

R_x– Thuốc này chỉ dùng theo đơn thuốc



BUDEX® 2.5

(Viên nén bao phim Bisoprolol fumarate 2,5 mg)

CÁC DẤU HIỆU LƯU Ý VÀ KHUYẾN CÁO KHI DÙNG THUỐC

Đọc kỹ hướng dẫn sử dụng trước khi dùng.

Đề xa tâm tay trẻ em.

THÀNH PHẦN CÔNG THỨC THUỐC

Mỗi viên nén bao phim có chứa:

Thành phần hoạt chất: Bisoprolol fumarate 2,5 mg

Thành phần tá dược: Lactose monohydrate spray dried (Flowlac 100), microcrystalline cellulose (Avicel PH 102), pregelatinized starch (Starch 1500), sodium starch glycolate, magnesium stearate, colloidal silicon dioxide (Aerosil 200/Cab-o-sil M5P), opadry yellow (200F520013) (Thành phần: Polyvinyl alcohol part hydrolyzed, talc, titanium dioxide, macrogol/PEG, methacrylic acid and ethyl acrylate copolymer, D&C Yellow #10 Aluminium Lake, Ferric oxide Yellow, sodium bicarbonate).

DẠNG BÀO CHẾ

Dạng bào chế: Viên nén bao phim.

Mô tả dạng bào chế: Viên nén bao phim màu vàng, hình tròn, có vạch chia liều trên một mặt, mặt còn lại nhẵn.

CHỈ ĐỊNH

Điều trị bệnh suy tim mạn tính ổn định kèm suy giảm chức năng tâm thu thất trái, kết hợp với thuốc ức chế men chuyển, thuốc lợi tiểu và các glycoside tim.

CÁCH DÙNG, LIỀU DÙNG

Phác đồ điều trị chuẩn suy tim mạn tính gồm có các thuốc ức chế men chuyển (ACE) (hoặc chẹn thụ thể angiotensin trong trường hợp không dung nạp các thuốc ức chế men chuyển), chẹn beta, thuốc lợi tiểu và với các glycoside trợ tim khi thích hợp. Trước khi điều trị với bisoprolol, bệnh nhân cần phải ổn định (không bị suy tim cấp).

Khuyến cáo bác sĩ điều trị cần phải có kinh nghiệm trong điều trị suy tim mạn tính.

Suy tim nặng hơn thoáng qua, hạ huyết áp, hoặc nhịp tim chậm có thể xảy ra trong giai đoạn chỉnh liều và sau đó.

Liều dùng

Giai đoạn chỉnh liều

Điều trị suy tim mạn tính ổn định với bisoprolol yêu cầu phải có giai đoạn chỉnh liều từ từ.

Điều trị với bisoprolol cần được bắt đầu với việc tăng liều từ từ theo liệu trình sau:

- 1,25 mg (1/2 viên Budex 2.5) một lần/ngày trong 1 tuần, nếu dung nạp tốt tăng lên
- 2,5 mg (1 viên Budex 2.5) một lần/ngày trong 1 tuần tiếp theo, nếu dung nạp tốt tăng lên
- 3,75 mg (1½ viên Budex 2.5) một lần/ngày trong 1 tuần tiếp theo, nếu dung nạp tốt tăng lên
- 5 mg (2 viên Budex 2.5) một lần/ngày trong 4 tuần tiếp theo, nếu dung nạp tốt, tăng lên
- 7,5 mg (3 viên Budex 2.5) một lần/ngày trong 4 tuần tiếp theo, nếu dung nạp tốt tăng lên
- 10 mg (4 viên Budex 2.5) một lần/ngày như liều duy trì

Liều khuyến cáo tối đa là 10 mg một lần mỗi ngày.

Cần theo dõi chặt chẽ dấu hiệu sống còn (nhịp tim, huyết áp) và các dấu hiệu suy tim nặng lên trong giai đoạn chỉnh liều. Triệu chứng có thể xảy ra trong ngày đầu tiên sau khi bắt đầu điều trị.

Điều chỉnh chế độ liều

Nếu bệnh nhân không dung nạp với liều khuyến cáo tối đa, có thể cân nhắc giảm liều từ từ.

Trong trường hợp xảy ra suy tim nặng hơn thoáng qua, hạ huyết áp, hay chậm nhịp tim, khuyến cáo nên xem xét lại liều của các thuốc đang sử dụng đồng thời. Giảm liều bisoprolol tạm thời hoặc xem xét ngưng điều trị bisoprolol khi cần thiết.

Nên luôn luôn cân nhắc bắt đầu sử dụng lại bisoprolol và/hoặc tăng liều bisoprolol khi bệnh nhân ổn định trở lại.

Nếu cần thiết phải ngưng điều trị, nên giảm liều từ từ vì ngưng điều trị đột ngột có thể làm xấu đi cấp tính tình trạng của bệnh nhân.

Điều trị bệnh tim mạn tính ổn định với bisoprolol thường là điều trị lâu dài.

Bệnh nhân suy thận hay suy gan

Không có thông tin về dược động học của bisoprolol ở bệnh nhân suy tim mạn kèm suy gan hay suy thận. Do đó, việc tăng liều cho các trường hợp này nên được tiến hành thận trọng hơn.

Người già

Không cần điều chỉnh liều.

Trẻ em

Chưa có kinh nghiệm đầy đủ về việc sử dụng bisoprolol cho trẻ em, vì thế không khuyến cáo sử dụng Budex 2.5 cho trẻ em.

Cách dùng

Budex 2.5 nên sử dụng vào buổi sáng, kèm hay không kèm thức ăn. Uống thuốc với nước, và không được nhai.

CHỐNG CHỈ ĐỊNH

Suy tim cấp hoặc các giai đoạn suy tim mất bù cần tiêm truyền tĩnh mạch các thuốc gây co cơ tim.

Sốc do tim.

Block nhĩ thất độ II hay độ III.

Hội chứng suy nút xoang.

Block xoang nhĩ.

Nhịp tim chậm có triệu chứng.

Huyết áp thấp có triệu chứng.

Hen phế quản nặng.

Thể nặng của bệnh tắc động mạch ngoại biên hay thể nặng của hội chứng Raynaud.

U tế bào ưa crôm chưa điều trị (xin xem mục *Cảnh báo và thận trọng khi dùng thuốc*).

Nhiễm toan chuyển hóa.

Mẫn cảm với bisoprolol hay bất cứ thành phần nào của thuốc.

CẢNH BÁO VÀ THẬN TRỌNG KHI DÙNG THUỐC

Điều trị suy tim mạn tính ổn định với bisoprolol phải được bắt đầu với giai đoạn chỉnh liều đặc biệt. Đặc biệt ở những bệnh nhân bị bệnh tim thiếu máu cục bộ, không được ngưng điều trị đột ngột trừ khi có chỉ định rõ ràng bởi việc ngưng đột ngột có thể làm tình trạng suy tim nặng hơn.

Cần theo dõi chặt chẽ bệnh nhân khi bắt đầu và khi ngưng điều trị với bisoprolol.

Không có kinh nghiệm điều trị bisoprolol trong điều trị suy tim có kèm các bệnh/tình trạng sau:

- Đái tháo đường phụ thuộc insulin (Tuýp I).
- Suy chức năng thận nặng.
- Suy chức năng gan nặng.
- Bệnh cơ tim hạn chế.
- Bệnh tim bẩm sinh.
- Bệnh van tim thực thể có liên quan tới huyết động.
- Nhồi máu cơ tim trong vòng 3 tháng.

Bisoprolol phải được sử dụng một cách thận trọng ở những bệnh nhân có kèm:

- Co thắt phế quản (hen phế quản, bệnh tắc nghẽn đường thở),
- Đái tháo đường có mức đường huyết thay đổi bất thường; các triệu chứng của chứng hạ đường huyết có thể bị che giấu,
- Nhịn ăn nghiêm ngặt,

- Đang điều trị dị ứng. Cũng như với các thuốc chẹn beta khác, bisoprolol có thể làm tăng tính nhạy cảm với các kháng nguyên và mức độ nghiêm trọng của các phản ứng phản vệ. điều trị với epinephrine không luôn mang đến hiệu quả điều trị mong muốn,
- Block nhĩ thất độ I,
- Chứng đau thắt ngực thể Prinzmetal; đã quan sát thấy một số trường hợp bị co thắt mạch vành. Mặc dù tính chọn lọc cao trên beta 1, nhưng không thể loại trừ hoàn toàn các cơn đau thắt ngực khi dùng bisoprolol ở những bệnh nhân có mắc kèm bệnh đau thắt ngực thể Prinzmetal,
- Bệnh tắc nghẽn động mạch ngoại biên. Các triệu chứng có thể diễn biến xấu hơn đặc biệt là khi bắt đầu điều trị,
- Gây mê toàn thân.

Ở những bệnh nhân gây mê toàn thân, thuốc chẹn β giúp giảm nguy cơ loạn nhịp tim và thiếu máu cục bộ cơ tim trong giai đoạn dẫn mê và đặt nội khí quản, và trong giai đoạn hậu phẫu. Hiện nay đang khuyến cáo nên duy trì thuốc chẹn β trong giai đoạn chu phẫu. Bác sĩ gây mê phải được thông báo trong trường hợp bệnh nhân đang được điều trị với chẹn β do nguy cơ tương tác với các thuốc khác, làm chậm nhịp tim, làm giảm phản xạ tăng nhịp tim và giảm khả năng phản xạ để bù lại sự mất máu. Nếu cần thiết phải ngưng sử dụng thuốc chẹn β trước khi phẫu thuật, nên giảm liều dần dần và kết thúc 48 h trước khi gây mê.

Thường không khuyến cáo sử dụng phối hợp bisoprolol và các thuốc đối kháng canxi loại verapamil hoặc diltiazem, các thuốc chống loạn nhịp tim nhóm I, và các thuốc hạ huyết áp tác dụng lên trung ương (xin xem mục *Tương tác của thuốc với các thuốc khác và các loại tương tác khác*)

Mặc dù các thuốc chẹn beta chọn lọc trên tim (beta 1) có thể có ít tác động lên chức năng phổi hơn các thuốc chẹn beta không chọn lọc, cũng như với tất cả các chất chẹn beta, nên tránh sử dụng những thuốc này ở các bệnh nhân bị bệnh tắc nghẽn đường thở, trừ khi có các lý do lâm sàng bắt buộc cần sử dụng. Trong những trường hợp bắt buộc, bisoprolol có thể được sử dụng một cách thận trọng. Ở những bệnh nhân bị tắc nghẽn đường thở, điều trị với bisoprolol nên được bắt đầu ở liều thấp nhất và cần giám sát chặt chẽ bệnh nhân về các triệu chứng mới, như khó thở, không dung nạp các bài tập và ho. Các trường hợp hen phế quản hay các rối loạn chức năng phổi tắc nghẽn mạn tính khác có thể gây ra triệu chứng, điều trị giãn phế quản nên được dùng đồng thời. Tình huống có thể xảy ra sự gia tăng đề kháng đường thở ở những bệnh nhân hen suyễn, vì thế, có thể phải tăng liều kích thích beta 2.

Bệnh nhân bị bệnh vảy nến hay tiền sử bị bệnh vảy nến chỉ nên sử dụng chẹn beta (ví dụ bisoprolol) sau khi đã cân nhắc cẩn thận giữa lợi ích và nguy cơ.

Ở bệnh nhân u tuyến thượng thận (u tế bào ưa crôm), không nên sử dụng bisoprolol cho đến sau khi phong tỏa thụ thể α .

Khi điều trị với bisoprolol các triệu chứng của nhiễm độc tuyến giáp có thể bị che giấu.

Sử dụng bisoprolol có thể gây ra kết quả dương tính trong thử doping. Sử dụng bisoprolol làm chất doping có thể gây hại cho sức khỏe người sử dụng.

Cảnh báo tá dược

Bệnh nhân bị rối loạn di truyền hiếm gặp như không dung nạp galactose, thiếu hụt lactase hoàn toàn hoặc kém hấp thu glucose- galactose không nên dùng thuốc này.

Thuốc này có chứa dưới 1 mmol (23 mg) natri trong mỗi đơn vị phân liều, về cơ bản được xem như “không chứa natri”.

SỬ DỤNG THUỐC CHO PHỤ NỮ CÓ THAI VÀ CHO CON BÚ

Phụ nữ có thai

Bisoprolol có tác dụng dược lý có thể gây tác dụng có hại lên phụ nữ có thai và/hoặc bào thai/ trẻ sơ sinh. Nói chung, chẹn beta làm giảm tưới máu nhau thai, điều này có thể liên quan tới sự chậm phát triển của bào thai trong tử cung, thai chết lưu, sẩy thai tự phát hoặc chuyển dạ sớm. Các tác dụng phụ (như hạ đường huyết và chậm nhịp tim) có thể xảy ra ở thai nhi và trẻ sơ sinh. Nếu việc điều trị chẹn beta là cần thiết, chọn giao cảm chọn lọc trên beta 1 là thích hợp hơn.

Bisoprolol không được khuyến cáo sử dụng khi mang thai trừ khi thực sự cần thiết. Nếu điều trị với bisoprolol được coi là cần thiết, cần theo dõi chặt chẽ lưu lượng máu nhau thai, tử cung và sự phát

triển của bào thai. Trường hợp xảy ra tác hại cho mẹ hoặc thai nhi, khuyến cáo cân nhắc thay đổi phương pháp điều trị. Trẻ sơ sinh cần được theo dõi kỹ ngay sau khi sinh. Các triệu chứng của giảm đường huyết và chậm nhịp tim thường xảy ra trong vòng 3 ngày đầu tiên.

Phụ nữ cho con bú

Chưa được biết bisoprolol có bài tiết vào sữa mẹ hay không. Vì thế, không cho con bú khi đang dùng bisoprolol.

ẢNH HƯỞNG CỦA THUỐC LÊN KHẢ NĂNG LÁI XE, VẬN HÀNH MÁY MÓC

Một nghiên cứu trên bệnh nhân bị bệnh mạch vành cho thấy bisoprolol không ảnh hưởng đến khả năng lái xe của bệnh nhân. Tuy nhiên, do phản ứng có thể xảy ra khác nhau ở mỗi cá thể nên khả năng lái xe và vận hành máy móc có thể bị ảnh hưởng. Cần lưu ý đến khả năng này khi bắt đầu điều trị, khi thay đổi liều cũng như khi có uống rượu.

TƯƠNG TÁC, TƯƠNG Kỵ CỦA THUỐC

Tương tác của thuốc

Kết hợp không nên dùng

Các chất đối kháng canxi kiểu verapamil và tới một mức thấp hơn của loại diltiazem: Có thể làm giảm tính co thắt cơ tim và làm chậm dẫn truyền xung lực nhĩ thất khi dùng chung với bisoprolol. Tiêm tĩnh mạch verapamil cho bệnh nhân đang điều trị với thuốc chẹn β có thể gây ra hạ huyết áp mạnh và block nhĩ thất.

Các thuốc chống loạn nhịp tim nhóm I (như quinidine, disopyramide, lidocaine, phenytoin; flecainide, propafenone): Có thể làm tăng tác dụng ức chế lên dẫn truyền xung lực nhĩ thất và tăng hiệu quả giảm co thắt tim.

Các thuốc hạ huyết áp có tác dụng trung ương như clonidine và các thuốc khác (như methyldopa, moxonidine, rilmenidine): Sử dụng đồng thời với các thuốc hạ huyết áp có tác dụng trung ương có thể làm nặng thêm suy tim do giảm trương lực giao cảm trung ương (giảm nhịp tim và cung lượng tim, giãn mạch). Ngưng dùng thuốc đột ngột, đặc biệt là trước khi ngưng sử dụng thuốc chẹn β có thể làm tăng nguy cơ “tăng huyết áp hồi ứng”.

Kết hợp phải thận trọng

Các chất đối kháng canxi kiểu dihydropyridine như felodipine và amlodipine: Sử dụng đồng thời có thể làm tăng nguy cơ hạ huyết áp và không loại trừ gia tăng nguy cơ làm suy giảm thêm chức năng bơm tâm thất ở bệnh nhân suy tim.

Các thuốc chống loạn nhịp tim nhóm III (như amiodarone): Có thể làm tăng tác dụng ức chế của bisoprolol trên dẫn truyền xung lực nhĩ thất.

Các thuốc chẹn β tại chỗ (như thuốc nhỏ mắt điều trị glaucoma) có thể làm tăng tác dụng toàn thân của bisoprolol.

Các thuốc cường phó giao cảm có thể làm tăng tác dụng ức chế lên dẫn truyền xung lực nhĩ thất và nguy cơ chậm nhịp tim khi dùng chung với bisoprolol.

Insulin và các thuốc đái tháo đường dùng đường uống: Có thể làm gia tăng tác dụng hạ đường huyết. Thuốc chẹn beta có thể che giấu triệu chứng của tình trạng hạ đường huyết.

Các thuốc gây mê: Làm suy giảm nhịp nhanh do phản xạ và tăng nguy cơ hạ huyết áp (xin xem phần *Cảnh báo và thận trọng khi dùng thuốc*).

Các glycoside tim (digitalis): Làm giảm nhịp tim, làm tăng thời gian dẫn truyền xung động.

Các thuốc kháng viêm không steroid (NSAIDs) có thể làm giảm tác dụng hạ huyết áp của bisoprolol.

Các chất cường giao cảm β (như isoprenaline, dobutamine) sử dụng chung với bisoprolol có thể làm giảm tác dụng của cả hai.

Chất cường giao cảm hoạt hóa cả thụ thể β và α (như noradrenaline, adrenaline) kết hợp với bisoprolol có thể làm bộc lộ tác dụng co mạch gián tiếp qua thụ thể α của các thuốc này làm tăng huyết áp và trầm trọng hơn chứng khập khiễng cách hồi. Các tương tác này thường xảy ra với các chẹn β không chọn lọc.

Sử dụng đồng thời các thuốc trị cao huyết áp cũng như các thuốc khác có khả năng làm hạ huyết áp (như thuốc chống trầm cảm ba vòng, barbiturate, phenothiazine) có thể làm tăng nguy cơ hạ huyết áp.

Kết hợp cần cân nhắc

Mefloquine: Làm tăng nguy cơ chậm nhịp tim.

Thuốc ức chế Monoamine oxidase (ngoại trừ thuốc ức chế MAO-B): Làm tăng tác dụng hạ huyết áp của các thuốc chẹn β , nhưng cũng có nguy cơ tăng huyết áp đột ngột.

Tương kỵ của thuốc

Do không có các nghiên cứu về tính tương kỵ của thuốc, không trộn lẫn thuốc này với các thuốc khác.

TÁC DỤNG KHÔNG MONG MUỐN CỦA THUỐC

Những định nghĩa sau được áp dụng cho thuật ngữ tần suất được sử dụng bên dưới: Rất thường gặp ($\geq 1/10$), thường gặp ($\geq 1/100$ tới $< 1/10$), ít gặp ($\geq 1/1.000$ tới $< 1/100$), hiếm gặp ($\geq 1/10.000$ tới $< 1/1.000$), rất hiếm gặp ($< 1/10.000$), tần suất chưa được biết (không thể ước tính được từ những dữ liệu hiện có).

Các xét nghiệm

Hiếm gặp: Tăng triglycerides, tăng men gan (ALAT, ASAT).

Các rối loạn tim

Rất thường gặp: Chậm nhịp tim.

Thường gặp: Tăng suy tim.

Ít gặp: Rối loạn dẫn truyền nhĩ thất.

Các rối loạn ở hệ thần kinh

Thường gặp: Chóng mặt, nhức đầu.

Hiếm gặp: Ngất.

Các rối loạn về mắt

Hiếm gặp: Giảm nước mắt (cần lưu ý nếu bệnh nhân dùng kính sát tròng).

Rất hiếm gặp: Viêm kết mạc.

Các rối loạn về tai và tai trong

Hiếm gặp: Rối loạn thính giác.

Các rối loạn về hô hấp, ngực và trung thất

Ít gặp: Co thắt phế quản ở bệnh nhân hen phế quản hay có tiền sử tắc nghẽn khí quản.

Hiếm gặp: Viêm mũi dị ứng.

Các rối loạn về tiêu hóa

Thường gặp: Các rối loạn về tiêu hóa như buồn nôn, nôn, tiêu chảy, táo bón.

Các rối loạn về da và mô dưới da

Hiếm gặp: Các phản ứng mẫn cảm như ngứa, đỏ da, phát ban và phù mạch.

Rất hiếm gặp: Rụng tóc. Các thuốc chẹn β có thể gây ra hay làm nặng thêm bệnh vẩy nến hoặc ban đỏ như vẩy nến.

Các rối loạn về cơ xương và mô liên kết

Ít gặp: Yếu cơ, vọp bẻ.

Các rối loạn về mạch

Thường gặp: Cảm thấy lạnh hay tê cóng tay chân, hạ huyết áp.

Ít gặp: Hạ huyết áp thể đứng.

Các rối loạn khác

Thường gặp: Hen suyễn, mệt mỏi.

Các rối loạn gan mật

Hiếm gặp: Viêm gan.

Các rối loạn về hệ sinh sản và ngực

Hiếm gặp: Rối loạn cương dương.

Các rối loạn tâm thần

Ít gặp: Trầm cảm, rối loạn giấc ngủ.

Hiếm gặp: Ác mộng, ảo giác.

CA
No.
240
★

Thông báo ngay cho bác sĩ hoặc dược sĩ khi gặp các tác dụng không mong muốn như trên khi sử dụng thuốc hoặc báo cáo các phản ứng có hại của thuốc về Trung tâm Thông tin thuốc và Theo dõi phản ứng có hại của thuốc (ADR) Quốc Gia. Địa chỉ: 13 - 15 Lê Thánh Tông - Hoàn Kiếm - Hà Nội. Điện thoại: 024.3.9335.618; Fax: 024.3.9335642; Email: di.pvcenter@gmail.com.

QUÁ LIỀU VÀ CÁCH XỬ TRÍ

Triệu chứng

Quá liều (ví dụ dùng 15 mg hàng ngày thay vì dùng 7,5 mg), chẹn nhĩ thất độ 3, chậm nhịp tim và chóng mặt đã được báo cáo. Nói chung các dấu hiệu thường gặp nhất khi quá liều chẹn beta bao gồm chậm nhịp tim, tụt huyết áp, suy tim cấp, co thắt phế quản, suy tim cấp và hạ đường huyết.

Cho đến nay, chỉ có một ít trường hợp quá liều với bisoprolol (nhiều nhất là: 2000 mg) đã được báo cáo ở những bệnh nhân bị tăng huyết áp và/hoặc bệnh mạch vành. Những bệnh nhân này được báo cáo chậm nhịp tim và/hoặc hạ huyết áp; tất cả các bệnh nhân đều hồi phục. Có một sự khác biệt lớn giữa các cá thể về mức độ nhạy cảm với liều đơn cao bisoprolol và những bệnh nhân bị suy tim dường như có sự nhạy cảm đặc biệt. Vì vậy, việc tăng liều chậm theo liệu trình tăng liều ở những bệnh nhân suy tim là thực sự cần thiết (xem mục *Cách dùng, liều dùng*).

Cách xử trí

Nếu quá liều cần ngưng điều trị bisoprolol và tiến hành điều trị hỗ trợ và điều trị triệu chứng. Các số liệu hạn chế cho thấy bisoprolol khó bị thẩm phân. Dựa trên các tác dụng dược lý dự đoán và các khuyến cáo đối với các chẹn beta khác, những biện pháp sau nên được cân nhắc khi được đảm bảo về mặt lâm sàng:

Chậm nhịp tim: Dùng atropine tiêm tĩnh mạch. Nếu đáp ứng không đầy đủ, có thể dùng isoprenaline hoặc các thuốc làm tăng nhịp tim khác một cách thận trọng. Trong một số trường hợp, có thể cần đặt máy tạo nhịp tạm thời.

Hạ huyết áp: Nên truyền dịch tĩnh mạch và dùng các chất làm co mạch. Glucagon tiêm tĩnh mạch cũng có thể giúp ích.

Block nhĩ thất (độ 2 hoặc độ 3): Bệnh nhân nên được giám sát cẩn thận và điều trị với truyền isoprenaline hoặc đặt máy tạo nhịp qua đường tĩnh mạch.

Suy tim diễn biến cấp tính: Dùng lợi tiểu đường tiêm tĩnh mạch, các thuốc làm tăng co bóp cơ tim và các thuốc giãn mạch.

Co thắt phế quản: Dùng các thuốc làm giãn phế quản như isoprenaline, các thuốc có hoạt tính giống giao cảm beta 2 và/hoặc aminophylline.

Hạ đường huyết: Dùng glucose tiêm tĩnh mạch.

ĐẶC TÍNH DƯỢC LỰC HỌC

Nhóm dược lý: Thuốc chẹn thụ thể beta, chọn lọc.

Mã ATC: C07AB07.

Cơ chế tác dụng

Bisoprolol là thuốc chẹn thụ thể β_1 giao cảm chọn lọc cao, không có tính ổn định màng và hoạt tính giống giao cảm nội tại. Bisoprolol cho thấy ít có tác dụng trên thụ thể β_2 của cơ trơn phế quản và mạch máu cũng như lên ảnh hưởng trên chuyển hóa liên quan đến thụ thể β_2 . Do đó, bisoprolol nhìn chung không ảnh hưởng lên trở kháng đường thở và các tác dụng lên chuyển hóa qua trung gian thụ thể β_2 . Đặc tính chọn lọc trên beta 1 của thuốc vẫn tồn tại với liều vượt khỏi khoảng liều điều trị.

ĐẶC TÍNH DƯỢC ĐỘNG HỌC

Hấp thu

Bisoprolol được hấp thu từ ống tiêu hóa và có sinh khả dụng khoảng 90% sau khi uống.

Phân bố

Thể tích phân bố là 3,5 l/kg. Khoảng 30% gắn với protein huyết tương.

Chuyển hóa và thải trừ

Bisoprolol được thải trừ theo 2 đường. 50% được chuyển hóa ở gan thành chất chuyển hóa không có hoạt tính và sau đó được bài tiết ra ngoài qua thận. 50% còn lại được bài tiết qua thận ở dạng

không được chuyển hóa. Độ thanh thải toàn phần của bisoprolol khoảng 15 l/h. Thời gian bán thải khỏi huyết tương khoảng 10-12 giờ tại ra hiệu quả 24 giờ sau khi uống 1 lần 1 ngày.

Độ tuyến tính

Động học của bisoprolol là tuyến tính và không phụ thuộc vào độ tuổi.

Nhóm bệnh nhân đặc biệt

Do sự thải trừ của thuốc cân bằng ở thận và gan nên không yêu cầu điều chỉnh liều cho bệnh nhân bị suy chức năng thận hoặc gan. Không có thông tin liên quan tới dược động học của bisoprolol ở những bệnh nhân có suy tim mạn tính và suy gan hay suy thận đi kèm. Nồng độ bisoprolol huyết tương tăng và thời gian bán thải kéo dài ở những bệnh nhân bị suy tim mạn tính (NYHA độ III) so với những người tình nguyện khỏe mạnh. Ở trạng thái ổn định, nồng độ huyết tương tối đa khi dùng bisoprolol với liều 10 mg 1 lần 1 ngày là 64 ± 21 ng/ml và thời gian bán thải là 17 ± 5 giờ.

QUY CÁCH ĐÓNG GÓI

Hộp 3 vỉ x 10 viên.

ĐIỀU KIỆN BẢO QUẢN, HẠN DÙNG, TIÊU CHUẨN CHẤT LƯỢNG

Điều kiện bảo quản: Bảo quản ở nơi khô mát, dưới 30°C. Tránh ánh sáng và ẩm.

Hạn dùng: 24 tháng kể từ ngày sản xuất.

Tiêu chuẩn chất lượng: USP.

TÊN VÀ ĐỊA CHỈ CƠ SỞ SẢN XUẤT THUỐC

NAVANA PHARMACEUTICALS LTD.

Rupshi, Rupganj, Narayanganj, Bangladesh



Tiếp thị bởi,

Nhãn hiệu thuộc sở hữu của:

EURO HEALTHCARE PTE. LTD. Singapore

OTC / A