

COMPRIMIDOS

ANTIHIPERTENSIVO

COMPOSICION

Cada comprimido contiene:

Bisoprolol fumarato 2.5 mg, 5 mg y 10 mg, respectivamente
Excipientes, c.s.

PROPIEDADES

Es un bloqueador de los receptores beta 1 adrenérgicos altamente selectivo, desprovisto de actividad estimuladora y de efecto estabilizador de membrana relevante. Presenta una escasa afinidad por los receptores beta 2 de la musculatura lisa bronquial y vascular, así como por los receptores beta 2 implicados en la regulación metabólica. Por ello no es de esperar que afecte a las resistencias aéreas ni a los efectos metabólicos mediados por receptores beta 2. La selectividad beta 1 se mantiene a dosis superiores de las terapéuticamente recomendadas. No presenta un efecto inotrópico negativo pronunciado. En los estudios de insuficiencia cardíaca (CIBIS I, CIBIS II), en los que se administró conjuntamente con diuréticos e inhibidores de la ECA, se observó un efecto beneficioso en la supervivencia: en el estudio CIBIS II se ha demostrado una reducción muy significativa en todas las causas de mortalidad (11.8% en el grupo bisoprolol vs. 17.3% en el grupo placebo, disminución relativa 34%). Tras administración aguda en pacientes afectados de enfermedad coronaria sin insuficiencia cardíaca, reduce la frecuencia cardíaca y el volumen minuto, y por tanto el gasto cardíaco. En la administración crónica disminuyen las resistencias vasculares periféricas que se ven aumentadas al inicio.

FARMACOCINETICA

Se absorbe y tiene una biodisponibilidad de un 90% tras administración oral. Aproximadamente un 30% se halla unido a proteínas plasmáticas. El volumen de distribución es de 3.5 l/kg. El aclaramiento total es de aproximadamente 15 l/h. La vida media plasmática es de 10-12 horas, lo que proporciona un efecto de 24 horas tras dosis única diaria. Se excreta en la misma proporción por 2 vías. La mitad (50%) se metaboliza en el hígado dando lugar a metabolitos inactivos que serán excretados por los riñones. La otra mitad (50%) se excreta por los riñones de forma inalterada. Dado que la eliminación tiene lugar en la misma proporción en hígado y riñones, no se suele requerir un ajuste de dosificación en pacientes con insuficiencia renal o función hepática deteriorada. No se ha estudiado la farmacocinética en pacientes con insuficiencia cardíaca crónica estable y con función hepática o renal deteriorada. La cinética es lineal e independiente de la edad. Los niveles plasmáticos en pacientes con insuficiencia cardíaca crónica estable y crónica (NYHA grado III) son mayores y la vida media se prolonga en comparación con los valores de los voluntarios sanos. La concentración plasmática máxima a nivel constante es de 64 +/- 21 ng/mL a una dosis diaria de 10 mg y vida media de 17 +/- 5 horas.

TOXICOLOGIA

Los estudios toxicológicos no revelaron daño orgánico irreversible por esta sustancia. En experimentos animales no fue citotóxico ni mutagénico. Aunque fue embriotóxico a altas dosis no fue ni teratogénico ni carcinogénico en el ratón.

INFORMACION CLINICA

INDICACIONES

Tratamiento de la hipertensión arterial y cardiopatía coronaria (angina de pecho). Tratamiento de la insuficiencia cardíaca crónica estable de moderada a severa, con función ventricular sistólica reducida, y en asociación con inhibidores ECA y diuréticos y, opcionalmente, glucósidos cardíacos.

CONTRAINDICACIONES

Shock cardiogénico, bloqueo AV de segundo o tercer grado (sin marcapaso), síndrome del nodo sinusal, trastorno en la transmisión de la excitación entre el nodo sinusal y las aurículas (bloqueo senoauricular). Bradicardia inferior a 60 latidos por minuto previo al inicio del tratamiento, hipotensión (presión arterial sistólica inferior a 100 mg Hg), oclusión arterial periférica avanzada y estadios tardíos de trastornos arteriales periféricos o espasmos vasculares en los dedos del pie y de la mano (Síndrome de Raynaud), feocromocitoma no tratado, hipersensibilidad a la sustancia activa u otro componente del producto, acidosis metabólica.

EFFECTOS INDESEABLES

Lasitud, mareos, cefalea ligera, empeoramiento de la claudicación intermitente o del Síndrome de Raynaud, y parestesias en las extremidades. ocasionalmente se puede observar un marcado descenso de la presión sanguínea y de la frecuencia del pulso o trastornos de la conducción AV, erupciones cutáneas y ojos secos, trastornos gastrointestinales, gastralgias, náuseas, vómitos y diarrea. Posibilidad de crisis asmática, hipoglucemia.

PRECAUCIONES

Usar con cuidado en pacientes con intervalo de conducción PR prolongado, reserva cardíaca baja y trastornos de la circulación periférica, como el Síndrome de Raynaud. El tratamiento no debe ser discontinuado de forma abrupta en pacientes con cardiopatías isquémicas.

Puede ser empleado con precaución en pacientes con enfermedades obstructivas crónicas de las vías respiratorias.

USO EN EMBARAZO Y LACTANCIA

No se han encontrado efectos teratogénicos en los estudios realizados en animales, pero la seguridad de este producto durante el embarazo no ha sido establecida. Por ello, su empleo durante el embarazo debe hacerse a criterio del médico. No deberá ser usado durante la lactancia.

INTERACCIONES

No se recomienda la asociación de este medicamento con antagonistas del calcio no dihidropiridínicos, clonidina, inhibidores de la monoaminoxidasa (IMAO-8). Deberá tenerse precaución con la utilización de antiarrítmicos de clase I (disopiramida, quinidina); antiarrítmicos de clase III (amiodarona); otros β -bloqueadores; insulina, y antidiabéticos orales; sustancias anestésicas. Debe tenerse un especial cuidado con la utilización de digitálicos; sustancias inhibidoras de la prostaglandina sintetasa; derivados de la ergotamina; simpaticomiméticos; antidepresivos tricíclicos; barbitúricos, fenotiazinas y otros fármacos antihipertensivos; rifampicina.

SOBREDOSIS

Actualmente no hay experiencia en lo que se refiere a sobredosificación en la insuficiencia cardíaca crónica. Los síntomas esperados con mayor frecuencia en la sobredosificación de betabloqueadores son bradicardia, hipotensión, broncoespasmo, insuficiencia cardíaca aguda e hipoglucemia. Hasta la fecha se han reportado únicamente algunos casos de sobredosificación (máximo 2000 mg) con esta sustancia, apareciendo bradicardia y/o hipotensión, recuperándose todos los pacientes. Después de la administración de una dosis única elevada, existe una gran variabilidad interindividual y parece ser que los pacientes con insuficiencia cardíaca son muy

sensibles a pequeñas oscilaciones de dosis. Por lo tanto, es condición indispensable iniciar el tratamiento de estos pacientes de forma gradual. En general, si se diera una sobredosis, se debería interrumpir el tratamiento e instaurar tratamiento sintomático y de apoyo. Los pocos datos disponibles indican que no es prácticamente dializable. En base a los esperados efectos farmacológicos y las recomendaciones para otros betabloqueantes, se tomarán las siguientes medidas: Bradicardia: Administración I.V. de atropán. Si la respuesta es inapropiada podrá utilizarse isoproterenol o cualquier otro fármaco con actividad cronotrópica positiva. En algunos casos puede ser necesaria la colocación de un marcapaso transvenoso.

Hipotensión: Se administrarán líquidos I.V. y vasopresores. Puede ser útil la administración de glucagón I.V.

Bloqueo AV (2º ó 3º grado): Los pacientes deberán ser cuidadosamente monitorizados administrándoles isoproterenol en infusión o, si se considera apropiado, mediante la colocación de un marcapaso transvenoso.

Empeoramiento agudo de la insuficiencia cardíaca: Administración I.V. de diuréticos, fármacos inotrópicos y vasodilatadores.

Broncoespasmo: Administrar tratamiento broncodilatador como isoproterenol y/o aminofilina.

Hipoglucemia: Administración de glucosa I.V.

USO Y DOSIS

Hipertensión arterial y angina de pecho: La dosis usual es de un comprimido al día. La dosis máxima es de 20 mg al día. Es conveniente iniciar el tratamiento con 5 mg al día.

Insuficiencia cardíaca crónica: 2.5 mg al día durante una semana. Si fuera necesario y la tolerancia es buena, se aumentará la dosis a 5 mg al día, durante las siguientes semanas, a 7.5 mg al día durante las otras cuatro semanas y a 10 mg al día como terapia de mantenimiento.

VIA DE ADMINISTRACION

Oral.

Antes de consumir este o cualquier otro medicamento, debe siempre consultar a su médico.

En caso de un marcado efecto secundario, sea este por sobredosis o reacción particular, acuda inmediatamente a su médico.

INFORMACION FARMACEUTICA

DURACION DE ESTABILIDAD

Verificar fecha de vencimiento señalada en el envase.

PRECAUCIONES ESPECIALES PARA SU CONSERVACION

Conservar a una temperatura menor o igual a los 30°C.

PRESENTACION

Caja conteniendo 3 tirillas de 10 comprimidos.

NOTA IMPORTANTE

Este producto se encuentra envasado y protegido en una adecuada y rigurosa laminación, especialmente diseñada para evitar su exposición con la luz y humedad, descartando además que por descuidos involuntarios los niños puedan acceder al mismo.

NUMEROS DE REGISTRO SANITARIO

Comprimidos de 2.5 mg: 2011-0150

Comprimidos de 5 mg: 2009-0675

Comprimidos de 10 mg: 2008-0805

Venta por receta médica.

Mantener fuera del alcance de los niños.

Producto fabricado por
Ethical Pharmaceutical, S.R.L.
de República Dominicana
Registro Industrial 14109