БЕТАК

Инструкция по медицинскому применению препарата

Регистрационный номер: _____

Торговое название препарата: БЕТАК (BETAC)

Международное непатентованное название: Бетаксолол (Betaxolol)

Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Состав: каждая таблетка содержит:
активное вещество – бетаксолола гидрохлорид 20 мг и
вспомогательные вещества – целлюлоза микрокристаллическая, лактозы моногидрат, карбоксиметилкрахмал натрия, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат, поливиниловый спирт, титана диоксид Е171, лецитин, камедь ксантановая, тальк очищенный.

Описание: белые или почти белые, круглые двояковыпуклые, покрытые пленочной оболочкой таблетки с риской на одной стороне.

Фармакотерапевтическая группа: бета$_1$ – адреноблокатор

Код АТХ: C07AB05

Фармакологическое действие

Фармакодинамика

Бетак – кардиоселективный бета$_1$-адреноблокатор без внутренней симпатомиметической активности. Обладает слабой мембраностабилизирующей активностью. Оказывает гипотензивное действие, связанное со снижением минутного объема сердца и уменьшением симпатической стимуляции периферических сосудов. При применении в терапевтических дозах бетаксолол не оказывает выраженного кардиодепрессивного действия, не влияет на обмен глюкозы, не уменьшает бронхорасширяющего действия бета-адреномиметиков, не вызывает задержки натрия и воды в организме. Действие препарата начинается через 1 – 2 ч, длительность действия – 24 ч.

Фармакокинетика

Абсорбция из желудочно-кишечного тракта составляет 100 %. Биодоступность – 78 – 90 %, пища не влияет на скорость и объем абсорбции. После перорального приема максимальная концентрация бетаксолола в крови достигается через 2 – 4 час. Стабильная концентрация отмечается после 5 – 7 дневного приема препарата. Терапевтическая концентрация составляет 0,005 – 0,05 мкг/мл. Связь с белками плазмы крови составляет 50 – 60 %. Объем распределения – от 4,0 до 13,01 л /кг.

Активно метаболизируется в печени, метаболиты – не активны.

Проницаемость через гематоэнцефалический и плацентарный барьеры низкая. Бетаксолол проникает в грудное молоко, что следует учитывать в случае назначения препарата в период лактации.

Период полувыведения составляет 14 – 22 ч. Выводится почками до 80 % (15 % в неизмененном виде). Почечный клиренс составляет 0,2 – 0,34 л/кг/час. Период полувыведения при нарушении функции печени удлиняется на 33 %, но клиренс не изменяется; при нарушении функции почек период полувыведения увеличивается в среднем вдвое, что требует снижения дозы.

Показания к применению

Артериальная гипертензия.

Профилактика приступов стабильной стенокардии.

Противопоказания

– Повышенная чувствительность к бетаксололу и другим компонентам препарата.
– Хроническая сердечная недостаточность II – III степени.
– Острая сердечная недостаточность.
– Кардиогенный шок.
– Атриовентрикулярная блокада II – III степени.
– Синоатриальная блокада.
– Синдром слабости синусового узла.
– Выраженная брадикардия (частота сердечных сокращений (ЧСС) менее 40 уд/мин.).
– Стенокардия Принцметала.
– Кардиомегалия (без признаков сердечной недостаточности).
– Артериальная гипотензия (в случае использования при инфаркте миокарда).
– Одновременный прием ингибиторов моноаминооксидазы (МАО).
– Комбинированная терапия с сультопридом и флоктафенином,
– Возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).
– Врожденная галактоземия, синдром мальабсорбции глюкозы / галактозы или дефицита лактазы (препарат содержит лактозу).

С осторожностью

Больным с отягощенным аллергологическим анамнезом, хронической обструктивной болезнью легких, бронхиальной астмой, эмфиземой (в т.ч. легких), сахарным диабетом, метаболическим ацидозом, хронической сердечной недостаточностью, облитерирующим заболеванием периферических сосудов («перемежающаяся» хромота, синдром Рейно),

печеночной недостаточностью, хронической почечной недостаточностью, миастенией, тиреотоксикозом, депрессией (в т.ч. в анамнезе), псориазом, атриовентрикулярной блокадой I степени, феохромоцитомой, при беременности и пожилом возрасте.

Применение при беременности и в период лактации

Во время беременности следует применять препарат с осторожностью и только в том случае, если польза для матери превышает риск развития побочных эффектов у плода и/или ребенка. Бета-адреноблокаторы проникают в грудное молоко. Риск гипогликемии или брадикардии не исследовался, поэтому кормление грудью в период лечения необходимо прекратить.

Способ применения и дозы

Применение при артериальной гипертензии и для профилактики приступов стабильной стенокардии: Бетак принимают 1 раз в день, независимо от приема пищи, запивая водой.

Начальная доза составляет 10 мг (½ таблетки) в сутки. При необходимости дозу увеличивают до 20 мг в сутки через 1 – 2 недели. Препарат применяют под контролем частоты сердечных сокращений (ЧСС). При развитии брадикардии дозу снижают или отменяют препарат. Гипотензивный эффект наступает через 2 – 5 дней, стабильное действие развивается через 1 – 2 мес.

У больных с нарушенной функцией почек (клиренс креатинина менее 20 мл/мин), при хроническом гемодиализе начальная доза препарата составляет 5 мг/сутки. При необходимости дозу повышают каждые 2 недели на 5 мг до максимально рекомендованной суточной дозы – 20 мг.

У больных с печеночной недостаточностью изменение дозы обычно не требуется. Однако, в начале терапии рекомендуется более тщательное клиническое наблюдение за больным.

У больных пожилого возраста начальная доза Бетака – 5 мг в сутки.

Побочное действие

Со стороны сердечно-сосудистой системы: синусовая брадикардия, сердцебиение, ортостатическая гипотензия, нарушение проводимости миокарда, атриовентрикулярная блокада (вплоть до остановки сердца), аритмии, ослабление сократимости миокарда, развитие (или усугубление) симптомов сердечной недостаточности (отечность лодыжек, стоп, голеней), выраженное снижение артериального давления, проявление ангиоспазма (снижение периферического кровообращения, похолодание нижних конечностей, синдром Рейно), боль в груди.

Со стороны эндокринной системы: гипергликемия (у больных инсулиннезависимым сахарным диабетом), гипогликемия (у больных, получающих инсулин), гипотиреоидное состояние.

Со стороны дыхательной системы: заложенность носа, затруднение дыхания при приеме в высоких дозах, у предрасположенных пациентов – ларинго- и бронхоспазм.

Аллергические реакции: кожный зуд, сыпь, крапивница

Со стороны кожных покровов: гиперемия кожи, экзантема, обострение симптомов псориаза, усиление потоотделения.

Со стороны центральной нервной системы: повышенная утомляемость, слабость, головокружение, головная боль, сонливость, бессонница, ночные кошмары, депрессия, беспокойство, спутанность сознания или кратковременная потеря памяти, галлюцинации, астенический синдром, мышечная слабость, парестезии в конечностях (при перемежающейся хромоте, синдроме Рейно), тремор.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, реже рвота, диарея или запор, боль в животе, нарушения функции печени (темная моча, желтушность склер или кожи, холестаз), изменение вкуса, сухость слизистой оболочки полости рта.

Со стороны органа чувств: нарушение зрения, уменьшение секреции слезной железы, сухость и болезненность глаз, конъюнктивит.

Со стороны органов кроветворения: лейкопения, тромбоцитопения, агранулоцитоз.

Влияние на плод: внутриутробная задержка роста, гипогликемия, брадикардия.

Прочие: боль в спине, артралгия, ослабление либидо, снижение потенции, синдром «отмены» (усиление приступов стенокардии, повышение артериального давления).

Лабораторные показатели: изменение активности печеночных ферментов (аспартатаминотрансферазы и аланинаминотрансферазы), уровня билирубина. В редких случаях наблюдается появление антинуклеарных антител, которое только в исключительных случаях сопровождается клиническими проявлениями типа системной красной волчанки, проходящими при прекращении лечения.

Передозировка

Симптомы: выраженная брадикардия, головокружение, атриовентрикулярная блокада, выраженное снижение артериального давления, обморок, аритмии, желудочковая экстрасистолия, сердечная недостаточность, бронхоспазм, судороги, цианоз ногтей пальцев или ладоней.

Лечение: промывание желудка и назначение адсорбирующих лекарственных средств; симптоматическая терапия: при атриовентрикулярной блокаде показано внутривенное введение 1 – 2 мг атропина, эпинефрина или постановка временного кардиостимулятора; при артериальной гипотензии, если нет признаков отека легких, рекомендуется внутривенная капельная инфузия плазмозаменителей, при неэффективности – введение эпинефрина, допамина, добутамина; при бронхоспазме применяются ингаляционные

бета$_2$-адреномиметики; при судорогах – внутривенно вводится диазепам; при желудочковой экстрасистолии – лидокаин (препараты 1А класса не применяются); при сердечной недостаточности – сердечные гликозиды, диуретики, глюкагон.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Бетаксолол замедляет выведение *лидокаина* и *ксантинов* (кроме *дифиллина*) и повышает их концентрацию в плазме крови, особенно у больных с исходно повышенным клиренсом теофиллина под влиянием курения.

Нестероидные противовоспалительные препараты ослабляют гипотензивный эффект за счет задержки натрия и воды и ингибирования синтеза простагландинов в почках.

Глюкокортикостероиды и *эстрогены* снижают гипотензивный эффект за счет задержки натрия.

Одновременное применение *фенотиазинов* с бетаксололом приводит к повышению концентрации каждого из препаратов в плазме крови.

Сердечные гликозиды, *метилдопа*, *резерпин* и *гуанфацин*, *амиодарон*, *блокаторы «медленных» кальциевых каналов* (*верапамил*, *дилтиазем*) и другие антиаритмические лекарственные средства повышают риск развития или усугубляют брадикардию, вероятность развития атриовентрикулярной блокады, остановки сердца и сердечной недостаточности.

Одновременное применение бетаксолола, *инсулина и пероральных гипогликемических лекарственных средств* маскирует симптомы развивающейся гипогликемии (тахикардию, повышение АД) и изменяет эффективность последних.

Бетаксолол не рекомендуется назначать одновременно с *ингибиторами МАО* вследствие значительного усиления гипотензивного действия. Перерыв в лечении между приемами этих препаратов должен составлять не менее 14 дней.

Фенитоин при внутривенном введении, средства для ингаляционной общей анестезии (производные углеводородов) повышают выраженность кардиодепрессивного действия и вероятность развития артериальной гипотензии.

Бетаксолол удлиняет действие недеполяризующих *миорелаксантов* и антикоагулянтный эффект *кумаринов*.

Диуретики, *клонидин*, *симпатолитики*, *гидралазин* и другие гипотензивные средства могут вызвать чрезмерное снижение АД.

Три- и тетрациклические антидепрессанты, *нейролептики*, *этанол*, седативные и снотворные лекарственные средства усиливают угнетение ЦНС.

Негидрированные алкалоиды спорыньи повышают риск развития нарушений периферического кровообращения.

Аллергены, используемые для иммунотерапии, или экстракты аллергенов для кожных проб повышают риск возникновения тяжелых аллергических реакций или анафилаксии у больных, получающих бетаксолол.

Нифедипин может приводить к значительному снижению АД.

Йодсодержащие рентгеноконтрастные лекарственные средства для внутривенного введения повышают риск развития анафилактических реакций.

Особые указания

Так как исследований по изучению эффективности и переносимости бетаксолола у детей не проводилось, не рекомендуется его использование в педиатрии.

При приеме препарата должен проводиться контроль ЧСС и АД – в начале лечения ежедневно и затем 1 раз в 3 – 4 мес., содержанием глюкозы в крови у больных сахарным диабетом (1 раз в 4 – 5 мес.) У пожилых пациентов должен проводиться контроль функции почек (1 раз в 4 – 5 мес.)

Следует обучить больного методике подсчета ЧСС и проинструктировать о необходимости врачебной консультации при ЧСС менее 50 уд./мин.

У больных пожилого возраста, в случае появления нарастающей брадикардии (менее 50 уд./мин.), артериальной гипотензии (АД ниже 100 мм.рт.ст.), атриовентрикулярной блокады, бронхоспазма, желудочковых аритмий, тяжелых нарушений функции печени и почек необходимо снизить дозу или прекратить лечение.

Лечение не следует прекращать резко, особенно у больных ишемической болезнью сердца. Дозу следует уменьшать постепенно, то есть в течение 1 – 2 недель, и в случае необходимости можно одновременно начинать заместительную терапию, чтобы избежать прогрессирования стенокардии.

При одновременном применении с инсулином и пероральными гипогликемическими средствами бетаксолол может маскировать симптомы гипогликемии (например, тахикардию).

Препараты, снижающие запасы катехоламинов (например, резерпин), могут усиливать действие бета-адреноблокаторов. Больные, принимающие такие препараты, должны находиться под постоянным контролем врача на предмет выявления артериальной гипотензии или брадикардии.

Больным с бронхолегочными заболеваниями можно назначать кардиоселективные бета-адреноблокаторы в случае непереносимости и/или неэффективности других гипотензивных препаратов, но при этом следует строго следить за дозировкой, т.к. передозировка опасна развитием бронхоспазма.

Бронхиальная астма и хроническая обструктивная болезнь легких: бета-адреноблокаторы могут назначаться только больным с умеренной степенью тяжести заболевания, с выбором селективного бета-адреноблокатора в низкой начальной дозе. Перед началом лечения рекомендуется провести оценку функции дыхания. При развитии приступов во время лечения могут использоваться бронходилататоры – β_2-адреномиметики.

Больные, использующие контактные линзы, должны учитывать, что на фоне лечения возможно уменьшение продукции слезной жидкости.

При развитии депрессии, вызванной приемом бета-адреноблокаторов, рекомендуется прекратить терапию. При прекращении терапии дозу препарата рекомендуется снижать постепенно (на ¼ каждые 3 – 4 дня) в течение 1 – 2 недель во избежание возникновения синдрома «отмены».

В случае необходимости проведения планового хирургического лечения отмену препарата проводят за 48 ч до начала общей анестезии. Врачу-анестезиологу следует сообщить о том, что пациент получал лечение бета-адреноблокаторами. Если больной принял препарат перед хирургическим вмешательством, ему следует подбирать препарат для общей анестезии с минимальным отрицательным инотропным действием.

При тиреотоксикозе бетаксолол может замаскировать определенные клинические признаки заболевания (например, тахикардию). Резкая отмена препарата у таких больных может привести к усилению симптоматики.

При сахарном диабете прием бетаксолола может замаскировать тахикардию, вызванную гипогликемией. В отличие от неселективных бета-адреноблокаторов, бетаксолол практически не усиливает вызванную инсулином гипогликемию и не задерживает восстановление концентрации глюкозы в крови до нормального уровня.

При одновременном приеме с клонидином отмена клонидина должна проводиться через несколько дней после отмены Бетака.

При отягощенном аллергологическом анамнезе возможно усиление выраженности реакции повышенной чувствительности и отсутствие эффекта от обычно рекомендуемых доз эпинефрина.

Следует отменить Бетак перед исследованием содержания в крови и моче катехоламинов, норметанефрина и ванилилминдальной кислоты, титров антинуклеарных антител.

На время лечения исключить употребление этанола.

У «курильщиков» эффективность бета-адреноблокаторов ниже.

У новорожденных, матери которых лечились бета-адреноблокаторами, действие последних сохраняется на протяжении нескольких дней после рождения. Хотя данный

остаточный эффект может не иметь клинических последствий, тем не менее возможно развитие порока сердца, требующего интенсивной терапии новорожденного (см. раздел Передозировка). В такой ситуации следует избегать введения увеличивающих объем крови растворов (риск развития отека легких).

Также имеются сообщения о брадикардии, респираторном дистресс-синдроме и гипогликемии, поэтому рекомендуется тщательное наблюдение за новорожденными в специализированных условиях (контроль ЧСС, уровня глюкозы в крови в течение первых 3 – 5 дней жизни).

Спортсмены должны учитывать, что препарат содержит активную субстанцию, которая может давать положительную реакцию при проведении тестов допингового контроля.

С осторожностью применяют Бетак у пациентов, деятельность которых требует повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, по 20 мг.

По 10 таблеток в блистер из ПВХ / алюминиевой фольги.

По 3 блистера с инструкцией по применению помещают в картонную пачку.

Условия хранения

Хранить в сухом, защищенном от света месте при температуре до 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года. Не использовать после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Производитель: «Медокеми Лтд.»
Кипр, 1409, Лимассол, ул. Константинопель, 1 – 10
Тел/факс. 8-10-357-25-560-863.
Претензии потребителя направлять в адрес Представительства в Москве:
107045 Москва, Сретенский бульвар, 5, а/я 81.
Тел. (495) 222-46-03

И.о. Директора ИДКЭ [illegible] А.Н.Васильев

Глава Представительства
«Медокеми Лтд.» в РФ З.В.Береснева