

ІНСТРУКЦІЯ для медичного застосування препарату

БЕТАКОР (BETACOR)

Склад:

діюча речовина: бетаксоліл;

1 таблетка містить бетаксолілу гідрохлориду 20 мг;

допоміжні речовини: лактози моногідрат, целюлоза мікрокристалічна, натрію крохмальгліколят (тип А), кремнію діоксид колоїдний безводний, магнію стеарат, суміш для плівкового покриття Opadry II White.

Лікарська форма. Таблетки, вкриті плівковою оболонкою.

Фармакотерапевтична група. Селективний блокатор бета-адренорецепторів. Бетаксоліл.
Код АТС С07А В05.

Клінічні характеристики.

Показання. Артеріальна гіпертензія. Профілактика нападів стенокардії напруження.

Протипоказання.

- Тяжкі форми бронхіальної астми та хронічних обструктивних захворювань легень;
- декопенсована серцева недостатність;
- кардіогенний шок;
- АВ-блокада II-III ступенів 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;
- анафілактичні реакції в анамнезі;
- метаболічний ацидоз;
- підвищена індивідуальна чутливість до компонентів препарату.

Препарат протипоказаний для застосування у комбінації з флоктафеніном та сультопридом. Застосування препарату не рекомендується у комбінації з аміодароном, бепридиллом, дилтіаземом і верапамілом (див. розділ «Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій»).

Спосіб застосування та дози.

Звичайна доза – 1 таблетка по 20 мг на добу при артеріальній гіпертензії та для профілактики нападів стенокардії напруження. Максимальна рекомендована доза становить 40 мг на добу.

Дозування для хворих із нирковою недостатністю. У хворих із нирковою недостатністю кліренс бетаксолілу зменшується зі зниженням ниркової функції. Дозу необхідно адаптувати до стану ниркової функції хворого: при кліренсі креатиніну 20 мл/хв корекція дози не потрібна. Однак рекомендується проводити клінічне спостереження, розпочинаючи 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 недостатністю функції печінки немає необхідності коригувати дозу; однак на початку терапії бажане клінічне спостереження.

Побічні реакції.

З боку серцево-судинної системи та крові: брадикардія, відчуття серцебиття, AV-блокада, артеріальна гіпотензія, вазоспастична стенокардія, інфаркт міокарда, серцева недостатність, загострення переміжної кульгавості, тромбоз, анемія, лейкоцитоз, тромбоцитопенія, пурпура.

З боку нервової системи і органів чуття: астенія, головний біль, запаморочення, сонливість, безсоння, неспокій, депресія, порушення концентрації уваги, синкопе, ступор, галюцинації, амнезія, емоційна лабільність, розлади чутливості, парестезії, невралгія, нейропатія, біль і шум у вухах, вестибулярні порушення, часткова втрата слуху, тремор, сплутаність свідомості, пере-міжна кульгавість.

З боку травного тракту: диспепсія, діарея, нудота, сухість у роті, анорексія, дисфагія, блювання, запор, біль у животі, гепатити.

З боку сечостатевої системи: імпотенція, дизурія, олігурія, протеїнурія, набряки, цистит, ниркова коліка, зниження лібідо, порушення менструального циклу, біль і фіброзно-кістозні зміни молочної залози, простатит, хвороба Пейроні.

З боку респіраторної системи: диспное, біль у грудній клітці, фарингіт, риніт, синусит, кашель, задишка, бронхоспазм, дихальна недостатність.

З боку опорно-рухового апарату: артралгія, тендиніт, міалгія.

З боку шкіри: алопеція, загострення псоріазу, гіпертрихоз, свербіж.

Інші: сухість в очах, порушення гостроти зору, нічні кошмари, підвищення концентрації лак-татдегідрогенази, печінкових трансаміназ, ацидоз, гіперхолестеринемія, гіперглікемія, гіперліпідемія, гіперурикемія, гіпокаліємія, гіпотермія, поява антинуклеарних антитіл, яка у виняткових випадках супроводжувалася клінічними проявами на зразок системного червоного вовчака, що минали після припинення лікування, синдром Рейно, зміни маси тіла, синдром відміни, при підвищеній чутливості до компонентів препарату – алергічні реакції, включаючи шкірний висип, еритему, екзему.

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 повторити при необхідності),
- при необхідності робиться повільна інфузія 25 мкг ізопреналіну або вводиться 2,5-10 мкг/кг/хв добутаміну.

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

- глюкагон із розрахунку 0,3 мг/кг маси тіла,
- госпіталізація у відділення інтенсивної терапії,
- ізопреналін і добутамін: зазвичай у досить високих дозах і тривало, під наглядом спеціаліста.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Не застосовувати у період вагітності.

Бета-адреноблокатори проникають у грудне молоко. Годування груддю на період лікування препаратом слід припинити.

Діти. Застосування препарату дітям протипоказано.

Особливості застосування.

Запобіжні заходи при застосуванні. Відміна препарату. Лікування препаратом не слід припиняти раптово, особливо у 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 легенів. 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 нерефрактерною серцевою недостатністю препарат, 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 за 50-55 ударів за хвилину та у хворого є клінічні прояви брадикардії.

Атріовентрикулярна блокада I-го ступеня. Враховуючи негативний дромotropний ефект бета-блокаторів, препарат з обережністю призначають пацієнтам з атріовентрикулярною блокадою I-го 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 проводиться 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 агоністу бета-рецепторів; призначати його слід з обережністю.

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

Хворі літнього віку. Потрібно бути обережними: лікування пацієнтів літнього віку слід розпочинати з малої дози та під ретельним наглядом.

Загальна анестезія. Бета-блокатори викликають 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.

Терапія бета-адреноблокаторами не повинна припинятися:

- 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 тих 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 обумовлює зниження внутрішньоочного тиску та може призводити до зміни результатів скринінгового дослідження на глаукому. Офтальмолога слід проінформувати про те, що пацієнт приймає бетаксол. За пацієнтами, які отримують бета-блокатори і системно, і 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.

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.

Псоріаз. Призначення препарату потребує ретельної оцінки необхідності його застосування, оскільки є повідомлення про погіршення стану хворих на псоріаз під час лікування бета-адрено-блокаторами.

Алергічні реакції. У пацієнтів, схильних до тяжких анафілактичних реакцій, особливо пов'язаних із застосуванням флоктафеніну, або при проведенні десенсибілізації терапія бета-адреноблокаторами може призвести до подальшого посилення реакцій і зниження ефективності лікування цього стану звичайними дозами адреналіну.

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

На період терапії рекомендується виключити вживання алкоголю.

Необхідно враховувати, що під час лікування можлива зміна результатів лабораторних досліджень (хибнопозитивна реакція при проведенні аналізу на допінг, зростання титру антинук-леарних антитіл тощо).

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

Дослідження з вивчення впливу бетаксолулу на здатність керувати автотранспортом не проводилися. При керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами необхідно враховувати, що на фоні прийому цього препарату іноді можуть виникати запаморочення або підвищена втомлюваність.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Брадикардія може бути обумовлена 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 холін естерази, які застосовуються для лікування хвороби Альцгеймера.

Протипоказане одночасне застосування препарату 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 із зазначеними нижче препаратами.

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

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

Слід з обережністю застосовувати препарат 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 бета-стимуляторами). 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 миготливу аритмію (крім сультоприду).

Антиаритмічні препарати класу Ia (хінідин, гідрохінідин і дизопірамід) і класу III (аміодарон, дофетилід, ібутилід, соталол); деякі нейролептики групи фенотіазину (хлорпромазин, ціамемазин, левомепромазин, тіорідазин), 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 фібриляції шлуночків (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. Пацієнта слід попередити про необхідність посилити самоконтроль рівня цукру у крові.

Інгібітори холінестерази (амбеноміум, 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, що потребують особливої уваги.

Нестероїдні протизапальні препарати (системно), у тому числі селективні інгібітори ЦОГ-2. Зниження гіпотензивного ефекту (пригнічення вазодилатуючих простагландинів не-стероїдними 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).

Дипіридамол (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.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Кардіоселективний бета₁-адреноблокатор без внутрішньої симпатоміметичної активності з незначною мембраностабілізуючою дією. Бетаксолोल характеризується трьома фармакологічними властивостями:

- кардіоселективною бета-блокуючою дією;
- відсутністю часткової агоністичної активності (тобто не виявляє власної симпатоміметичної дії);
- 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. Бетаксолोल зв'язується з білками плазми крові приблизно на 50 %.

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

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

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості: таблетки круглої форми з двоопуклою поверхнею з рискою, вкриті плівковою оболонкою білого або майже білого кольору.

Термін придатності. 4 роки.

Умови зберігання.

Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Упаковка.

По 10 таблеток у блістері; по 3 блістери у пачці.

Виробник.

ПАТ «Київський вітамінний завод».

Місцезнаходження.

Україна, 04073, м. Київ, вул. Копилівська, 38.

Web-сайт: www.vitamin.com.ua