване. За дозировката и начина на приложение вж. точка 4.2.

Продуктът съдържа лактоза монохидрат. Пациенти с редки наследствени проблеми на непоносимост към галактоза, пълен лактазен дефицит или глюкозо-галактозна малабсорбция не трябва да приемат това лекарство.

4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Комбинации, които не се препоръчват

Калциеви антагонисти от верапамилов тип и в по-малка степен от дилтиаземов тип: негативно влияние върху контрактилитета и атриовентрикуларната проводимост. Интравенозното прилагане на верапамил при пациенти на лечение с бета-блокери може да доведе до тежка хипотония и атриовентрикуларен блок.

Антиаритмици клас I: Ефектът върху атриовентрикуларното време за проводимост може да се потенцира и да се увеличи негативният инотропен ефект.

Централно-действащи антихипертензивни средства, като клонидин и др. (напр. метилдопа, моксонидин, рилменидин): едновременната употреба на централно действащи антихипертензивни лекарствени продукти може да доведе до забавяне на сърдечната честота и сърдечния дебит и до вазодилатация. Внезапното прекратяване на терапията може да повиши риска от „ребаунд хипертония“.

Комбинации, при които се изисква внимание

Калциеви антагонисти от дихидропиридинов тип, като фелодипин и амлодипин: едновременната употреба може да повиши риска от хипотония; при пациенти със сърдечна недостатъчност не може да бъде изключен повишен риск от допълнително влошаване на камерната помпена функция.

Антиаритмици клас III (напр. амиодарон): възможно е потенциране на ефекта по отношение времето на AV проводимостта.

Бета-блокери за локално приложение (напр. очни капки за лечение на глаукома) могат да потенцират системните ефекти на бизопролол.

Парасимпатикомиметици: едновременното приложение може да удължи атриовентрикуларното проводно време и да увеличи риска от брадикардия.

Инсулин и перорални антидиабетни средства: засилване на хипогликемичния ефект. Съпътстващото приложение на бета блокери със сулфонилурейни производни може да повиши риска от тежка хипогликемия. Блокадата на бета-рецепторите може да маскира симптомите на хипогликемия (вж. точка 4.4).

Анестетици: отслабване на рефлекторната тахикардия и повишен риск от хипотония (за допълнителна информация относно общата анестезия вж. точка 4.4).

Дигиталисови гликозиди: забавяне на сърдечната честота, повишаване на времето на предсърдно-камерната проводимост.

Нестероидни противовъзпалителни средства (НСПВС): НСПВС могат да отслабят хипотензивния ефект на бизопролол.

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

Симпатомиметици, които активират едновременно алфа- и бета-рецепторите (напр. норадреналин, адреналин): Комбинирането им с бизопролол може да демаскира повлияното от алфа-адренорецепторите вазоконстриктивно действие на тези средства, водещо до повишаване на кръвното налягане и обостряне на клаудикацио интермитенс (claudication intermittens). Счита се, че такива взаимодействия са по-вероятни с неселективните бета-блокери.

Едновременната употреба с антихипертензивни средства, както и с други лекарствени средства, които имат потенциал да понижават артериалното налягане (напр. трициклични антидепресанти, барбитурати, фенотиазини) може да повиши риска от хипотония.

Комбинации, които трябва да бъдат внимателно обмислени

Мефлокин: повишен риск от брадикардия.
Моноаминооксидазни инхибитори (с изключение на МАО-В инхибитори): повишаване на хипотензивния ефект на бета-блокерите, както и риск от хипертензивни кризи.

4.6 Фертилитет, бременност и кърмене

Бременност

Бизопролол има фармакологични действия, които могат да предизвикат увреждащи ефекти върху бременността и/или върху плода/новороденото. По принцип бета-адренорецепторните блокери намаляват плацентната перфузия, която може да се свърже със забавяне на растежа, вътрематочна смърт, аборт или преждевременно раждане. Нежелани лекарствени реакции

(напр. хипогликемия и брадикардия) могат да възникнат у плода и новороденото. Ако е необходимо лечение с бета-адренорецепторни блокери за предпочитане са бета1-селективните адренорецепторни блокери.
Бизопролол не трябва да се прилага по време на бременност, освен при категорична необходимост. Ако лечението с бизопролол се счита за необходимо, трябва да се наблюдават кръвоснабдяването на матката и плацентата, и растежа на плода. В случай на неблагоприятни ефекти върху бременността или плода, трябва да се обмисли алтернативно лечение. Новороденото трябва да бъде наблюдавано внимателно. Симптоми на хипогликемия и брадикардия се очакват най-общо през първите 3 дни.

Кърмене
Не е известно дали това активно вещество се екскретира в кърмата. По време на лечение с бизопролол кърменето не се препоръчва.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

При проучване при пациенти с исхемична болест на сърцето бизопролол не влошава способността за шофиране. Въпреки това, поради индивидуалния отговор на пациентите към лечението, способността за шофиране или работа с машини може да бъде нарушена. Това трябва да се вземе под внимание, особено в началото на лечението, при смяна на лечението и при употреба на алкохол.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Нежеланите лекарствени реакции са групирани по честота съгласно следната конвенция: много чести (≥ 1/10), чести (≥ 1/100 до < 1/10), нечести (≥ 1/1 000 до < 1/100), редки (≥ 1/10 000 до < 1/1 000), много редки (< 1/10 000), с неизвестна честота (честотата не може да бъде определена от наличните данни).

Изследвания
Редки: повишени стойности на триглицеридите, повишени стойности на чернодробните ензими (ALAT, ASAT).

Сърдечни нарушения
Много чести: брадикардия
Чести: влошаване на сърдечната недостатъчност
Нечести: нарушения на AV-проводимостта

Нарушения на нервната система
Чести: замаяност и главоболие
Редки: синкоп.

Нарушения на очите
Редки: намаление на сълзоотделянето (да се има предвид при пациенти, използващи лещи)
Много редки: конюнктивит

Нарушения на ухото и лабиринта
Редки: отслабване на слуха

Респираторни, гръдни и медиастинални нарушения
Нечести: бронхоспазъм при пациенти с бронхиална астма или анамнеза за обструктивни заболявания на дихателните пътища
Редки: алергичен ринит

Стомашно-чревни нарушения
Чести: стомашно-чревни оплаквания, като: гадене, повръщане, диария, запек

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА * РЕПУБЛИКА БЪЛГАРИЯ *

Нарушения на кожата и подкожната тъкан
Редки: реакции на свръхчувствителност (сърбеж, зачервяване, обрив и ангиоедем)
Много редки: бета-блокерите могат да провокират или влошат псориазис, или да индуцират появата на псориазоподобен обрив, алопеция.

Нарушения на мускулно-скелетната система и съединителната тъкан
Нечести: мускулна слабост и мускулни крампи

Съдови нарушения
Нечести: чувство на студенина или изтръпване на крайниците, хипотония, особено при пациенти с хронична сърдечна недостатъчност
Нечести: ортостатична хипотония

Общи нарушения и ефекти на мястото на приложение
*Нечести:*астения, умора

Хепатобилиарни нарушения
Редки: хепатит

Нарушения на възпроизводителната система и гърдата
Редки: еректилна дисфункция

Психични нарушения
Нечести: нарушения на съня, депресия
Редки: нощни кошмари, халюцинации

Съобщаване на подозирани нежелани реакции
Съобщаването на подозирани нежелани реакции след разрешаване за употреба на лекарствения продукт е важно. Това позволява да продължи наблюдението на съотношението полза/риск за лекарствения продукт. От медицинските специалисти се изисква да съобщават всяка подозирана нежелана реакция чрез Изпълнителна агенция по лекарствата, ул. „Дамян Груев" № 8, 1303 София, тел.: 02 8903417, уебсайт: www.bda.bg.

4.9 Предозиране

Симптоми
При предозиране (напр. дневна доза от 15 mg вместо 7,5 mg) са наблюдавани трета степен AV блок, брадикардия и замайване. Най-честите симптоми, които се наблюдават при предозиране с бета-блокери са брадикрадия, хипотония, бронхоспазъм, остра сърдечна недостатъчност и хипогликемия. Досега са съобщени няколко случая на предозиране с бизопролол (максимум 2 g) при пациенти с хипертония и/или сърдечно-съдово заболяване; всички пациенти са се възстановили. Налице е широка интериндивидуална вариабилност в чувствителността към еднократна висока доза бизопролол; пациенти със сърдечна недостатъчност вероятно са много чувствителни. Ето защо при тези пациенти лечението задължително трябва да започне с постепенно повишаване на дозата, съгласно схемата, посочена в точка 4.2.

Лечение
При предозиране, лечението с бизопролол трябва да се прекрати и да се проведе поддържаща и симптоматична терапия. Ограничени данни предполагат, че бизопролол се диализира трудно. Базирайки се на очакваните фармакологични действия и препоръки за другите бета-блокери трябва да се имат предвид следните общи мерки, когато това е клинично обосновано.

Брадикардия: интравенозно приложение на атропин. Ако отговорът е неадекватен може да се приложи с повишено внимание изопреналин или друго средство с позитивни хронотропни

свойства. При някои обстоятелства може да е необходимо трансвенозно въвеждане на пейсмейкър.

Хипотония: интравенозно приложение на течности и вазопресори. Интравенозно приложен глюкагон може да е от полза.

AV-блок (втора и трета степен): пациентите трябва да бъдат внимателно мониторирани и лекувани инфузионно с изопреналин или въвеждане на трансвенозен сърдечен пейсмейкър.

Остро влошаване на сърдечна недостатъчност: интравенозно приложение на диуретици, инотропни средства, вазодилататори.

Бронхоспазъм: броходилататори, като изопреналин, бета2-симпатикомиметици и/или аминофилин.

Хипогликемия: интравенозно приложение на глюкоза.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: селективни бета-блокери, АТС код: C07AB07

Механизъм на действие
Бизопролол е високо селективен бета$_1$-адренорецепторен блокер, без вътрешна симпатикомиметична и съответна мембраностабилизираща активност. Той показва нисък афинитет към бета$_2$-рецепторите на гладката мускулатура на бронхите и съдовете, както и към бета$_2$-рецепторите, участващи в регулацията на метаболизма. Поради това, бизопролол най-общо не повлиява резистентността на дихателните пътища и бета$_2$-медиираните метаболитни ефекти. Неговата бета$_1$-селективност се разпростира извън терапевтичния дозов диапазон.

Клинична ефикасност и безопасност
Общо 2 647 пациенти са били включени в клинично проучване CIBIS II. 83% (n = 2202) са били с клас III по NYHA и 17% (n = 445) с клас IV по NYHA. Те са имали стабилни симптоматична систолична сърдечна недостатъчност (фракция на изтласкване <35%, установена ехокардиографски). Общата смъртност е била намалена от 17,3% до 11,8% (относително намаление 34%). Установено е намаляване случаите на внезапна смърт (3,6% спрямо 6,3%, относително намаление 44%) и броя на епизодите на сърдечна недостатъчност, изискващи хоспитализация (12% спрямо 17,6%, относително намаление 36%). В края на изследването е било отчетено сигнификантно подобрение на функционалния статус по NYHA класификация. В началото на лечението и при титриране с бизопролол са били установени - хоспитализация в резултат на брадикардия (0,53%), хипотония (0,23%), и остра декомпенсация (4,97%), но те не са били по-чести в сравнение с плацебо-групата (0%, 0,3% и 6,74%). Броят на фаталните и изваждащи от проучването инциденти по време на общия период на проучването са били 20 в групата с бизопролол и 15 в плацебо групата.

В клиничното проучване CIBIS III са изследвани 1 010 пациенти на възраст ≥ 65 години, с лека до умерена хронична сърдечна недостатъчност (CHF; II или III клас NYHA) и лява вентрикуларна фракция на изтласкване ≤ 35%, които не са били лекувани преди с ACE-инхибитори, бета-блокери или ангиотензин рецепторни блокери. Изследването сравнява безопасността и ефективността на първоначална шестмесечна монотерапия с бизопролол (таргетна доза 10 mg веднъж дневно), към която се прибавя ACE-инхибитор еналаприл (таргетна доза 10 mg два пъти дневно) в продължение на още 6 до 24 месеца, с противоположната последователност на първоначалното лечение. Всяка група се състои от 505 пациенти.

Двете стратегии са сляпо сравнени, както по отношение на комбинираната обща крайна цел (обща смъртност или хоспитализация), така и по отношение на всеки от тези компоненти по отделно. От лекуваните пациенти общата крайна цел е постигната при 178 пациенти (35,2 %) от групата, лекувана първо с бизопролол, срещу 186 пациенти (36,8 %) от групата, лекувана първо с еналаприл, което показва, че лечението, започнало с бизопролол, е сравнимо по ефективност с лечението, започнало с еналаприл. При първоначално лечение с бизопролол са починали 65 пациенти срещу 73, лекувани първо с еналаприл (междугрупова разлика p=0,44) и 151 срещу 157 хоспитализирани пациенти (p=0,66). Броят на сериозни и общи нежелани лекарствени реакции е подобен за двете групи. Анализът на данните за първата година показва незначителна тенденция към намаляване на общата смъртност на групата, лекувана първо с бизопролол, с 31% в сравнение с тази, лекувана първо с еналаприл. Статистически значимото намаляване на риска от внезапна смърт с 46% (p=0,049) през първата година главно допринася за по-добрата преживяемост на групата, лекувана първо с бизопролол.
Двете стратегии за начало на лечение на хронична сърдечна недостатъчност показват подобни общи резултати по отношение на смъртност и хоспитализация, както и тенденция към удължена преживяемост, по-специално чрез редукция на внезапната смърт, наблюдавана при групата, лекувана първо с бизопролол. Резултатите показват, че поради сходната безопасност и ефикасност, лечението на хронична сърдечна недостатъчност може да започне или с бизопролол, или с еналаприл.

Бизопролол също така се използва за лечение на хипертония и стенокардия.
Бизопролол няма изразен негативен инотропен ефект.
Бизопролол достига максималния си антихипертензивен ефект 3-4 часа след перорален прием.
Елиминационния му полуживот в плазмата от 10-12 часа му осигурява 24 часова ефективност след еднодозов дневен прием.
Максималният хипертензивен ефект на бизопролол принципно се достига след 2 седмици.

При остро приложение при пациенти с коронарна сърдечна болест без хронична сърдечна недостатъчност, бизопролол намалява сърдечната честота и ударния обем и по този начин намалява сърдечния дебит и кислородната консумация. При хронично приложение първоначално повишената периферна резистентност се понижава.

5.2 Фармакокинетични свойства

Абсорбция
Бизопролол се резорбира почти напълно в гастроинтестиналния тракт. Едновременно с малкия first pass ефект в черния дроб, това води до висока бионаличност - приблизително 90%.
При пациенти със сърдечна недостатъчност (NYHA Клас III) плазмените концентрации на бизопролол са по-високи и полуживотът е удължен в сравнение с този при здрави доброволци.
Максималните плазмени концентрации в равновесно състояние са 64±21 ng/ml при дневна доза 10 mg, а полуживотът е 17±5 часа.

Разпределение
Свързването с плазмените протеини на бизопролол е около 30%. Обемът на разпределение е 3,5 l/kg.

Биотрансформация и елиминиране
Бизопролол се екскретира от организма по два пътя - 50 % се метаболизира в черния дроб до неактивни метаболити, които след това се екскретират през бъбреците, а останалите 50% се екскретират през бъбреците в неметаболизирана форма. Тъй като елиминирането заема еднакво място както чрез бъбреците, така и чрез черния дроб, не се изисква корекция и адаптиране на дозата при пациенти с нарушена чернодробна функция или бъбречна недостатъчност.
Общият клирънс е средно 15 l/h.
Времето на полуживот (10-12 часа) осигурява 24 часа ефикасност след еднократна дневна доза.

Линейност/нелинейност
Кинетиката на бизопролол е линейна и независима от възрастта.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Предклиничните данни не показват специална опасност за хора, въз основа на конвенционалните изследвания за фармакологична безопасност, токсичност при многократно дозиране, генотоксичност или канцерогенност. Подобно на другите бета-блокери, бизопролол предизвиква токсични ефекти при майката (намаляване приема на храна и намаляване на телесното тегло) и ембрио/фетална токсичност (повишена честота на резорбции, намаляване на теглото при раждане, забавяне на физическото развитие) при високи дози, без данни за тератогенно действие.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Блокбис Кор 2,5 mg таблетки:
Лактоза монохидрат
Микрокристална целулоза
Магнезиев стеарат
Кросповидон

Блокбис Кор 5 mg таблетки:
Лактоза монохидрат
Микрокристална целулоза
Магнезиев стеарат
Кросповидон
Жълт оцветител - PB 22812, съдържащ лактоза монохидрат и жълт железен оксид [E172]

6.2 Несъвместимости

Неприложимо.

6.3 Срок на годност

3 години

6.4 Специални условия на съхранение

Да се съхранява под 30°C.

6.5 Вид и съдържание на опаковката

По 10 таблетки в Al/PVC/PVdC блистери; по 30 и 100 таблетки в кутия.

6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне и работа

Няма специални изисквания.
Неизползваният лекарствен продукт или отпадъчните материали от него трябва да се изхвърлят в съответствие с местните изисквания.

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА * РЕПУБЛИКА БЪЛГАРИЯ *

7 ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Teva B.V.
Swensweg 5, 2031 GA Haarlem
Нидерландия

8. НОМЕР НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Блокбис Кор 2,5 mg таблетки - рег. № 20100325
Блокбис Кор 5 mg таблетки - рег. № 20100326

9 ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ/ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Дата на първо разрешаване: 19.05.2010 г.
Дата на последно подновяване: 08.05.2015 г.

10 ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

22.09.2026

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА * РЕПУБЛИКА БЪЛГАРИЯ *