

SÚHRN CHARAKTERISTICKÝCH VLASTNOSTÍ LIEKU

1. NÁZOV LIEKU

Bisomerck 5
filmom obalené tablety

2. KVALITATÍVNE A KVANTITATÍVNE ZLOŽENIE

Jedna filmom obalená tableta obsahuje 5 mg bizoprolólium-fumarátu.

Úplný zoznam pomocných látok, pozri časť 6.1.

3. LIEKOVÁ FORMA

Filmom obalená tableta

Vzhľad tablety: žltkastobiele, bikonvexné, filmom obalené tablety srdiečkovitého tvaru, s deliacou ryhou na oboch stranách.

Tableta sa môže rozdeliť na rovnaké dávky.

4. KLINICKÉ ÚDAJE

4.1 Terapeutické indikácie

- Liečba hypertenzie.
- Liečba ischemickej choroby srdca (angina pectoris).

4.2 Dávkovanie a spôsob podávania

Dávkovanie

Pre obe indikácie je dávka 5 mg bizoprolólium-fumarátu raz denne. Ak je to potrebné, môže byť dávka zvýšená na 10 mg bizoprolólium-fumarátu raz denne.

Maximálna odporúčaná dávka je 20 mg bizoprolólium-fumarátu raz denne.

Vo všetkých prípadoch je dávka upravovaná individuálne, predovšetkým podľa srdcovej frekvencie a úspechu terapie.

Dĺžka trvania liečby

Liečba bizoprololom je vo všeobecnosti dlhodobá.

Liečba bizoprololom nesmie byť skončená náhle, keďže toto môže viesť k prechodnému zhoršeniu stavu. Obzvlášť u pacientov s ischemickou chorobou srdca nesmie byť liečba náhle prerušená.

Odporúča sa postupná redukcia dávky.

Porucha funkcie pečene alebo obličiek

U pacientov s miernou až stredne ťažkou poruchou funkcie pečene a obličiek nie je úprava dávky zvyčajne potrebná. U pacientov s ťažkou poruchou funkcie obličiek (klírens kreatinínu <20 ml/min) a u pacientov s ťažkou poruchou funkcie pečene nemá byť prekročená denná dávka 10 mg bizoprolólium-fumarátu.

Skúsenosti s použitím bizoprololu u dialyzovaných pacientov sú obmedzené; avšak nie sú údaje o zmene dávkovacej schémy.

Starší pacienti

Nie je potrebná úprava dávky.

Pediatrická populácia

S bizoprololom nie sú žiadne pediatrické skúsenosti, preto sa jeho používanie u detskej populácie neodporúča.

Spôsob podávania

Tablety Bisomercku sa majú užívať ráno s jedlom alebo bez jedla. Majú sa prehltnúť s tekutinou a nemajú sa rozhrýzť.

4.3 Kontraindikácie

Bizoprolol je kontraindikovaný u pacientov:

- s akútnym srdcovým zlyhaním alebo počas epizód dekompenzácie srdcového zlyhania, ktoré vyžaduje i.v. inotropnú terapiu,
- s kardiogénnym šokom,
- s AV blokádou druhého alebo tretieho stupňa (bez kardiostimulátora),
- so syndrómom chorého sínusu,
- so sinoatriálnou blokádou,
- so symptomatickou bradykardiou,
- so symptomatickou hypotenziou,
- s ťažkou bronchiálnou astmou,
- s ťažkou formou periférneho artériového ochorenia alebo s ťažkou formou Raynaudovho syndrómu,
- s neliečeným feochromocytómom (pozri časť 4.4),
- s metabolickou acidózou,
- s precitlivosťou na bizoprolol alebo na ktorúkoľvek z pomocných látok uvedených v časti 6.1.

4.4 Osobitné upozornenia a opatrenia pri používaní

Predovšetkým u pacientov s ischemickou chorobou srdca nesmie byť liečba náhle prerušená, pokiaľ to nie je jasne indikované, pretože náhle prerušenie liečby môže viesť k prechodnému zhoršeniu stavu (pozri časť 4.2).

Bizoprolol musí byť použitý s opatrnosťou u pacientov s hypertenziou alebo angínou pectoris a so sprievodným srdcovým zlyhaním.

Bizoprolol musí byť opatrne užívaný pri:

- diabete mellitus s veľkými výkyvmi hodnôt glukózy v krvi. Symptómy hypoglykémie môžu byť maskované (napr. tachykardia, palpitácie alebo potenie),
- prísnom hladovaní,
- prebiehajúcej desenzibilizačnej liečbe, podobne ako iné betablokátory, bizoprolol môže zvýšiť senzitivitu na alergény a závažnosť anafylaktických reakcií. Liečba adrenalínom nemusí mať vždy očakávaný terapeutický efekt,
- A-V blokáde I.stupňa,
- Prinzmetalovej angíne. Boli pozorované prípady koronárneho vazospazmu. Napriek vysokej beta-1 selektivitě, nie je možné úplne vylúčiť záchvaty angíny, keď sa bizoprolol podáva pacientom s Prinzmetalovou angínou.
- Periférneho artériového ochorenia. Najmä na začiatku liečby môže dôjsť k intenzifikácii ťažkostí.

Pacientom so psoriázou alebo so psoriázou v anamnéze je možné podať betablokátory (napr. bizoprolol) len po starostlivom zvážení pomeru prínosu a rizika liečby.

Symptómy tyreotoxikózy môžu byť maskované počas liečby bizoprololom.

Pacientom s feochromocytómom možno podať bizoprolol až po blokáde alfareceptorov.

U pacientov s celkovou anestéziou si anesteziológ musí uvedomovať riziko betablokády. Ak je potrebné pred operáciou betablokačnú liečbu prerušiť, táto liečba sa má postupne znižovať a skončiť minimálne 48 hodín pred anestéziou.

Hoci kardioselektívne (β_1) β -blokátory môžu mať nižší účinok na pľúcne funkcie ako neselektívne

β - blokátory, tak ako všetky β -blokátory, nemajú sa podávať pacientom s obštrukčnou chorobou dýchacích ciest, ak pre ich použitie nie sú závažné klinické dôvody. Ak existujú dôvody na použitie, Bisomerck sa má použiť s opatnosťou.

Pri bronchiálnej astme, alebo iných chronických obštrukčných pľúcnych chorobách, ktoré môžu spôsobovať symptómy, je potrebné podávať súbežne bronchodilatačnú liečbu. U pacientov s astmou sa môže príležitostne vyskytnúť zvýšenie odporu dýchacích ciest, preto môže byť nutné zvýšenie dávky β_2 -mimetík.

4.5 Liekové a iné interakcie

Kombinácie, ktoré sa neodporúčajú

Antagonisty vápnika typu verapamilu a v menšom množstve typu diltiazému: Negatívny vplyv na kontraktilitu a atrioventrikulárne vedenie.

Intravenózne podávania verapamilu u pacientov liečených betablokátorom môže viesť k ťažkej hypotenzii a atrioventrikulárnemu bloku.

Centrálne pôsobiace antihypertenzíva, (napr. klonidín, metyldopa, moxonidín, rilmenidín): Súbežné užívanie centrálne pôsobiacich antihypertenzív môže viesť k zníženiu srdcového tepu a srdcového minútového objemu a k vazodilatácii. Náhle prerušenie môže spôsobiť zvýšenie rizika „rebound“ hypertenzie.

Kombinácie, pri ktorých je nutná zvýšená opatnosť

Antagonisty vápnika typu dihydropyridínu (napr. nifedipín): Súbežným podávaním môže dôjsť k zvýšeniu rizika hypotenzie a nie je možné vylúčiť zvýšené riziko ďalšieho zhoršovania funkcie ventrikulárnej pumpy u pacientov so zlyhaním srdca.

Antiarytmiká I. triedy (napr. chinidín, dizopyramid, lidokaín, fenytoín; flekainid, propafenón): Môže dôjsť k zosilneniu účinku na dobu atrioventrikulárneho vedenia a k zvýšeniu negatívneho inotropného účinku.

Antiarytmiká III. triedy (napr. amiodarón): Môže dôjsť k zosilneniu účinku na dobu atrioventrikulárneho vedenia.

Parasympatikomimetiká: Súbežným podávaním môže dôjsť k predĺženiu času atrioventrikulárneho vedenia a k zvýšeniu rizika bradykardie.

Lokálne betablokátory (napr. očné kvapky určené na liečbu glaukómu) môžu zvýšiť systémové účinky bizoprololu.

Inzulín a perorálne antidiabetiká : Intenzifikácia účinku znižujúceho hladinu cukru v krvi. Blokáda β -adrenoreceptorov môže maskovať symptómy hypoglykémie.

Anestetiká: Potlačenie reflexnej tachykardie a zvýšenie rizika hypotenzie (ďalšie informácie o celkovej anestézii nájdete v časti 4.4).

Srdcové glykozidy: zníženie srdcovej frekvencie, predĺženie atrioventrikulárneho prevodu.

Nesteroidné protizápalové lieky (NSAID): NSAID môžu znížiť hypotenzívny účinok bizoprololu.

β -sympatomimetiká (napr. izoprenalín, dobutamín): Kombinácia s bizoprololom môže vzájomne znížiť účinky oboch liekov.

Sympatomimetiká, ktoré aktivujú β - aj α -adrenoreceptory: Kombináciou s bizoprololom môže dôjsť k zvýšeniu krvného tlaku. Takéto interakcie sú pravdepodobnejšie v prípade neselektívnych β -blokátorov.

Súbežné užívanie antihypertenzív, ako aj iných liekov, ktoré môžu spôsobiť zníženie krvného tlaku (napr. tricyklické antidepresíva, barbituráty, fenotiazíny), môže zvýšiť riziko hypotenzie.

Kombinácie, ktoré prichádzajú do úvahy

Meflochin: zvýšené riziko bradykardie.

Inhibítory monoaminoxidázy (okrem MAO-B inhibítorov): Zvýšený hypotenzný účinok betablokátorov, ale aj riziko hypertenznej krízy.

4.6 Fertilita, gravidita a laktácia

Gravidita

Bizoprolol má farmakologické účinky, ktoré môžu spôsobiť škodlivé účinky na graviditu a/alebo plod/novorodenca. Betablokátory vo všeobecnosti znižujú perfúziu placenty, čo býva spojené s retardáciou rastu, intrauterinnou smrťou, potratom a predčasným pôrodom. U plodu a novorodenca sa môžu vyskytnúť nežiaduce účinky (napr. hypoglykémia a bradykardia). Ak je potrebná liečba betablokátormi, uprednostňujú sa β_1 -selektívne blokátory adrenoreceptorov.

Bisomerck sa nemá užívať v gravidite okrem prípadov, ak je to nevyhnutné. Ak sa zväži, že je potrebná liečba bizoprololom, je potrebné monitorovať uteroplacentárny prietok krvi a rast plodu. V prípade škodlivých účinkov na graviditu alebo na plod je potrebné zvážiť alternatívnu liečbu. Novorodenec sa musí starostlivo monitorovať. Hypoglykemické symptómy a bradykardia sa zvyčajne vyskytujú počas prvých 3 dní.

Laktácia

Nie sú k dispozícii žiadne údaje o vylučovaní bizoprololu do materského mlieka alebo o bezpečnosti expozície bizoprololu u detí.

Dojčenie sa preto počas podávania Bisomercku neodporúča.

4.7 Ovplyvnenie schopnosti viesť vozidlá a obsluhovať stroje

V štúdií pacientov s ischemickou chorobou srdca bizoprolol nezhoršil schopnosť vedenia vozidiel. Avšak, nakoľko sú prítomné individuálne rozdiely v reakciách na liečivo, môže sa vyskytnúť zhoršenie schopnosti vedenia vozidla alebo obsluhovať stroje. Toto je potrebné zvážiť najmä na začiatku liečby a pri zmene liečby, ako aj pri súčasnom užití alkoholu.

4.8 Nežiaduce účinky

Frekvencia výskytu nežiaducich účinkov je zoradená podľa nasledujúcej konvencie: časté ($\geq 1/100$ až $< 1/10$), menej časté ($\geq 1/1000$ až $< 1/100$), zriedkavé ($\geq 1/10\,000$ až $< 1/1000$) a veľmi zriedkavé ($< 1/10\,000$).

Laboratórne a funkčné vyšetrenia

Zriedkavé: zvýšenie triglyceridov, zvýšenie pečeňových enzýmov (ALT, AST).

Poruchy srdca a srdcovej činnosti

Menej časté: poruchy atrioventrikulárneho vedenia, zhoršenie už existujúceho srdcového zlyhania, bradykardia.

Poruchy nervového systému

Časté: závraty*, bolesti hlavy*.

Zriedkavé: synkopa.

Poruchy oka

Zriedkavé: zníženie tvorby slz (zvážiť u pacientov, ktorí používajú kontaktné šošovky).

Veľmi zriedkavé: konjunktivitída.

Poruchy ucha a labyrintu

Zriedkavé: zhoršenie sluchu.

Poruchy dýchacej sústavy, hrudníka a mediastína

Menej časté: bronchospazmus u pacientov s bronchiálnou astmou alebo s obštrukčnou chorobou dýchacích ciest v anamnéze.

Zriedkavé: alergická rinitída.

Poruchy gastrointestinálneho traktu

Časté: nauzea, vracanie, hnačka, zápcha.

Poruchy kože a podkožného tkaniva

Zriedkavé: reakcie hypersenzitivity (svrbenie, sčervenanie, vyrážka a angioedém).

Veľmi zriedkavé: alopecia. β -blokátory môžu vyvolať alebo zhoršiť psoriázu alebo indukovať psoriázu podobné vyrážky.

Poruchy kostrovej a svalovej sústavy a spojivového tkaniva

Menej časté: svalová slabosť, kŕče.

Poruchy ciev

Časté: pocit chladných a meravých končatín.

Menej časté: hypotenzia.

Celkové ochorenia

Časté: únava*.

Menej časté: asténia.

Poruchy pečene a žľazových ciest

Zriedkavé: hepatitída.

Poruchy reprodukčného systému a prsníkov

Zriedkavé: erektilná dysfunkcia.

Psychické poruchy

Menej časté: depresia, poruchy spánku.

Zriedkavé: nočné mory, halucinácie.

* Tieto symptómy sa vyskytujú predovšetkým na začiatku liečby. Sú zvyčajne mierne a spravidla vymiznú počas prvých 2 týždňov.

Hlásenie podozrení na nežiaduce reakcie

Hlásenie podozrení na nežiaduce reakcie po registrácii lieku je dôležité. Umožňuje priebežné monitorovanie pomeru prínosu a rizika lieku. Od zdravotníckych pracovníkov sa vyžaduje, aby hlásili akékoľvek podozrenia na nežiaduce reakcie na [národné centrum hlásenia uvedené v Prílohe V](#).

4.9 Predávkovanie

Najčastejšie príznaky, ktoré je možné očakávať pri predávkovaní β -blokátorom sú: bradykardia, hypotenzia, bronchospazmus, akútna kardiálna insuficiencia a hypoglykémia.

Existuje široká interindividuálna variabilita v citlivosti na jednorazovú vysokú dávku bizoprololu a pacienti so srdcovým zlyhaním sú pravdepodobne veľmi citliví.

Vo všeobecnosti je pri predávkovaní potrebné prerušiť liečbu bizoprololom a poskytnúť podpornú a symptomatickú liečbu.

Limitované údaje naznačujú, že bizoprolol je ťažko dialyzovateľný.

5. FARMAKOLOGICKÉ VLASTNOSTI

5.1 Farmakodynamické vlastnosti

Farmakoterapeutická skupina: selektívne betablokátory
ATC kód: C07AB07

Bizoprolol je β_1 selektívny betablokátor bez vnútornej sympatikomimetickkej a membránu stabilizujúcej aktivity. Vykazuje len veľmi malú afinitu k beta 2- receptorom hladkej svaloviny bronchov a ciev rovnako ako k beta 2- receptorom zúčastňujúcim sa metabolickej regulácie. Pri bizoprolole sa vo všeobecnosti neočakáva vplyv na rezistenciu dýchacích ciest a beta -2 sprostredkované metabolické účinky. β_1 selektivita bizoprololu pokrýva celú šírku terapeutického rozmedzia.

Bizoprolol nemá výrazný negatívny inotropný efekt.

Bizoprolol dosahuje maximálny efekt 3-4 hodiny po perorálnom podaní. Výsledkom 10-12 hodinového polčasu bizoprololu je jeho 24-hodinová účinnosť po podaní raz denne.

Maximálny antihypertenzívny účinok bizoprololu sa vo všeobecnosti dosiahne po 2 týždňoch.

Pri akútnom podaní u pacientov s ischemickou chorobou srdca bez chronického srdcového zlyhávania, bizoprolol znižuje frekvenciu srdca a vývrhový objem, čím znižuje srdcový výdej a spotrebu kyslíka.

Pri chronickom podávaní sa úvodná zvýšená periférna rezistencia znižuje. Okrem iného sa diskutuje o znížení plazmatickej renínovej aktivity ako o mechanizme účinku beta blokátorov.

Bizoprolol znižuje odpoveď na sympatoadrenergnú aktivitu blokádou kardiálnych betareceptorov.

Toto spôsobuje zníženie frekvencie srdca a jeho kontrakility a tým zníženie spotreby kyslíka myokardom, čo je želaný efekt pri angíne pectoris s ischemickou chorobou srdca.

5.2 Farmakokinetické vlastnosti

Absorpcia

Bizoprolol sa takmer úplne (>90 %) absorbuje z gastrointestinálneho traktu s veľmi malým first-pass efektom v pečeni (asi 10 %), má po perorálnom podaní absolútnu biologickú dostupnosť približne 90 %.

Distribúcia

Distribučný objem je 3,5 l/kg. Väzba na plazmatické bielkoviny je približne 30 %.

Biotransformácia a eliminácia

Bizoprolol sa vylučuje z tela dvoma rovnako účinnými cestami: 50 % sa metabolizuje v pečeni na inaktívne metabolity, ktoré sa potom vylučujú obličkami. Ostávajúcich 50 % sa vylučuje obličkami v nezmenenej forme. Celkový klírens je približne 15 l/h. Plazmatický polčas vylučovania je 10-12 hodín a zaručuje 24 hodinový účinok pri dávkovaní raz denne.

Linearita

Kinetika bizoprololu je lineárna a nezávislá od veku.

Osobitná populácia

Vzhľadom na to, že vylučovanie prebieha v rovnakom rozsahu obličkami a pečeňou, nie je potrebná úprava dávkovania u pacientov s poruchou pečeneových alebo renálnych funkcií.

5.3 Predklinické údaje bezpečnosti

Predklinické údaje neodhalili žiadne osobitné riziko pre ľudí na základe obvyklých štúdií toxicity po jednorazovom a opakovanom podávaní, genotoxicity alebo karcinogenity. Podobne ako ostatné β -blokátory, bol bizoprolol vo vysokých dávkach toxický pre matku (znížený príjem jedla a znížená telesná hmotnosť) a embryo/plod (zvýšená incidencia rezorpcií, znížená pôrodná hmotnosť dieťaťa, retardácia psychického vývoja), ale nebol teratogénny.

6. FARMACEUTICKÉ INFORMÁCIE

6.1 Zoznam pomocných látok

Jadro tablety:

koloidný oxid kremičitý
stearát horečnatý
krospovidón
mikrokryštalická celulóza
kukuričný škrob
hydrogenfosforečnan vápenatý

Filmový obal:

dimetikón 100
makrogol 400
oxid titaničitý (E171)
hypromelóza
žltý oxid železitý (E172)

6.2 Inkompatibility

Neaplikovateľné.

6.3 Čas použiteľnosti

5 rokov

6.4 Špeciálne upozornenia na uchovávanie

Uchovávajúte pri teplote do 30 °C.

6.5 Druh obalu a obsah balenia

Blister PVC/Al, papierová škatuľa
Veľkosť balenia: 30 filmom obalených tabliet

7. DRŽITEĽ ROZHODNUTIA O REGISTRÁCII

MERCK spol. s r.o., Dvořákovo nábřeží 4, 810 06 Bratislava, Slovenská republika

8. REGISTRAČNÉ ČÍSLO

41/0054/03-S

9. DÁTUM PRVEJ REGISTRÁCIE/PREDĽŽENIA REGISTRÁCIE

Dátum prvej registrácie: 14.03.2003
Dátum posledného predĺženia registrácie: 04.06.2008

10. DÁTUM REVÍZIE TEXTU

11/2025