

Состав

действующее вещество: 1 таблетка содержит бетаксолола гидрохлорида 20 мг;

вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая, натрия крахмалгликолят (тип А), кремния диоксид коллоидный безводный, магния стеарат;

оболочка: смесь для пленочного покрытия Opadry II White (гипромеллоза, лактозы моногидрат, полиэтиленгликоль, титана диоксид (Е 171), триацетин).

Лекарственная форма

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Основные физико-химические свойства: таблетки круглой формы с двояковыпуклой поверхностью с чертой, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа

Селективные блокаторы бета-адренорецепторов. Код АТХ С07А В05.

Фармакодинамика

Бетаксолол характеризуется тремя фармакологическими свойствами:

- кардиоселективным бета-адреноблокирующим действием;
- отсутствием частичной агонистической активности (т.е. не проявляет собственной симпатомиметической активности);
- слабым мембраностабилизирующим эффектом (подобно хинидину или местным анестетикам) в концентрациях, превышающих рекомендуемые терапевтические дозы.

Фармакокинетика

Абсорбция. Лекарственное средство быстро и полностью всасывается после приема внутрь при очень небольшом эффекте «первого прохождения» через

печень и очень высокой биодоступности - примерно 85 %, что обеспечивает незначительные отличия его концентрации в плазме крови у разных пациентов или у одного пациента при длительном применении. Бетаксолол связывается с белками плазмы крови приблизительно на 50 %.

Метаболизм. Объем распределения составляет около 6 л/кг. В организме бетаксолол в основном превращается в неактивные метаболиты, и только 10-15 % бетаксолола обнаруживается в моче в неизмененном виде. Основной путь элиминации - через почки.

Выведение. Период полувыведения бетаксолола из организма составляет 15-20 часов.

Показания

Артериальная гипертензия. Профилактика приступов стенокардии напряжения.

Противопоказания

- Тяжелые формы бронхиальной астмы хронических обструктивных заболеваний легких;
- сердечная недостаточность, которая не контролируется лечением;
- кардиогенный шок;
- атриовентрикулярная блокада II-III степени у больных, которые не имеют водителя ритма;
- стенокардия Принцметала (противопоказана монотерапия препаратом при изолированной/типовой форме этого заболевания);
- дисфункция синусового узла (включая синоатриальную блокаду);
- брадикардия (частота сердечных сокращений < 45-50 уд/мин);
- тяжелые формы синдрома Рейно и других нарушений периферического кровообращения;
- нелеченная феохромоцитома;
- артериальная гипотензия;
- гиперчувствительность к бетаксололу;
- анафилактические реакции в анамнезе;
- метаболический ацидоз.

Лекарственное средство противопоказано для применения в комбинации с флоктафенином и сультопридом (см. раздел «Взаимодействие с другими

лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»).

Применение лекарственного средства не рекомендуется в комбинации с амиодароном, бепридиллом, дилтиаземом и верапамилом (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»).

В связи с наличием лактозы это лекарственное средство противопоказано пациентам с врожденной галактоземией, мальабсорбцией глюкозы/галактозы или синдромом дефицита лактазы.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Брадикардия может быть обусловлена рядом лекарственных средств: бета-адреноблокаторами, антиаритмическими препаратами класса Ia (хинидин, дизопирамид), класса III (амиодарон и соталол), класса IV (дилтиазем и верапамил), а также гликозидами наперстянки, клонидином, гуанфацином, мефлохином и ингибиторами холинэстеразы, которые применяют для лечения болезни Альцгеймера.

Противопоказано одновременное применение лекарственного средства с указанными ниже препаратами.

Флоктафенин. В случае шока или артериальной гипотензии, обусловленной флоктафенином, бета-адреноблокаторы вызывают снижение компенсаторных сердечно-сосудистых реакций.

Сультоприд. Нарушение автоматизма сердца (чрезмерная брадикардия), обусловленное аддитивным эффектом уменьшения частоты сокращений.

Не рекомендуется применять лекарственное средство с указанными ниже препаратами.

Блокаторы кальциевых каналов (бепридил, дилтиазем и верапамил).

Нарушение автоматизма (чрезмерная брадикардия, остановка синусового узла), синоатриальной и атриовентрикулярной проводимости, сердечная недостаточность (синергическое действие). Такие комбинации можно применять только при тщательном клиническом контроле и электрокардиографическом наблюдении, особенно для больных пожилого возраста или в начале лечения.

Амиодарон. Нарушение сократимости, автоматизма и проводимости (угнетение симпатических компенсаторных механизмов).

Следует с осторожностью применять лекарственное средство с указанными ниже препаратами.

Ингаляционные анестетики, содержащие галоген. Бета-адреноблокаторы вызывают снижение сердечно-сосудистых компенсаторных реакций (во время операции угнетение бета-адренорецепторов можно устранить с помощью бета-стимуляторов). Как правило, терапию бета-блокаторами не следует прекращать, а резкой отмены лекарственного средства следует избегать в любом случае. Необходимо сообщить анестезиологу о лечении, которое проводится.

Лекарственные средства, которые могут провоцировать пароксизмальную желудочковую тахикардию типа «torsades de pointes» (кроме сультоприда). Антиаритмические лекарственные средства класса Ia (хинидин, гидрохинидин и дизопирамид) и класса III (амиодарон, дофетилид, ибутилид, сотатол); некоторые нейролептики группы фенотиазина (хлорпромазин, циамемазин, левомепромазин, тиоридазин), бензамиды (амисульприд, сульпирид, тиаприд), бутирофеноны (дроперидол, галоперидол), другие нейролептики (пимозид) и другие лекарственные средства (цисаприд, дифеманил, внутривенный эритромицин, галофантрин, мизоластин, моксифлоксацин, пентамидин, внутривенные спирамицин и винкамин). Повышение риска развития желудочковой аритмии и особенно пароксизмальной тахикардии типа «torsades de pointes» (гипокалиемия является провоцирующим фактором). Необходим клинический и электрокардиографический контроль.

Пропафенон. Нарушение сократимости, автоматизма и проводимости (угнетение симпатических компенсаторных механизмов). Необходим клинический и

электрокардиографический контроль.

Баклофен. Усиление антигипертензивного действия. Необходим контроль артериального давления и коррекция дозы антигипертензивного средства.

Инсулин и антидиабетические сульфонамиды. Все бета-блокаторы могут маскировать некоторые симптомы гипогликемии, такие как тахикардия, ощущение сердцебиения (см. раздел «Особенности применения»). Пациент должен быть предупрежден о необходимости усилить самоконтроль уровня сахара в крови.

Ингибиторы холинэстеразы (амбенониум, донепезил, галантамин, неостигмин, пиридостигмин, ривастигмин, такрин). Риск усиления брадикардии (аддитивное действие).

Необходим регулярный клинический контроль.

Антигипертензивные средства центрального действия (клонидин, апраклонидин, альфа-метилдопа, гуанфацин, моксонидин, рилменидин). Значительное повышение артериального давления при резкой отмене антигипертензивного лекарственного средства центрального действия. Необходимо избегать внезапной отмены антигипертензивного средства и проводить клинический контроль.

Лидокаин (внутривенно). Увеличение концентрации лидокаина в плазме крови с возможным усилением нежелательных неврологических и сердечных эффектов (снижение метаболизма лидокаина в печени). Рекомендуются клинический и электрокардиографический контроль и, возможно, определение концентрации лидокаина в плазме крови как во время лечения бета-адреноблокаторами, так и после его прекращения. При необходимости – коррекция дозы лидокаина.

Комбинации, требующие особого внимания.

Нестероидные противовоспалительные препараты (системного действия), в том числе селективные ингибиторы ЦОГ-2. Снижение гипотензивного эффекта (угнетение вазодилатирующих простагландинов нестероидными противовоспалительными препаратами и задержка жидкости и натрия пиразолоновыми производными).

Блокаторы кальциевых каналов (дигидропиридины). Артериальная гипотензия, недостаточность кровообращения у пациентов с латентной или неконтролируемой сердечной недостаточностью. Лечение бета-адреноблокаторами может минимизировать рефлекторные симпатические механизмы, которые запускаются при чрезмерных гемодинамических реакциях.

Антидепрессанты, родственные с имипрамином, нейролептики. Усиление гипотензивного эффекта и риск ортостатической гипотензии (аддитивное действие).

Мефлохин. Риск брадикардии (аддитивное действие относительно развития брадикардии).

Дипиридамол (внутривенно). Усиление антигипертензивного эффекта.

Альфа-блокаторы, применяющиеся в урологии (альфузозин, доксазозин, празозин, тамсулозин, теразозин). Усиление антигипертензивного эффекта. Повышенный риск ортостатической гипотензии.

Амифостин. Усиление антигипертензивного эффекта.

Сердечные гликозиды. Комбинация, которая может удлинять время атриовентрикулярной проводимости и вызывать брадикардию.

Финголимод. Одновременное применение финголимода с бета-блокаторами может потенцировать брадикардический эффект и поэтому эта комбинация не рекомендована. Если нужно одновременное применение, необходим соответствующий мониторинг с момента начала лечения; рекомендовано как минимум проводить ночной мониторинг.

Йодсодержащие контрастные вещества. В случае возникновения шока или артериальной гипотензии на введение йодсодержащих контрастных веществ бета-блокаторы вызывают снижение сердечно-сосудистых компенсаторных реакций.

Когда возможно, лечение бета-блокаторами следует прекратить перед проведением радиографического исследования. Если применение является необходимым, врач должен иметь возможность проведения интенсивной терапии.

Кортикостероиды и тетракозактид. Снижение антигипертензивного эффекта (задержка воды и натрия в комбинации с кортикостероидами).

Особенности применения

Никогда не следует внезапно прекращать лечение лекарственным средством у больных со стенокардией: резкое прекращение применения лекарственного средства может привести к серьезным нарушениям сердечного ритма, инфаркту миокарда или внезапному летальному исходу.

В связи с наличием лактозы это лекарственное средство противопоказано пациентам с врожденной галактоземией, мальабсорбцией глюкозы/галактозы или синдромом дефицита лактазы.

Меры предосторожности при применении.

Отмена лекарственного средства. Лечение лекарственным средством не следует прекращать внезапно, особенно для больных с ишемической болезнью сердца. Дозу необходимо снижать постепенно, в течение 1-2 недель, а при необходимости можно одновременно начать заместительную терапию, чтобы избежать прогрессирования стенокардии.

Бронхиальная астма и хроническое обструктивное заболевание легких. Бета-адреноблокаторы можно назначать только больным с умеренной степенью тяжести заболевания, с выбором селективного бета-адреноблокатора в низкой начальной дозе. Перед началом лечения рекомендуется провести оценку дыхательной функции. При развитии приступов во время лечения можно применять бронходилататоры (бета₂-адреномиметики).

Сердечная недостаточность. Для лечения больных с нерифрактерной сердечной недостаточностью лекарственное средство при необходимости можно применять под тщательным медицинским наблюдением в низких дозах, которые постепенно повышаются.

Брадикардия. Дозу необходимо уменьшить, если частота сердечных сокращений в состоянии покоя ниже 50-55 ударов за минуту и у больного есть клинические проявления брадикардии.

Атриовентрикулярная блокада I степени. Учитывая отрицательный дромотропный эффект бета-блокаторов, лекарственное средство с осторожностью следует назначать пациентам с атриовентрикулярной блокадой I степени.

Стенокардия Принцметала. Количество и длительность приступов стенокардии могут увеличиться при применении бета-блокаторов у больных с стенокардией Принцметала.

Применение лекарственного средства возможно при заболевании умеренной степени тяжести и при условии, что лечение проводить одновременно с применением сосудорасширяющих средств.

Нарушения периферического кровообращения. Бета-адреноблокаторы могут приводить к ухудшению состояния больных с нарушениями периферического кровообращения (болезнь Рейно или синдром Рейно, артериит или хронические облитерирующие заболевания артерий нижних конечностей). В таких случаях рекомендуется применять кардиоселективный бета-блокатор с наличием свойств частичного агониста бета-рецепторов; назначать его следует с осторожностью.

Феохромоцитома. При применении бета-адреноблокаторов для лечения артериальной гипертензии, вызванной феохромоцитомой, нужен тщательный мониторинг артериального давления.

Пациенты пожилого возраста. У пациентов пожилого возраста обязательным является строгое соблюдение рекомендаций относительно противопоказаний. Нужно быть осторожными: лечение пациентов пожилого возраста следует начинать с малой дозы и под тщательным наблюдением (см. раздел «Способ применения и дозы»).

Больные с почечной недостаточностью. Для пациентов с почечной недостаточностью дозировку необходимо корректировать в зависимости от концентрации креатинина в крови или клиренса креатинина (см. раздел «Способ применения и дозы»).

Пациенты больные сахарным диабетом. Следует предупредить больного о необходимости усилить самоконтроль уровня глюкозы в крови в начале лечения. Продромальные симптомы гипогликемии могут быть замаскированными, особенно тахикардия, ощущение сердцебиения и повышенная потливость (см. разделы «Взаимодействие с другими лекарственными средствами» и «Побочные реакции»).

Псориаз. Назначение лекарственного средства требует тщательной оценки необходимости его применения, поскольку есть сообщения об ухудшении состояния больных с псориазом во время лечения бета-адреноблокаторами (см. раздел «Побочные реакции»).

Аллергические реакции. У пациентов, склонных к тяжелым анафилактическим реакциям, особенно связанных с применением флоктафенина (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами»), или при проведении десенсибилизации терапия бета-адреноблокаторами может привести к дальнейшему усилению реакции и снижению эффективности лечения этого состояния обычными дозами адреналина.

Общая анестезия. Бета-блокаторы вызывают ослабление рефлекторной тахикардии и увеличивают риск артериальной гипотензии. Продолжение лечения бета-блокаторами снижает риск развития аритмии, миокардиальной ишемии и гипертонических кризов. Следует сообщить анестезиологу о том, что больной проходит лечение бета-блокатором.

При необходимости прекращения лечения и отмены лекарственного средства считается достаточным 48 часов для восстановления чувствительности к катехоламинам.

Терапию бета-адреноблокаторами не следует прекращать:

- у больных с коронарной недостаточностью, которым желательно применять лекарственное средство до операции, учитывая риск, связанный с внезапной отменой бета-адреноблокаторов;
- в случае urgentных операций или в тех случаях, когда прекращение лечения невозможно.

Больного нужно защитить от последствий возбуждения блуждающего нерва, назначая премедикацию атропином, с повторением при необходимости. Для анестезии необходимо применять средства, угнетающие миокард в наименьшей степени, а потеря крови должна быть компенсирована.

Необходимо учитывать риск развития анафилактических реакций.

Офтальмология. Блокада бета-адренорецепторов обуславливает снижение внутриглазного давления и может приводить к изменению результатов скринингового исследования на глаукому. Офтальмолог должен быть проинформирован о том, что пациент применяет бетаксолол. За пациентами, применяющими бета-блокаторы и системно, и в виде глазных капель, необходимо установить наблюдение, учитывая возможный аддитивный эффект этих лекарственных средств.

Тиреотоксикоз. Бета-блокаторы маскируют сердечно-сосудистые симптомы тиреотоксикоза.

Спортсмены. Спортсмены должны учитывать, что лекарственное средство содержит активную субстанцию, которая может давать положительную реакцию при проведении тестов антидопингового контроля.

Лекарственное средство содержит лактозу, поэтому его противопоказано применять пациентам с редкими наследственными формами непереносимости галактозы, недостаточностью лактазы или синдромом глюкозо/галактозной мальабсорбции.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

Исследования по изучению влияния бетаксолола на способность управления автотранспортом не проводились. При управлении автотранспортом или работе с другими механизмами необходимо учитывать, что на фоне приема данного препарата иногда могут возникать головокружение, нарушение остроты зрения и другие побочные реакции, что может негативно повлиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или другими механизмами.

Применение в период беременности или кормления грудью

Беременность.

Тератогенный аспект. В настоящее время нет сообщений о тератогенных эффектах у людей, а также информации о выявлении врожденных пороков развития.

Неонатальный аспект. Действие бета-адреноблокатора сохраняется в течение нескольких дней после рождения у новорожденных, матери которых получали лечение данным лекарственным средством. Хотя этот остаточный эффект может не иметь клинических последствий, тем не менее сохраняется возможность развития сердечной недостаточности. В таком случае новорожденного необходимо поместить в отделение интенсивной терапии (см. раздел «Передозировка»), а также следует избегать применения плазмозаменителей (из-за риска развития острого отека легких). Также есть сообщения о случаях развития брадикардии, респираторного дистресс-синдрома и гипогликемии. В связи с этим рекомендуется тщательное наблюдение за новорожденным в специализированных условиях (контроль частоты сердечных сокращений и уровня глюкозы в крови в течение первых 3-5 дней жизни).

В связи с этим применение бетаксолола в период беременности не рекомендуется, за исключением случаев, когда польза от применения препарата превышает возможные риски.

Кормление грудью.

Бета-адреноблокаторы проникают в грудное молоко. Кормление грудью в период лечения лекарственным средством следует прекратить, поскольку риск развития гипогликемии или брадикардии у новорожденных не исследовался.

Способ применения и дозы

Обычная доза при артериальной гипертензии и для профилактики приступов стенокардии напряжения - 1 таблетка по 20 мг в сутки.

Дозирование для больных с почечной недостаточностью. У больных с почечной недостаточностью клиренс бетаксолола уменьшается со снижением функции почек. Дозу необходимо адаптировать к состоянию почечной функции больного:

при клиренсе креатинина ≥ 20 мл/мин коррекции дозы не требуется. Однако рекомендуется проводить клиническое наблюдение, начиная с 1-й недели лечения до достижения равновесных уровней препарата в крови (в среднем 4 суток).

Для больных с тяжелой почечной недостаточностью (клиренс креатинина < 20 мл/мин) рекомендуемая начальная доза составляет 10 мг в сутки (независимо от частоты и расписания процедур диализа у больных, которым проводится гемодиализ).

Для больных с печеночной недостаточностью нет необходимости корректировать дозу; однако в начале терапии желательно клиническое наблюдение.

Дети

Безопасность и эффективность применения лекарственного средства у детей не установлены, поэтому применение его этой категории пациентов противопоказано.

Передозировка

Симптомы передозировки лекарственного средства: брадикардия или чрезмерное снижение артериального давления.

При брадикардии или чрезмерном снижении артериального давления необходимо ввести:

- 1-2 мг атропина внутривенно;
- 1 мг глюкагона (введение препарата повторить при необходимости);
- при необходимости провести медленную инфузию 25 мкг изопреналина или вводить 2,5-10 мкг/кг/мин добутамина.

При сердечной декомпенсации у новорожденных, матери которых в период беременности применяли бета-адреноблокаторы:

- глюкагон в дозе 0,3 мг/кг массы тела;
- госпитализация в отделение интенсивной терапии;
- изопреналин и добутамин: обычно в достаточно высоких дозах и длительное время, под наблюдением специалиста.

Побочные реакции

Со стороны кожи и подкожной клетчатки: кожные реакции, включая псориазоподобную сыпь или обострение псориаза (см. раздел «Особенности применения»); крапивница, зуд, гипергидроз.

Со стороны нервной системы: головокружение, головная боль; дистальная парестезия; летаргия.

Со стороны органов зрения: ощущение сухости в глазах, нарушение остроты зрения.

Со стороны психики: астения, бессонница, усталость; депрессия; ночные кошмары, спутанность сознания, галлюцинации.

Со стороны желудочно-кишечной системы: желудочно-кишечные расстройства (боль в животе, диарея, тошнота и рвота).

Со стороны метаболизма и нутритивные расстройства: гипогликемия, гипергликемия, брадикардия (возможно, тяжелая); замедление атриовентрикулярной проводимости или усиление существующей атриовентрикулярной блокады, сердечная недостаточность, снижение артериального давления.

Со стороны сосудов: похолодание конечностей; синдром Рейно, ухудшение перемежающейся хромоты.

Со стороны респираторной системы, грудной клетки и средостения: бронхоспазм, диспноэ.

Со стороны репродуктивной системы: импотенция.

Лабораторные показатели. Редко наблюдается появление антинуклеарных антител, которое только в исключительных случаях сопровождалось клиническими проявлениями типа системной красной волчанки, которые проходят после прекращения лечения.

Срок годности

4 года.

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 10 таблеток в блистере; по 3 блистера в пачке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

АО «КИЕВСКИЙ ВИТАМИННЫЙ ЗАВОД».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

04073, Украина, г. Киев, ул. Копыловская, 38.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).