

Состав

действующее вещество: бетаксоллол;

1 таблетка содержит бетаксоллола гидрохлорида 20 мг;

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

оболочка: гипромеллоза, титана диоксид (Е 171), полиэтиленгликоль.

Лекарственная форма

Таблетки, покрытые оболочкой.

Основные физико-химические свойства: белого цвета двояковыпуклые круглые таблетки, покрытые оболочкой, с линией распределения с одной стороны и гравировкой с другой.

Фармакотерапевтическая группа

Селективные блокаторы бета-адренорецепторов. Код АТХ С07А В05.

Фармакодинамика

Бетаксоллол 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. Бетаксоллол 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

- Гиперчувствительность к бетаксололу или к любой другой составляющей препарата.
- Тяжелые формы бронхиальной астмы и хронического обструктивного заболевания легких.
- Сердечная недостаточность, не контролируется лечением.
- Кардиогенный шок.
- Блокада II и III степени у больных, не имеющих 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 заболеваний периферических артерий.
- Нелеченная феохромоцитома.
- Артериальная гипотензия.
- Анафилактические реакции в анамнезе.
- Метаболический ацидоз.
- Препарат противопоказан для применения в комбинации с флоктафенином и сультопридом (см. Раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Препараты, вызывающие брадикардию.

Брадикардия может быть обусловлена целым рядом лекарственных средств: бета-адреноблокаторами, антиаритмическими препаратами класса Ia, некоторыми антиаритмическими препаратами класса III, некоторыми блокаторами кальциевых каналов, препаратами наперстянки, пилокарпином и антихолинэстеразными препаратами.

При применении бета-блокаторов, в том числе лекарственного средства ЛОКРЕНА в комбинации с другими лекарственными средствами, для которых известен эффект индуцирования остановки синусового узла, возможна остановка синусового узла (см. Раздел «Побочные реакции»).

Нежелательные комбинации.

Дилтиазем. Сообщалось о случаях нарушения автоматизма (чрезмерная брадикардия, остановка синусового узла), нарушения синоатриальной и AV проводимости, сердечной недостаточности. Одновременное применение с бетаксололом требует тщательного клинического и электрокардиографического мониторинга, особенно у пациентов пожилого возраста или в начале лечения.

Сообщалось о повышенном риске депрессии в случае одновременного применения бета-адреноблокаторов и дилтиазема (см. Раздел «Побочные реакции»).

Верапамил. Сообщалось о случаях нарушения автоматизма (чрезмерная брадикардия, остановка синусового узла), нарушения синоатриальной и AV проводимости, сердечной недостаточности. Одновременное применение с бетаксололом требует тщательного клинического и электрокардиографического мониторинга, особенно у пациентов пожилого возраста или в начале лечения.

Финголимод. Одновременное применение Финголимод с бета-блокаторами может усиливать эффекты замедления сердечного ритма, что может приводить к летальному исходу. Это особенно актуально для бета-блокаторов, которые подавляют адренергические компенсаторные механизмы.

Необходим непрерывный клинический и ЭКГ-контроль в течение 24 часов после первой дозы препарата.

Комбинации, требующие мер при одновременном применении.

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

Необходим клинический и ЭКГ-контроль.

Летучие анестетики, содержащие галоген. Бета-адреноблокаторы вызывают снижение сердечно-сосудистых компенсаторных реакций. Ингибирования бета-адренорецепторов во время оперативного вмешательства можно устранить с помощью бета-стимуляторов. Как правило, терапию бета-блокаторами не следует прекращать, а резкой отмены препарата следует избегать в любом случае. Необходимо сообщить анестезиолога о лечении бета-блокаторами, что производится.

Антиаритмические препараты I класса (кроме лидокаина): цибензолин, дизопирамид, флекаинид, гидрохинидин, мексилетин, пропafenон, хинидин. Нарушение сократимости, автоматизма и проводимости миокарда (угнетение симпатических компенсаторных механизмов).

Необходим клинический и ЭКГ-контроль.

Антигипертензивные препараты центрального действия (клонидин, метилдопа, гуанфацин, моксонидин, рименидин). Выраженное повышение артериального давления в случае внезапной отмены антигипертензивных препаратов центрального действия. Следует избегать внезапного прекращения лечения антигипертензивными препаратами центрального действия.

Необходим клинический контроль.

Инсулин, производные сульфонилмочевины, глиниды, глиптины. Все бета-блокаторы могут маскировать некоторые симптомы гипогликемии, такие как ощущение усиленного сердцебиения и тахикардия. Пациента следует предупредить об этом и о необходимости усилить самоконтроль уровня сахара в крови, особенно в начале лечения (см. Раздел «Особенности применения»).

Лидокаин (внутривенно). Увеличение концентрации лидокаина в плазме крови с возможным усилением неврологических и сердечных побочных реакций (снижение метаболизма лидокаина в печени). Рекомендуется клинический и ЭКГ-контроль и в случае необходимости определения концентрации лидокаина в плазме крови как при лечении бета-адреноблокаторами, так и после его прекращения. В случае необходимости корректируют дозу лидокаина.

Препараты, которые могут провоцировать пароксизмальную желудочковую тахикардию типа «torsades de pointes». Повышение риска развития желудочковой аритмии и особенно пароксизмальную тахикардию типа «torsades de pointes». Необходим клинический и ЭКГ-контроль.

Пропafenон. Нарушение сократимости, автоматизма и проводимости миокарда (угнетение симпатических компенсаторных механизмов). Необходим клинический и ЭКГ-контроль.

Комбинации, которые требуют особого внимания.

Альфа-блокаторы, применяемые в урологии. Усиление антигипертензивного эффекта. Повышенный риск ортостатической гипотензии.

Антигипертензивные альфа-блокаторы. Усиление антигипертензивного эффекта. Повышенный риск ортостатической гипотензии.

Нестероидные противовоспалительные препараты. Снижение антигипертензивного эффекта (индуцированное НПВП подавление вазодилатирующих простагландинов и задержка жидкости и натрия фенилбутаноном).

Другие лекарственные средства, вызывающие брадикардию. Риск развития чрезмерной брадикардии (аддитивный эффект).

Дигидропиридина (амлодипин, барнидипин, клеvidипин, фелодипин, исрадипин, лацидипином, лерканидипин, манидипин, никардипин, нифедипин, нимодипин, нитрендипин). Артериальная гипотензия, сердечная недостаточность у пациентов с латентной или неконтролируемой сердечной недостаточностью (аддитивные негативные инотропные эффекты). Лечение бета-блокаторами также может минимизировать рефлекторную симпатичную ответ, запускается в случае чрезмерных гемодинамических эффектов.

Дипиридамо́л (внутривенное применение). Повышенный антигипертензивный эффект.

Производные нитратов / нитритов. Увеличение риска развития артериальной гипотензии, особенно ортостатической гипотензии.

Лекарственные средства, которые способствуют возникновению ортостатической гипотензии (особенно нитраты, ингибиторы фосфодиэстеразы типа 5, альфа-блокаторы при приеме за урологическими показаниям, Имипрамино́вые антидепрессанты, нейролептики класса фенотиазинов, агонисты допамина и леводопа). Риск развития артериальной гипотензии, особенно ортостатической гипотензии.

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 нерезервированной 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 бетаксол. 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.

Это лекарственное средство содержит 4 мг / доза натрия. Следует соблюдать осторожность при применении у пациентов, применяют натрий-контролируемую диету.

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

Исследований влияния бетаксолола на способность управлять автотранспортом не проводили. При управлении автотранспортом или работе с другими механизмами необходимо учитывать, что на фоне приема этого препарата иногда могут возникать головокружение или повышенная утомляемость.

Применение в период беременности или кормления грудью

Беременность.

В исследованиях на животных не было выявлено никаких тератогенных эффектов препарата. До сих пор нет сообщений о тератогенных эффектах у людей, а в результате контролируемых проспективных исследований нескольких бета-адреноблокаторов не было обнаружено никаких врожденных пороков развития.

Некоторые бета-адреноблокаторы могут уменьшать перфузию плаценты.

Действие бета-адреноблокатора сохраняется в течение нескольких дней после рождения у новорожденных, матери которых получали лечение данным лекарственным средством, и может привести к брадикардии, респираторный дистресс и гипогликемию, но чаще всего это остаточный эффект не имеет никаких клинических последствий. Однако высокие дозы бета-блокаторов могут обусловить развитие сердечной недостаточности из-за ослабления сердечно-сосудистых компенсаторных реакций. В случае возникновения сердечной недостаточности новорожденного необходимо госпитализировать в отделение интенсивной терапии (см. Раздел «Передозировка»), а также следует избегать применения плазмозаменителей (из-за риска развития острого отека легких).

Применение бетаксолола в период беременности не рекомендуется, за исключением случаев, когда польза от применения препарата превышает возможные риски. Если лечение продолжается до самого рождения ребенка, рекомендуется тщательное наблюдение за новорожденным в специализированных условиях (контроль частоты сердечных сокращений и уровня глюкозы в крови в течение первых 3-5 дней жизни).

Кормление грудью.

Бета-адреноблокаторы проникают в грудное молоко. Кормление грудью в период лечения препарата Локрен[®] следует прекратить, поскольку риск развития гипогликемии или брадикардии у новорожденных не исследовалась.

Способ применения и дозы

Препарат предназначен для перорального применения.

Обычная доза для лечения артериальной гипертензии и для профилактики приступов стенокардии напряжения - 1 таблетка по 20 мг один раз в сутки. Календарная упаковка, на которой обозначены дни недели, обеспечивает лучшие условия для лечения, облегчая для пациента соблюдения инструкций по приему лекарственного средства.

Дозирование для пациентов с почечной недостаточностью.

Дозу необходимо корректировать в зависимости от состояния функции почек больного.

При КК ³ 20 мл / мин коррекция дозы не требуется. Однако рекомендуется проводить клиническое наблюдение со старта терапии и до достижения равновесных уровней препарата в крови (в среднем 4 суток).

Для пациентов 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).

Дозирование для пациентов с печеночной недостаточностью.

Нет необходимости корректировать дозу однако в начале терапии рекомендуется 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

Частота побочных реакций классифицирована по следующим категориям: очень часто ($\geq 1 / 10$), часто (от $\geq 1/100$ до $<1/10$), нечасто (от $\geq 1/1000$ до $<1/100$), редко (от $\geq 1 / 10000$ до $<1/1000$), очень редко ($<1/10\ 000$), частота неизвестна (нельзя оценить по доступным данным).

Побочные реакции представлены в рамках каждого класса в порядке убывания частоты.

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 сопровождалась клиническими проявлениями типа системной красной волчанки, которые проходят после прекращения лечения.

Сообщение о подозреваемых побочных реакциях

Сообщение о подозреваемых побочных реакциях, которые возникли после регистрации препарата, очень важны. Это позволяет продолжать мониторить соотношение польза / риск для этого лекарственного средства. Медицинских работников просят сообщать обо всех подозреваемых побочных реакциях через национальную систему сообщений.

Срок годности

3 года.

Условия хранения

Хранить в недоступном для детей месте. Не требует специальных условий хранения.

Упаковка

По 14 таблеток в блистере, по 2 блистера в картонной коробке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

САНОФИ Уинтроп ИНДАСТРИА.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

30-36 авеню Гюстав Эйфель, ТУРЗ, 37100, Франция.

Источник инструкции

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