

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

БЕТАК

(БЕТАС)

Склад:

діюча речовина: бетаксолोल;

1 таблетка містить бетаксололу гідрохлориду 10 мг або 20 мг;

допоміжні речовини:

дозування 10 мг: целюлоза мікрокристалічна; лактоза, моногідрат; натрію крохмальгліколят; кремнію діоксид колоїдний б/в; магнію стеарат; спирт полівініловий; титану діоксид (Е 171); тальк очищений; лецитин; ксантангум;

дозування 20 мг: лактоза, моногідрат; целюлоза мікрокристалічна; натрію крохмальгліколят (Тип А); магнію стеарат; кремнію діоксид колоїдний безводний, *плівкове покриття*: тальк очищений, Opadry white OY-B-28920 (ксантангум, лецитин, тальк очищений; спирт полівініловий; титану діоксид (Е 171)).

Лікарська форма. Таблетки, вкриті плівковою оболонкою.

Основні фізико-хімічні властивості:

таблетки по 10 мг – круглі двоопуклі таблетки білого або майже білого кольору, вкриті плівковою оболонкою, діаметром ядра приблизно 7,0 мм;

таблетки по 20 мг – круглі двоопуклі таблетки білого або майже білого кольору з розділяючою борозенкою, діаметром ядра приблизно 9,5 мм, вкриті плівковою оболонкою.

Фармакотерапевтична група. Селективні блокатори бета-адренорецепторів.

Код АТХ С07А В05.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Бетаксолोल характеризується трьома фармакологічними властивостями:

- кардіоселективною бета-адреноблокуючою дією;
- відсутністю часткової агоністичної активності (тобто не проявляє власної симпатоміметичної активності);
- слабким мембраностабілізуючим ефектом (подібно до хінідину або до місцевих анестетиків) у концентраціях, які перевищують рекомендовані терапевтичні дози.

Фармакокінетика.

Абсорбція. Препарат швидко та повністю всмоктується після перорального прийому при дуже невеликому ефекті першого проходження через печінку та дуже високій біодоступності – приблизно 85 %, що забезпечує низькі відмінності його концентрації у плазмі крові у різних пацієнтів або в одного пацієнта при тривалому застосуванні.

Бетаксолол зв'язується з білками плазми крові приблизно на 50 %.

Метаболізм. Об'єм розподілу становить приблизно 6 л/кг. В організмі бетаксолол в основному перетворюється у неактивні метаболіти, і тільки 10-15 % бетаксололу виявляється у сечі у незмінному стані. Основний шлях елімінації – через нирки.

Виділення. Період напіввиведення бетаксололу з організму становить 15-20 годин.

Клінічні характеристики.

Показання.

Артеріальна гіпертензія.

Профілактика нападів стенокардії напруження.

Протипоказання.

Тяжкі форми бронхіальної астми та хронічних обструктивних захворювань легень.

Серцева недостатність, яка не контролюється лікуванням.

Кардіогенний шок.

Атріовентрикулярна блокада II та III ступеня у хворих, які не мають водія ритму.

Стенокардія Принцметала (протипоказана монотерапія препаратом при ізольованій/типовій формі цього захворювання).

Дисфункція синусового вузла (включаючи синоатріальну блокаду).

Брадикардія (частота серцевих скорочень <45-50 уд/хв).

Тяжкі форми синдрому Рейно та інших порушень периферичного кровообігу.

Нелікована феохромоцитома.

Артеріальна гіпотензія.

Гіперчутливість до бетаксололу.

Анафілактичні реакції в анамнезі.

Метаболічний ацидоз.

Препарат протипоказаний для застосування у комбінації з флоктафеніном та сультопридом (див. розділ «Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій»).

Застосування препарату не рекомендується у комбінації з аміодароном, бепридилом, дилтіаземом і верапамілом (див. розділ «Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій»).

У зв'язку з наявністю лактози цей лікарський засіб протипоказаний пацієнтам із вродженою галактоземією, мальабсорбцією глюкози/галактози або синдромом дефіциту лактази.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Брадикардія може бути зумовлена цілим рядом лікарських засобів: бета-адреноблокаторами, антиаритмічними препаратами класу Ia (хінідин, дизопірамід), класу III (аміодарон і соталол), класу IV (дилтіазем і верапаміл), а також глікозидами наперстянки, клонідином, гуафанцином, мефлохіном і інгібіторами холінергастери, які застосовують для лікування хвороби Альцгеймера.

Протипоказане одночасне застосування препарату Бетак із зазначеними нижче препаратами.

Флоктафенін. У разі шоку або артеріальної гіпотензії, зумовленої флоктафеніном, бета-адреноблокатори спричиняють зниження компенсаторних серцево-судинних реакцій.

Сультоприд. Порушення автоматизму серця (надмірна брадикардія), зумовлена адитивним ефектом зменшення частоти скорочень.

Не рекомендується застосовувати препарат Бетак із зазначеними нижче препаратами.

Блокатори кальцієвих каналів (бепридил, дилтіазем і верапаміл). Порушення автоматизму (надмірна брадикардія, зупинка синусового вузла), синоатріальної та атріовентрикулярної провідності, серцева недостатність (синергічна дія). Такі комбінації можна застосовувати тільки при ретельному клінічному контролі та електрокардіографічному спостереженні, особливо для хворих літнього віку або на початку лікування.

Аміодарон. Порушення скоротливості, автоматизму та провідності (пригнічення симпатичних компенсаторних механізмів).

Слід з обережністю застосовувати препарат Бетак із зазначеними нижче препаратами.

Інгаляційні анестетики, які містять галоген. Бета-адреноблокатори спричиняють зниження серцево-судинних компенсаторних реакцій (під час операції пригнічення бета-адренорецепторів можна усунути за допомогою бета-стимуляторів). Як правило, терапію бета-блокаторами не слід припиняти, а різкої відміни препарату слід уникати у будь-якому випадку. Необхідно повідомити анестезіолога про лікування, що проводиться.

Препарати, які можуть провокувати пароксизмальну шлуночкову тахікардію типу «torsades de pointes» (крім сультоприду). Антиаритмічні препарати класу Ia (хінідин, гідрохінідин і дизопірамід) і класу III (аміодарон, дофетилід, ібутилід, сотатол); деякі нейролептики групи фенотіазину (хлорпромазин, ціамемазин, левомепромазин, тіоридазин), бензаміди (амісульприд, сульпірид, тіаприд), бутирофенони (дроперидол, галоперидол), інші нейролептики (пімозид) та інші препарати (цисаприд, дифеманіл, внутрішньовенний еритроміцин, галофантрин, мізоластин, моксифлоксацин, пентамідин, внутрішньовенні спіраміцин і вінкамін). Підвищення ризику розвитку шлуночкової аритмії та особливо пароксизмальної тахікардії типу «torsades de pointes» (гіпокаліємія є провокуючим фактором). Потрібен клінічний та електрокардіографічний контроль.

Пропафенон. Порушення скоротливості, автоматизму та провідності (пригнічення симпатичних компенсаторних механізмів). Необхідний клінічний і електрокардіографічний контроль.

Баклофен. Посилення антигіпертензивної дії. Потрібен контроль артеріального тиску та коригування дози антигіпертензивного засобу.

Інсулін і антидіабетичні сульфонаміди. Усі бета-блокатори можуть маскувати деякі симптоми гіпоглікемії, такі як тахікардія, відчуття серцебиття (див. розділ «Особливості застосування»). Пацієнт має бути попереджений про необхідність посилити самоконтроль рівня цукру у крові.

Інгібітори холінергастери (амбеноніум, донепезил, галантамін, неостигмін, піридостигмін, ривастигмін, такрин). Ризик посилення брадикардії (адитивна дія). Потрібен регулярний клінічний контроль.

Антигіпертензивні засоби центральної дії (клонідин, апраклонідин, альфа-метилдопа, гуанфацин, моксонідин, рилменідин). Значне підвищення артеріального тиску при різкій відміні антигіпертензивного препарату центральної дії. Необхідно уникати раптової відміни антигіпертензивного засобу та проводити клінічний контроль.

Лідокаїн (внутрішньовенно). Збільшення концентрації лідокаїну у плазмі крові з можливим посиленням небажаних неврологічних і серцевих ефектів (зниження метаболізму лідокаїну у печінці). Рекомендується клінічний та електрокардіографічний контроль і, можливо, визначення концентрації лідокаїну у плазмі крові як під час лікування бета-адреноблокаторами, так і після його припинення. При необхідності – корекція дози лідокаїну.

Комбінації, які потребують особливої уваги.

Нестероїдні протизапальні препарати (системної дії), у тому числі селективні інгібітори ЦОГ-2. Зниження гіпотензивного ефекту (пригнічення вазодилатуючих простагландинів нестероїдними протизапальними препаратами і затримка рідини та натрію піразолоновими похідними).

Блокатори кальцієвих каналів (дигідропіридини). Артеріальна гіпотензія, недостатність кровообігу у хворих із латентною або неконтрольованою серцевою недостатністю. Лікування бета-адреноблокаторами може мінімізувати рефлекторні симпатичні механізми, які запускаються при надмірних гемодинамічних реакціях.

Антидепресанти, споріднені з іміпраміном, нейролептики. Посилення гіпотензивного ефекту та ризик ортостатичної гіпотензії (адитивна дія).

Мефлохін. Ризик брадикардії (адитивна дія відносно розвитку брадикардії).

Дипіридабол (внутрішньовенно). Посилення антигіпертензивного ефекту.

Альфа-блокатори, які застосовуються в урології (альфузозин, доксазозин, празозин, тамсулозин, теразозин). Посилення антигіпертензивного ефекту. Підвищений ризик ортостатичної гіпотензії.

Аміфостин. Посилення антигіпертензивного ефекту.

Серцеві глікозиди. Комбінація яка може подовжувати час атріовентрикулярної провідності та спричиняти брадикардію.

Фінголімод. Одночасне застосування фінголімоду з бета-блокаторами може потенціювати брадикардичний ефект і тому ця комбінація не рекомендована. У випадку необхідності одночасного застосування потрібен відповідний моніторинг з моменту початку лікування, рекомендовано щонайменше проводити нічний моніторинг.

Йодовмісні контрастні речовини. У випадку виникнення шоку або артеріальної гіпотензії на введення водовмісних контрастних речовин, бета-блокатори спричиняють зниження серцево-судинних компенсаторних реакцій.

Коли можливо, лікування бета-блокаторами треба зупинити перед проведенням радіографічного дослідження. Якщо застосування є необхідним, лікар повинен мати можливості проведення інтенсивної терапії.

Кортикостероїди та тетракозактид. Зниження антигіпертензивного ефекту (затримка води та натрію в комбінації з кортикостероїдами).

Особливості застосування.

Ніколи не слід раптово припиняти лікування препаратом у хворих зі стенокардією: різке припинення прийому препарату може призвести до серйозних порушень серцевого ритму, інфаркту міокарда або раптового летального наслідку.

Запобіжні заходи при застосуванні. Відміна препарату. Лікування препаратом не слід припиняти раптово, особливо для хворих на ішемічну хворобу серця. Дозу необхідно знижувати поступово, протягом 1-2 тижнів, а при необхідності можна одночасно розпочати замісну терапію, щоб уникнути прогресування стенокардії.

Бронхіальна астма та хронічне обструктивне захворювання легень. Бета-адреноблокатори можна призначати тільки хворим із помірним ступенем тяжкості захворювання, з вибором селективного бета-адреноблокатора у низькій початковій дозі. Перед початком лікування рекомендується провести оцінку дихальної функції.

При розвитку нападів під час лікування можна застосовувати бронходилататори (бета₂-адреноміметики).

Серцева недостатність. Для лікування хворих із нерезфрактерною серцевою недостатністю Бетак при необхідності можна застосовувати під ретельним медичним наглядом у низьких дозах, які поступово підвищуються.

Брадикардія. Дозу необхідно зменшити, якщо частота серцевих скорочень у стані спокою

нижче 50-55 ударів за хвилину та у хворого є клінічні прояви брадикардії.

Атріовентрикулярна блокада I ступеня. Враховуючи негативний дромотропний ефект бета-блокаторів, Бетак з обережністю слід призначати пацієнтам з атріовентрикулярною блокадою I ступеня.

Стенокардія Принцметала. Кількість і тривалість нападів стенокардії можуть збільшитися при застосуванні бета-блокаторів у хворих на стенокардію Принцметала. Застосування препарату можливе при захворюванні помірного ступеня тяжкості та за умови, що лікування проводити одночасно із застосуванням судинорозширювальних засобів.

Порушення периферичного кровообігу. Бета-адреноблокатори можуть призводити до погіршення стану хворих із порушеннями периферичного кровообігу (хвороба Рейно або синдром Рейно, артеріїт або хронічні облітеруючі захворювання артерій нижніх кінцівок). У таких випадках рекомендується застосовувати кардіоселективний бета-блокатор із наявністю властивостей часткового агоніста бета-рецепторів; призначати його слід з обережністю.

Феохромоцитома. При застосуванні бета-адреноблокаторів для лікування артеріальної гіпертензії, спричиненої феохромоцитомою, потрібний ретельний моніторинг артеріального тиску.

Пацієнти літнього віку. У пацієнтів літнього віку обов'язковою є строга відповідність згідно з протипоказаннями. Потрібно бути обережними: лікування пацієнтів літнього віку слід розпочинати з малої дози та під ретельним наглядом (див. розділ «Спосіб застосування та дози»).

Хворі з нирковою недостатністю. Для хворих із нирковою недостатністю дозування необхідно коригувати залежно від концентрації креатиніну у крові або кліренсу креатиніну (див. розділ «Спосіб застосування та дози»).

Хворі на цукровий діабет. Слід попередити хворого про необхідність посилити самоконтроль рівня глюкози у крові на початку лікування. Продромальні симптоми гіпоглікемії можуть бути замаскованими, особливо тахікардія, відчуття серцебиття та підвищена пітливість (див. розділи «Взаємодія з іншими лікарськими засобами» та «Побічні реакції»).

Псоріаз. Призначення препарату потребує ретельної оцінки необхідності його застосування, оскільки є повідомлення про погіршення стану хворих на псоріаз під час лікування бета-адреноблокаторами (див. розділ «Побічні реакції»).

Алергічні реакції. У пацієнтів, схильних до тяжких анафілактичних реакцій, особливо пов'язаних із застосуванням флоктафеніну (див. розділ «Взаємодія з іншими лікарськими засобами»), або при проведенні десенсибілізації терапія бета-адреноблокаторами може призвести до подальшого посилення реакції і зниження ефективності лікування цього стану звичайними дозами адреналіну.

Загальна анестезія. Бета-блокатори спричиняють ослаблення рефлекторної тахікардії та збільшують ризик артеріальної гіпотензії. Продовження лікування бета-блокаторами знижує ризик розвитку аритмії, міокардальної ішемії та гіпертонічних кризів. Необхідно повідомити анестезіолога про те, що хворий проходить лікування бета-блокатором.

При необхідності припинення лікування та відміни препарату вважається достатнім 48 годин для відновлення чутливості до катехоламінів.

Терапію бета-адреноблокаторами не слід припиняти:

- у хворих із коронарною недостатністю, яким бажано приймати препарат до операції, враховуючи ризик, пов'язаний з раптовою відміною бета-адреноблокаторів;
- у разі ургентних операцій або у випадках, коли припинення лікування неможливе. Хворого потрібно захистити від наслідків збудження блукаючого нерва, призначаючи премедикацію атропіном, з повторенням при необхідності. Для анестезії необхідно застосовувати засоби, які пригнічують міокард найменшою мірою, а втрата крові має бути компенсована.

Необхідно враховувати ризик розвитку анафілактичних реакцій.

Офтальмологія. Блокада бета-адренорецепторів зумовлює зниження внутрішньоочного тиску та може призводити до зміни результатів скринінгового дослідження на глаукому. Офтальмолог має бути інформований про те, що пацієнт приймає бетаксол. За пацієнтами, які отримують бета-блокатори і системно, й у вигляді очних крапель, необхідно встановити нагляд, враховуючи можливий адитивний ефект цих препаратів.

Тиреотоксикоз. Бета-блокатори маскують серцево-судинні симптоми тиреотоксикозу.

Спортсмени. Спортсмени повинні враховувати, що препарат містить активну субстанцію, яка може давати позитивну реакцію при проведенні тестів антидопінгового контролю.

Препарат містить лактозу, тому його протипоказано застосовувати пацієнтам із рідкісними спадковими формами непереносимості галактози, недостатністю лактази або синдромом глюкозо-галактозної мальабсорбції.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Вагітність.

Тератогенний аспект. Дотепер немає повідомлень про тератогенні ефекти у людей.

Неонатальний аспект. Дія бета-адреноблокатора зберігається протягом декількох днів після народження у дітей, матері яких отримували лікування даним лікарським засобом. Хоча даний залишковий ефект може не мати клінічних наслідків, тим не менше зберігається можливість розвитку серцевої недостатності. У такому разі новонародженого необхідно помістити у відділення інтенсивної терапії (див. розділ «Передозування»), а також слід уникати застосування плазмозамінників (через ризик розвитку гострого набряку легень). Також є повідомлення про випадки розвитку брадикардії, респіраторного дистрес-синдрому і гіпоглікемії. У зв'язку з цим рекомендується ретельний нагляд за новонародженим у спеціалізованих умовах (контроль частоти серцевих скорочень та рівня глюкози в крові протягом перших 3-5 днів життя).

У зв'язку з цим застосування бетаксолу у період вагітності не рекомендується, за винятком випадків, коли користь від застосування препарату переважає можливі ризики.

Годування груддю.

Бета-адреноблокатори проникають у грудне молоко. Годування груддю у період лікування препаратом Бетак слід припинити, оскільки ризик розвитку гіпоглікемії або брадикардії у новонароджених не досліджували.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

Досліджень з вивчення впливу бетаксололу на здатність керувати автотранспортом не проводили. При керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами необхідно враховувати, що на тлі прийому цього препарату іноді можуть виникати запаморочення, порушення гостроти зору та інші побічні реакції, що може негативно вплинути на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

Спосіб застосування та дози.

Звичайна доза при артеріальній гіпертензії та для профілактики нападів стенокардії напруження – 1 таблетка по 20 мг на добу.

Дозування для хворих із нирковою недостатністю. У хворих із нирковою недостатністю кліренс бетаксололу зменшується зі зниженням функцій нирок.

Дозу необхідно адаптувати до стану функцій нирок хворого: при кліренсі креатиніну ≥ 20 мл/хв корекція дози не потрібна. Однак рекомендується проводити клінічний нагляд, починаючи з 1-го тижня лікування до досягнення рівноважних рівнів препарату у крові (у середньому 4 доби).

Для хворих із тяжкою нирковою недостатністю (кліренс креатиніну < 20 мл/хв) рекомендована початкова доза становить 10 мг на добу (незалежно від частоти та розкладу процедур діалізу у хворих, яким проводиться гемодіаліз).

Для хворих із печінковою недостатністю немає необхідності коригувати дозу; однак на початку терапії бажаний клінічний нагляд.

Діти.

Безпека та ефективність застосування препарату дітям не встановлені, тому застосовування його цій категорії пацієнтів протипоказане.

Передозування.

Симптоми передозування препарату: брадикардія або надмірне зниження артеріального тиску.

При брадикардії або надмірному зниженні артеріального тиску необхідно ввести

- 1-2 мг атропіну внутрішньовенно;
- 1 мг глюкагону (введення препарату повторювати при необхідності);
- при необхідності проводити повільну інфузію 25 мкг ізопреналіну або вводити 2,5-10 мкг/кг/хв добутаміну.

При серцевій декомпенсації у новонароджених, матері яких у період вагітності застосовували бета-адреноблокатори:

- глюкагон у дозі 0,3 мг/кг маси тіла;
- госпіталізація у відділення інтенсивної терапії;
- ізопреналін і добутамін: зазвичай у досить високих дозах і тривалий час, під наглядом спеціаліста.

Побічні реакції.

З боку шкіри та підшкірної клітковини: шкірні реакції, включаючи псоріазоподібні висипання або загострення псоріазу (див. розділ «Особливості застосування»), кропив'янка, свербіж, гіпергідроз.

З боку нервової системи: запаморочення, головний біль, дистальна парестезія, летаргія.

З боку органів зору: відчуття сухості в очах, порушення гостроти зору.

Психічні розлади: астенія, безсоння, втома, депресія, нічні кошмари, сплутаність свідомості, галюцинації.

З боку травної системи: шлунково-кишкові розлади (біль у животі, діарея, нудота та блювання).

Метаболічні розлади: гіпоглікемія, гіперглікемія, брадикардія (можливо, тяжка), уповільнення атріовентрикулярної провідності або посилення існуючої атріовентрикулярної блокади, серцева недостатність, зниження артеріального тиску.

З боку судин: похолодання кінцівок, синдром Рейно, погіршення переміжної кульгавості.

Розлади з боку респіраторної системи, грудної клітки та середостіння: бронхоспазм, диспное.

З боку репродуктивної системи: імпотенція.

Лабораторні показники: рідко спостерігається поява антинуклеарних антитіл, яка тільки у виняткових випадках супроводжувалася клінічними проявами типу системного червоного вовчака, що минали після припинення лікування.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання.

Зберігати при температурі не вище 25 °C в оригінальній упаковці в недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 10 таблеток по 10 мг, 20 мг у блістері. По 3 блістери у картонній коробці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник.

Медокемі ЛТД (Центральний Завод)/

Medochemie LTD (Central Factory).

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

1-10, вул. Константинополес, Лімассол, 3011, Кіпр/

1-10 Constantinoupoleos Street, Limassol, 3011, Cyprus.