كونكور® 5 ملغ / كونكور® 10 ملغ

المادة الفعالة: بيسوبرولول هيميفومارات

1. اسم المنتج الدوائي

أقراص كونكور المغلفة 5 ملغ
أقراص كونكور المغلفة 10 ملغ

2. التركيب الكمي والنوعي

كونكور 5 ملغ: يحتوي كل قرص على 5 ملغ من المادة الفعالة البيسوبرولول فومارات.
كونكور 10 ملغ: يحتوي كل قرص على 10 ملغ من المادة الفعالة البيسوبرولول فومارات.
للاطلاع على قائمة السواغ الكاملة، يُرجى الرجوع إلى قسم 6.1

3. التركيبة الصيدلانية

أقراص مغلفة
المظهر المرئي:
كونكور 5 ملغ: أقراص ذات لون أبيض مصفر على شكل قلب، ومغلفة بطبقة رقيقة، وموسومة على الجانبين.
كونكور 10 ملغ: أقراص ذات لون برتقالي فاتح، على شكل قلب، ومغلفة بطبقة رقيقة، وموسومة على الجانبين.

4. الخصائص السريرية

4.1 دواعي الاستخدام العلاجية
- ارتفاع ضغط الدم (فرط ضغط الدم)
- مرض القلب الإكليلي (كعلاج أساسي للذبحة الصدرية وليس للأزمة الصدرية)
- مرض قصور القلب المزمن المستقرمع انخفاض وظيفة انقباض البطين الأيسر بالإضافة إلى مثبطات إنزيم تحويل الأنجيوتنسين ACE ومدرات البول وغليكوسيدات قلبية اختيارية (للاطلاع على مزيد من المعلومات، يُرجى الرجوع إلى القسم 4.2، و4.4، و5.1).

4.2 معايرة الجرعات وطريقة تناولها

معايرة الجرعات

علاج فرط ضغط الدم أو مرض القلب الاكليلي (الذبحة الصدرية)
البالغون: الجرعة في حالتي الاستعمال هي 5 ملغ من المادة الفعالة بيسوبرولول فومارات بمعدل مرة واحدة يوميًا.
ويمكن عند الضرورة زيادة الجرعة إلى 10 ملغ من المادة الفعالة بيسوبرولول فومارات بمعدل مرة واحدة يوميًا.
أما الجرعة القصوى الموصى بها فهي 20 ملغ مرة واحدة يوميًا.
وتُحدد الجرعة في جميع الحالات بشكل فردي، وخاصة وفقًا لمعدل ضربات القلب ونجاح العلاج.

علاج قصور القلب المزمن المستقر
يتكون العلاج القياسي لمرض قصور القلب المزمن من مثبط للانزيم المحول للأنجيوتنسين ACE (أو إحدى مضادات مستقبلات الأنجيوتنسين في حالة عدم تحمل المريض لمثبطات الإنزيم المحول للأنجوتنسين) وحاصرة بيتا ومدرات لليول، بالإضافة إلى غليكوسيدات قلبية عند الحاجة.
يجب أن تكون حالة المرضى مستقرة عند بدء العلاج بدواء بيسوبرولول (دون وجود قصور حاد).
ويوصى بأن يكون الطبيب المعالج متمرسًا في إدارة حالات قصور القلب المزمن.
وقد يحدث تفاقم عابر لقصور القلب أو انخفاض في ضغط الدم أو تباطؤ في القلب خلال فترة المعايرة وبعدها.

فترة المعايرة
يتطلب إجراء علاج مرض قصور القلب المزمن المستقر بالبيسوبرولول مرحلة معايرة. فتبدأ المعالجة بدواء بيسوبرولول بمعايرة تصاعدية تدريجية وفقًا للخطوات التالية:
- 1.25 ملغ مرة واحدة يوميًا لأسبوع واحد، وإذا تحمل المريض الجرعة بشكل جيد تُزاد الجرعة إلى
- 2.5 ملغ بمعدل مرة واحدة يوميًا خلال أسبوع إضافي، وإذا تحمل المريض الجرعة بشكل جيد تُزاد الجرعة إلى
- 3.75 ملغ بمعدل مرة واحدة يوميًا خلال أسبوع إضافي، وإذا تحمل المريض الجرعة بشكل جيد تُزاد الجرعة إلى
- 5 ملغ بمعدل مرة واحدة يوميًا خلال 4 أسابيع تالية، وإذا تحمل المريض الجرعة بشكل جيد تُزاد الجرعة إلى
- 7.5 ملغ بمعدل مرة واحدة يوميًا خلال 4 أسابيع تالية، وإذا تحمل المريض الجرعة بشكل جيد تُزاد الجرعة إلى
- 10 ملغ بمعدل مرة واحدة يوميًا لعلاج المداومة.

أما الجرعة القصوى الموصى بها فهي 10 ملغ مرة واحدة يوميًا.
يُوصى خلال فترة المعايرة بملاحظة العلامات الحيوية (معدل ضربات القلب وضغط الدم) وأعراض تفاقم قصور القلب عن كثب. وقد تظهر الأعراض بالفعل في اليوم الأول بعد بداية مرحلة العلاج.

التعديلات العلاجية
في حالة عدم تحمل المريض للجرعة القصوى الموصى بها بشكل جيد، فيُفضل التقليل التدريجي للجرعة.
وفي حالة حدوث تفاقم عابر لقصور القلب أو انخفاض في ضغط الدم أو تباطؤ في نبض القلب، فمن الموصى به في هذه الحالة إعادة النظر في جرعة العلاج المرافق. وقد يكون من الضروري كذلك التقليل بشكل مؤقت من جرعة البيسوبرولول أو دراسة عدم الاستمرار في تناول الدواء.
وينبغي أن يوضع في الاعتبار دائمًا إعادة بداية العلاج و/أو المعايرة التصاعدية للبيسوبرولول، وذلك عند استقرار حالة المريض مرة ثانية.
وينصح عند وضع توقف العلاج في عين الاعتبار بتقليل الجرعة تدريجيًا نظرًا لاحتمالية حدوث تدهور حاد في حالة المرضى نتيجة السحب المفاجئ.

مدة العلاج
يكون العلاج بدواء بيسوبرولول بشكل عام على المدى البعيد.
يُمنع منعًا باتًا وقف العلاج بالبيسوبرولول بشكل مفاجئ لأن ذلك قد يؤدي إلى تفاقم عابر في حالة المريض.
ويُمنع قطع العلاج بشكل مفاجئ خاصة مع المرضى المصابين بمرض القلب الإقفاري. ويوصي بتقليل الجرعة تدريجيًا.

الضعف الكلوي أو الكبدي
فرط ضغط الدم أو الذبحة الصدرية
لا يتطلب الأمر في المعتاد تعديل الجرعة للمرضى الذين يعانون من اضطرابات في وظائف الكبد والكلى من الدرجة البسيطة أو المتوسطة،أما بالنسبة لمرضى الضعف الكلوي الحاد (التخلص من الكرياتينين أقل من 20 ملي لتر/دقيقة) ومرضى الضعف الكبدي الحاد، فيوصى بعدم تجاوز الجرعة اليومية مقدار 10 ملغم من البيسوبرولول هيميفومارات.
وتجربة استخدام دواء بيسوبرولول في حالات مرضى الغسيل الكلوي محدودة، غير أنه لا يوجد أي دليل على ضرورة تعديل نظام الجرعة.

علاج قصور القلب المزمن المستقر
لا توجد أي معلومات بشأن حرائك البيسوبرولول لدى المرضى الذين يعانون من قصور مزمن في القلب أو الضعف الكبدي أو الكلوي المرافق،ولذلك يتعين إجراء في المعايرة لدى هذه المجموعات بمزيد من الحذر.

كبار السن
لا تستدعي الحاجة تعديل الجرعة.

الأطفال
نظرا لعدم توفر تجربة كافية باستخدام البيسوبرولول مع الأطفال، فإنه لا يوصى باستعماله معهم.

طريقة تناول الدواء
ينبغي تناول أقراص البيسوبرولول في الصباح مع طعام أو بدونه،ولا ينبغي مضغ الأقراص بل يجب ابتلاعها مع قليل من السوائل.

4.3 موانع الاستعمال
يمنع استعمال البيسوبرولول لدى المرضى الذين يعانون من
- قصور حاد في القلب أو أثناء نوبات الأزمات القلبية اللامعاوضة التي تتطلب علاجًا وريديًا بمواد تزيد من قابلية القلب للتقلص.
- الصدمات القلبية.
- اضطرابات حادة في التوصيل الأذيني البطيني من الدرجة الثانية أو الثالثة (دون منظم لضربات القلب).
- متلازمة العقدة الجيبية.
- حصر جيبي أذيني.
- بطء القلب العرضي.
- نقص الضغط العرضي.
- مرض الربو القصبي الحاد.
- المراحل المتأخرة من مرض انسداد الشريان المحيطي أو متلازمة ريناود.
- ورم في القوائم لم تتم معالجته (انظر القسم 4.4).
- زيادة إفراز الحامض الأيضي.
- حساسية مفرطة من البيسوبرولول أو من أي من مواد السواغ المذكورة في القسم 6.1.

4.4 تحذيرات وتنبيهات خاصة بشأن الاستعمال
يجب أن يبدأ علاج قصور القلب المزمن المستقر بدواء بيسوبرولول بمرحلة معايرة خاصة (انظر القسم 4.2)
يجب الا يتوقف العلاج بدواء بيسوبرولول بشكل مفاجئ لاسيما في حالة المرضى المصابين بمرض القلب الإقفاري إلا في حال وجود داع واضح لذلك لأن التوقف المفاجئ قد يؤدي إلى تفاقم عابر في حالة القلب. (انظر القسم 4.2).
يجب استخدام البيسوبرولول بحذر مع المرضى الذين يعانون من ارتفاع ضغط الدم أو الذبحة الصدرية وقصور القلب المصاحب لذلك.

يتطلب بدء وإيقاف العلاج باستخدام البيسوبرولول في الحالات التي تعاني من قصور القلب المزمن مراقبة منتظمة. انظر القسم 4.2 لمعرفة كيفية تحديد الجرعات وطريقة تناولها.
لا توجد تجربة علاجية لاستخدام البيسوبرولول في علاج قصور القلب لدى المرضى الذين يعانون من الأمراض والحالات التالية:
- داء السكري المعتمد على الأنسولين (النوع الأول)
- ضعف حاد في وظائف الكلى
- ضعف حاد في وظائف الكبد
- اعتلال قلبي عضلي تقيدي
- مرض قلبي خلقي
- مرض صمامي عضوي ملحوظ له علاقة بديناميكية الدورة الدموية
- احتشاء عضلة القلب خلال 3 أشهر

يجب توخي الحذر الشديد عند استخدام البيسوبرولول في الحالات التالية:
- داء السكري المصحوب بتقلبات كبيرة في نسبة جلوكوز الدم. قد لا تتضح أعراض انخفاض نسبة السكر في الدم (مثل، اضطرابات نظم دقات القلب أو الخفقان أو التعرّق).
- الصوم الصارم.
- المعالجة المتواصلة لإزالة التحسس. كما هو الحال مع حاصرات بيتا الأخرى، قد يزيد البيسوبرولول من الحساسية تجاه المواد المسببة للحساسية ومن حدة التفاعلات اللاوقائية. قد لا يُحدث العلاج بالإبينفرين دومًا التأثير العلاجي المتوقع.
- إحصار أذيني بطيني من الدرجة الأولى.
- ذبحة برنزميتال.
- مرض الانسداد الشرياني المحيطي. قد تحدث شكاوى متزايدة وخاصة عند بدء العلاج.

يجب ألا يتناول المرضى المصابون عالميًا أو في السابق بداء الصدف حاصرات بيتا (مثل، دواء بيسوبرولول) إلا بعد موازنة دقيقة بين الفوائد والمخاطر.
قد لا تتضح أعراض التسمم الدرقي أثناء العلاج بالبيسوبرولول.
يجب على المرضى الذين يعانون من ورم الفوائم عدم تناول البيسوبرولول إلا بعد حصار مستقبلات ألفا.
يقلل حاصر بيتا في المرضى الذين يخضعون للتخدير العام من حدوث اضطراب النظم في القلب ونقص تروية عضلة القلب خلال الاستقراء والتنبيب وفترة ما بعد الجراحة. ويوصى حاليًا بالاستمرار على إقامة حاصر بيتا في الفترة المحيطة بالجراحة. يجب أن يكون اختصاصي التخدير على علم بحاصر البيتا نظرًا لإمكانية حدوث تفاعلات مع أدوية أخرى، مما يؤدي إلى اضطراب النظم البطينة، وضعف في تسرع القلب الانعكاسي، وانخفاض القدرة الانعكاسية للتعويض عن فقدان الدم. وإذا رأى الطبيب أنه من اللازم الانقطاع عن العلاج بحاصر بيتا قبل التدخل الجراحي، فإنه يتعين القيام بذلك بشكل تدريجي والانتهاء منه قبل 48 ساعة من التخدير تقريبًا.
وعلى الرغم من أن حاصرات بيتا (من النوع الأول) المنتقاة للقلب قد تكون أقل تأثيراً على وظيفة الرئة من حاصرات بيتا غير الانتقائية، كما هو الحال مع جميع حاصرات بيتا، ولكن هذه الحاصرات ينبغي تجنب استعمالها في المرضى الذين يعانون من أمراض انسداد الشعب الهوائية، ما لم تكن هناك أسبابًا سريرية اضطرارية لاستخدامها. وحيثما وُجدت هذه الأسباب، فيتعين استخدام كونوكور بحذر شديد.
في حالات الربو القصبي أو غيرها من أمراض انسداد الشعب الهوائية المزمنة، والتي قد ينتج عندها حدوث أعراض، فمن المستحسن أن يصاحب ذلك علاج قصبي. قد تحدث في بعض الأحيان زيادة في مقاومة مجرى الهواء لدى المرضى الذين يعانون من الربو، وبالتالي فقد تستدعي الحاجة زيادة جرعة منشطات بيتا من النوع الثاني.

4.5 التفاعل مع منتجات طبية أخرى وغير ذلك من أشكال التفاعل

التوليفات غير الموصى بها
تنطبق فقط على القصور القلبي المزمن:
الأدوية المضادة لاضطراب النظم من الدرجة الأولى (على سبيل المثال الكينيديين، الديسوبيرامايد؛ الليدوكايين، الفينيتوين؛ الفليكاينيد، البروبافينون): قد تزيد احتمالية التأثير على وقت التوصيل الأذيني البطيني، وقد تزيد من التأثير السلبي على التقلص العضلي.
ينطبق على جميع دواعي الاستعمال:
مضادات الكالسيوم من نوع الفيراباميل وإلى درجة أقل من نوع الديلتيازيم: تأثير سلبي على القلوصية والتوصيل الأذيني البطيني، قد يؤدي الحقن الوريدي بمادة الفيراباميل للمرضى المعالجين بحاصرات بيتا إلى انخفاض بالغ في ضغط الدم وانسداد أذيني بطيني.
الأدوية التي تعمل بشكل مركزي على تخفيف ضغط الدم (مثل مثيلدوبا وموكسونيدين وريزيربين وريلمينيدين): قد يؤدي الاستعمال المتزامن للأدوية التي تعمل بشكل مركزي على تخفيف ضغط الدم إلى تفاقم قصور القلب من خلال خفض ضغط الدم في التوترية السيمبتاوية المركزية (انخفاض معدل ضربات القلب والنتاج القلبي، وتوسع الأوعية الدموية). وقد يزيد الانقطاع المفاجئ عن تناول الدواء - وخاصةً قبل التوقع عن استخدام حاصرات بيتا - من خطورة "ارتداد فرط ضغط الدم".

تركيبات يتعين توخي الحذر أثناء استعمالها
تنطبق فقط على فرط ضغط الدم او الذبحة الصدرية:
الأدوية المضادة لاضطراب النظم من الدرجة الأولى (على سبيل المثال الكينيديين، الديسوبيرامايد؛ الليدوكايين، الفينيتوين، الفليكاينيد، البروبافينون): قد تزيد احتمالية التأثير على وقت التوصيل الأذيني البطيني، وقد تزيد من التأثير السلبي على التقلص العضلي.
ينطبق على جميع دواعي الاستعمال:
مضادات الكالسيوم من نوع الديهيدروبيريدين (مثل نيفيديبين): قد يؤدي الاستعمال المتزامن إلى زيادة خطورة الإصابة بفرط ضغط الدم، ولا يمكن استبعاد ازدياد خطر تردي عمل المضخة البطينية لدى مرضى القصور القلبي.
الأدوية المضادة للنظم من الدرجة الثالثة (مثل أميودارون): قد تزيد احتمالية التأثير على وقت التوصيل الأذيني البطيني.
أدوية محاكية اللاودية: قد يؤدي الاستعمال المتزامن إلى زيادة وقت التوصيل الأذيني البطيني وزيادة خطر التعرض لبطء نبض القلب.
قد تسهم حاصرات بيتا الموضعية (مثل قطرات العين المستخدمة في علاج الغلوكوما) في زيادة تأثيرات بيسوبرولول النظامية.
الأنسولين والأدوية الفموية المضادة للسكري: زيادة المفعول المخفض لنسبة السكر في الدم. قد يخفي حاصر مستقبلات بيتا الأدرينالينية أعراض نقص السكر في الدم.
مواد التخدير: توهين تسرع القلب الانعكاسي وزيادة خطر الإصابة بفرط ضغط الدم (لمزيد من المعلومات حول التخدير العام، راجع القسم 4.4).
جليكوزيدات الديجيتاليس: زيادة وقت التوصيل الأذيني البطيني، مما يؤدي إلى انخفاض نبضات القلب.
الأدوية غير الستيرودية المضادة للالتهابات: قد تؤدي الأدوية غير الستيرودية المضادة للالتهابات إلى الحد من مفعول البيسوبرولول المخفض لضغط الدم.
المحاكيات الودية من النوع بيتا (مثل إيزوبرينالين ودوبوتامين): قد يؤدي الجمع مع البيسوبرولول إلى الحد من مفعول كلا الدواءين.
المحاكيات الودية التي تنشط مستقبلات الأدرينالين من كلا النمطين ألفا وبيتا (مثل نورأدرينالين وأدرينالين): قد يؤدي الجمع مع البيسوبرولول إلى وضوح تأثيرات تضييق الأوعية الذي تيسر حدوثه المستقبلات الأدرينالينية من النمط ألفا، مما يؤدي إلى رفع ضغط الدم وتفاقم العرج المتقطع. وتُعتبر احتمالية وقوع هذه التفاعلات أكبر عند العلاج بحاصرات بيتا غير الانتقائية.
قد يؤدي تزامن الاستعمال مع أدوية تخفيض ضغط الدم إلى جانب الأدوية الأخرى التي لها تأثيرات محتملة في خفض ضغط الدم (مثل مضادات الاكتئاب ثلاثية الحلقات والباربتيورات والفينوثيازينات) إلى زيادة خطورة انخفاض ضغط الدم.

تركيبات يتعين أخذها بعين الاعتبار
ميفلوكين: زيادة خطر بطء نبض القلب.
مثبطات أحادي أمين الأوكسيديز (باستثناء مثبطات أحادي أمين الأوكسيدي من النوع MAO-B): مفعول معزز لحاصرات بيتا المخفضة للضغط، ولكن مع خطورة الإصابة بأزمة ارتفاع في الضغط.

4.6 الخصوبة والحمل والإرضاع

الحمل
للبيسوبرولول تأثيرات فارماكولوجية قد تسبب أثارًا ضارة على الحمل و/أو الجنين / المولود. وبشكل عام، تعمل حاصرات مستقبلات بيتا الأدرينالينية بشكل عام على خفض الإرواء المشيمي، الذي كان له ارتباط بتخلف النمو وموت الأجنة داخل الرحم والإجهاض والولادة المبكرة. وقد تحدث تأثيرات ضارة (مثل نقص السكر في الدم وبطء نبض القلب) للجنين والأطفال حديثي الولادة. وإذا لزم العلاج بحاصرات مستقبلات بيتا الأدرينالينية، فيُفضل في هذه الحالة استخدام حاصرات مستقبلات بيتا 1 الأدرينالينية الانتقائية. ولا يُنصح باستعمال كونكور في فترة الحمل إلا إذا كانت هناك ضرورة واضحة لذلك. وإذا اعتُبر العلاج ضروريًا، فيُوصى برصد جريان الدم الرحمي المشيمي ونمو الجنين. وفي حال وجود آثار ضارة بالحمل أو الجنين، يُوصى بالنظر في أخذ علاج بديل. تجب ملاحظة المولود الجديد عن كثب. ومن المُتوقع بشكل عام أن تظهر أعراض نقص نسبة السكر في الدم وبطء نبض القلب خلال الأيام الثلاثة الأولى بعد الولادة.

الرضاعة الطبيعية
ليست هناك أي بيانات بشأن انتقال مادة البيسوبرولول في لبن ثدي الأم أو بشأن السلامة الخاصة بتعرض الأطفال الرضع لمادة البيسوبرولول.
ولذا لا يُنصح بالرضاعة الطبيعية أثناء تناول كونكور.

4.7 التأثير على القدرة على قيادة السيارة وتشغيل الماكينات
لم يتبين من دراسة أجريت على مرضى بداء القلب الإكليلي أن مادة بيسوبرولول تحد من قدرتهم على قيادة السيارة. بيد أن هذه المادة قد تحد من القدرة على قيادة المركبات أو تشغيل الماكينات بسبب التفاوت بين الأفراد في التفاعل مع الدواء. ولابد أخذ هذا بعين الاعتبار خصوصًا في بداية العلاج وعند تغيير الدواء بالإضافة إلى تناوله بجانب الكحول.

4.8 التأثيرات غير المرغوبة
شائع (أكبر من أو يساوي 1/100، أقل من 1/10)، غير شائع (أكبر من أو يساوي 1/1000، أقل من 1/100)، نادر (أكبر من أو يساوي 1/10 000، أقل من 1/1000)، نادر جدًا (أقل من 1/10 000).

التحقيقات
نادر: زيادة مستوى ثلاثي الغلسريد، زيادة إنزيمات الكبد (ALAT وASAT)

اضطرابات القلب
شائع جدًا: بطء القلب (لدى مرضى قصور القلب المزمن).
شائع: تردي قصور القلب (لدى مرضى قصور القلب المزمن).
غير شائع: اضطرابات في العقدة الأذينية البطينية وتردي قصور القلب المتواجد لدى المريض مسبقًا (لدى مرضى فرط ضغط الدم أو الذبحة الصدرية)؛ بطء القلب (لدى مرضى فرط ضغط الدم أو الذبحة الصدرية)

اضطرابات الجهاز العصبي
شائع: دوخة*، صداع*
نادر: غشي

اضطرابات العين
نادر: انخفاض تدفق الدمع (لابد مراعاة ذلك إذا كان المريض يرتدي عدسات لاصقة)
نادر جدًا: التهابات الملتحمة

اضطرابات في الأذن والأذن الباطنة
نادر: اضطرابات في السمع

اضطرابات تنفسية وصدرية ومنْصفيّة
غير شائع: تشنج قصبي لدى المرضى الذين يعانوا من الربو القصبي أو لديهم تاريخ مرضي ذو صلة بمرض انسداد المسالك الهوائية
نادر: التهاب الأنف التحسسي

اضطرابات الجهاز المعدي المعوي
شائع: شكاوى بخصوص اضطرابات معدية معوية مثل الغثيان والقيء والإسهال والإمساك

اضطراب في الجلد والأنسجة أسفل الجلد
نادر: تفاعلات فرط الحساسية مثل الحكة والاحمرار والطفح
نادر جدًا: الثعلبة، ومن الممكن لحاصرات بيتا أن تتسبب أو تعمل على زيادة الصدفية أو أن تحدث طفحًا شبيهًا للصدفية.

اضطرابات عضلية هيكلية واضطرابات الأنسجة الضامة
غير شائع: ضعف العضلات وشد عضلي

اضطرابات عامة
شائع: وهن (لدى مرضى قصور القلب المزمن) وتعب*
غير شائع: وهن (لدى مرضى فرط ضغط الدم أو الذبحة الصدرية)

اضطرابات كبدية صفراوية
نادر: التهاب الكبد

اضطرابات الجهاز التناسلي والثدي
نادر: اضطرابات الفحولة

اضطرابات نفسية
غير شائع: الاكتئاب، والاضطرابات في النوم
نادر: كوابيس وهلوسة
*تظهر هذه الأعراض بشكل خاص في بداية علاج فرط ضغط الدم أو الذبحة الصدرية.
وتخف عمومًا وعادةً م تختفي خلال أسبوع أو أسبوعين.

4.9 الجرعة المفرطة

الأعراض
تشتمل الأعراض الأكثر شيوعًا - المتوقع ظهورها عند تناول جرعة مفرطة من حاصرات بيتا - على بطء القلب ونقص ضغط الدم والتشنج القصبي والقصور القلبي الحاد وهبوط سكر الدم. هناك خبرة محدودة لدينا بشأن الجرعة المفرطة من مادة بيسوبرولول، حيث إنه لم يتم الإبلاغ إلا عن حالات قليلة من تناول جرعة مفرطة من مادة بيسوبرولول. ولُوحظت أعراض خاصة ببطء القلب و/أو نقص ضغط الدم. وجدير بالذكر أن جميع المرضى استردوا عافيتهم. ونظرًا لوجود اختلاف شاسع بين الأشخاص في مدى حساسيتهم تجاه تناول جرعة عالية واحدة من بيسوبرولول، وتجدر الإشارة هنا إلى أن مرضى القصور القلبي محتمل أن يكون لديهم حساسية بالغة تجاه بيسوبرولول. ولذلك، يلزم بدء علاج هؤلاء المرضى بزيادة تدريجية في الجرعة وفقا للنظام الموضح في القسم 4.2.

التحكم
بصفة عامة، في حال تلقي جرعة زائدة، فيوصى بالتوقف عن تناول علاج بيسوبرولول ويوصى بتناول العلاج التدعيمي والمعالج للأعراض.
وبناء على الإجراءات الدوائية والتوصيات المتعلقة بمثبطات مستقبلات بيتا الأخرى، فقد تؤخذ الإجراءات العامة التالية الاعتبار في حال ضمانها سريريًا.
قصور حاد في عمل القلب: أخذ الأتروبين في الوريد. إذا كانت الاستجابة للدواء غير مناسبة، فيتم إعطاء أيزوبرانالين أو دواء آخر له خصائص مِقاتية إيجابية بحذر. وفي بعض الظروف، قد تستدعي الحاجة إدخال منظّم لضربات القلب عبر الوريد.
انخفاض ضغط الدم: يتعين إعطاء سوائل الحقن الوريدي وقابضات الأوعية الدموية. وقد يكون من المفيد إعطاء جلوكاجون عبر الوريد.
الإحصار الأذيني البطيني (من الدرجة الثانية أو الثالثة): ينبغي ملاحظة المرضى بعناية ومعالجتهم بالحقن بالإيزوبرينالين أو بالمنظمات القلبية المؤقتة.
التفاقم الحاد لقصور القلب: إعطاء مدرات البول الوريدية وأدوية التقلص العضلي وأدوية توسيع الأوعية الدَّموية.
التشنج القصبي: إعطاء دواء لتوسيع الشعب مثل إيزوبرينالين و/أو أدوية بيتا2 محاكية سمبثاوية و/أو أمينوفيلين.
نقص سكر الدم: إعطاء الجلوكوز عن طريق الوريد.
هناك بيانات محدودة تشير إلى صعوبة قابلية دِيلَزة البيسوبرولول.

5. الخصائص الدوائية

5.1 الخصائص الدوائية

مجموعة العلاجات الدوائية: مواد انتقائية مثبطة لبيتا
كود نظام التصنيف الكيماوي العلاجي التشريحي: C07AB07

إن المادة الفعالة بيسوبرولول الموجودة في كونكور تعمل بمثابة مثبط للمستقبلات الأدرينالية الانتقائية بيتا 1 يفتقر إلى التحفيز الداخلي وعلى تثبيت النشاط الهام للأغشية. وهو لا يظهر سوى ألفة مُتدنية جدًا مع مستقبل بيتا 2 الخاص بالعضلات الملساء بالقصبات والأوعية الدموية وكذلك مع مستقبلات بيتا 2 التي تختص بتنظيم العوامل الاستقلابية. ولهذا السبب فإنه لا يجدر عمومًا توقع أن يؤثر البيسوبرولول على مقاومة المسالك الهوائي وعلى الآثار الاستقلابية التي تحدثها بيتا 2، وذلك لأن انتقائية مادة بيتا 1 تتخطى نطاق الجرعة العلاجية.
لم يسجل بيسوبرولول أي تأثير سلبي في التقلص العضلي.
وفي حالات المرضى الذين يعانون من أمراض القلب التاجية دون قصور مزمن في القلب، فإن بيسوبرولول يعمل على تقليل معدل ضربات القلب وحجم الدفقة، ومن ثم تقليل النّتاجُ القَلْبيّ واستهلاك الأكسجين. في الحالات المزمنة، فإن المقاومة المحيطية المرتفعة في البداية تقل. ويُرى ركود نشاط إنزيم الرينين في البلازما، من جملة أمور أخرى، كآلية عمل يقوم عليها تأثير ارتفاع ضغط الدم الناتج عن مثبطات بيتا.
يعمل بيسوبرولول على تقليل الاستجابة للنشاط الأدريني الودي من خلال حاصرات مستقبلات بيتا القلبية، هذا يؤدي إلى انخفاض في معدل ضربات القلب وانقباض العضلة، وبالتالي انخفاض في استهلاك عضلة القلب للأكسجين وهو التأثير المطلوب في حالة حدوث ذبحة صدرية مع وجود أمراض القلب التاجية المستبطنة.

5.2 الخرائك الدوائية

الامتصاص
يُمتص البيسوبرولول بشكل كامل تقريباً (أكبر من 90%) من القناة المعدية المعوية ويتمتع، بفضل صغر أيض العبور الأول الذي يعادل قرابة 10%، بتوافر حيوي مطلق بنسبة 90% تقريبًا بعد التناول عن طريق الفم.

توزيع الدواء
يعادل حجم توزيع الدواء 3.5 لتر/كغم. تعادل نسبة الارتباط ببروتينات البلازما 30% تقريبًا.

التحول الحيوي والتخلص من المرض
تتم تصفية بيسوبرولول من الجسم عن طريق مساري تخلص بفعالية متساوية: يتم تحويل 50% إلى أيضات خاملة في الكبد مع إفراز أيضات عن طريق الكلى. وتُفرز نسبة الـ 50% المتبقية كمادة غير متغيرة من الكليتين. لذلك لا يتطلب البيسوبرولول بشكل عام أي تعديل في الجرعة في حالة المرضى الذين يعانون من خلل من الدرجة البسيطة أو المتوسطة في وظائف الكبد أو الكلى نظرًا إلى أن الإطراح يحدث بنفس القدر في كل من الكليتين والكبد.
وصل تأثير دواء بيسوبرولول لأقصاه في خلال من 3 إلى 4 ساعات بعد تناول الدواء عن طريق الفم. ويوفر عمر النصف لإطراح البلازما الممتد من 10 إلى 12 ساعة نجاعة تدوم لمدة 24 ساعة بعد تناول الجرعة اليومية.
يصل تأثير خفض ضغط الدم لأقصى مستوى له في العموم بعد أسبوعين.

الخطية
يتميز البيسوبرولول بحرائك خطية مستقلة عن العمر.
مجموعات المرضى
تكون مستويات البلازما لدواء بيسوبرولول عالية في حالة المرضى المصابين بمرض قصور القلب المزمن (من الفئة الثالثة حسب تصنيف جمعية القلب في نيويورك)، كما يطول عمر النصف مقارنة بحالة المتطوعين الذين يتمتعون بصحة جيدة. ويصل تركيز البلازما الأقصى في الحالات الثابتة 64 نانوغرام/ملي لتر (بزيادة أو نقصان بمعدل 21 نانوغرام/ملي لتر) في جرعة يومية مقدارها 10 ملغ، كما يصل عمر النصف إلى 17 ساعة (بزيادة أو نقصان بمعدل 5 ساعات).
لم تجرى دراسة الحرائك الدوائية في المرضى الذين يعانون من قصور القلب المزمن المستقر والضعف الوظيفي الكبدي أو الكلوي المرافق.

5.3 البيانات الوقائية قبل السريرية
تكشف البيانات ما قبل السريرية عن عدم وجود أي مخاطر على الإنسان وذلك بناءً على دراسات تقليدية لسمية الجرعة المفردة والمتكررة أو السمية الوراثية / التطفرية أو السرطنة

السمية الإنجابية
تبين في دراسات علم السموم الإنجابية أن بيسوبرولول ليس له أي تأثير على الخصوبة أو على أداء الإنجابي بشكل عام.
ومثله مثل حاصرات بيتا الأخرى، تسبب البيسوبرولول سمية أمومية وسمية (انخفاض كمية الغذاء المتناول وانخفاض وزن الجسم) مضغية / جنينية (زيادة حدوث ارتشاف وانخفاض وزن الجنين عند الولادة ونمو بدني متأخر) عند تناول جرعات مرتفعة، ولكن لم يكن لذلك تأثير مسخي.

6. الخصائص الصيدلانية

6.1 قائمة المواد المضافة

مكونات قلب الأقراص:
سيليكا، غرواني لاماني
ستيارات المغنيسيوم
كروسبوفيدون
سليلوز دقيق التبلور
نشا الذرة
فوسفات هيدروجين الكالسيوم، لاماني

طبقة التغليف:
أكسيد الحديد الأصفر (E172)
ديميثيكون
ماكروجول 400
ثنائي أكسيد التيتانيوم (E171)
هيبرومولوز
كونكور 10 ملغ.
يحتوي على أكسيد الحديد الأحمر (E172) في طبقة التغليفبالإضافة إلى السواغات السابقة.

6.2 عمر التخزين
36 شهرًا.

6.3 تحذيرات خاصة بشأن التخزين
لا تحفظ الدواء في مكان تزيد درجة حرارته عن 30 درجة مئوية.

6.5 نوع ومحتويات العبوة
نوع العبوة: ألومنيوم/رقائق ألومنيوم
حجم العبوة: عبوة كرتونية تحتوي على 3 أشرطة مع نشرة للمنتج في كل عبوة. ويحتوي كل شريط على 10 أقراص.

6.6 تحذيرات خاصة بشأن التخلص من العبوة
لا توجد تحذيرات خاصة.

7. جهة التصنيع:

Merck KGaA, Frankfurter Strasse 250, 64293 Darmstadt, Germany

8. حامل حق التسويق

Merck KGaA, Frankfurter Strasse 250, 64293 Darmstadt, Germany

9. تاريخ إصدار المعلومات

23 مايو 2014

هذا الدواء
- الدواء مستحضر قد يؤثر على صحتك واستهلاكه خلافًا للتعليمات قد يشكل خطرًا عليك.
- اتبع وصفة الطبيب بدقة، وطريقة الاستعمال المنصوص عليها، وتعليمات الصيدلي الذي صرف لك الدواء.
- الطبيب والصيدلي هما أكثر خبرة بالدواء ونفعه وضرره.
- لذلك لا تقطع فترة العلاج الموصوفة لك بدون إذن من الطبيب المتابع لحالتك
- ولا تكرر صرف الدواء الموصوف لك دون استشارة الطبيب المتابع لحالتك.
لا تترك الدواء في متناول أيدي الأطفال.