

CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

SPRAWDZONO
POD WZGLĘDEM
TERYTORIYCZNYM
2013-07-11

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

Betaxolol PMCS, 20 mg, tabletki

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

Każda tabletką zawiera 20 mg betaksololu chlorowodorku.

Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Tabletka.

Prawie biała, okrągła, obustronnie wypukła tabletką o średnicy 8 mm, z linią podziału po jednej stronie. Tabletkę można podzielić na równe dawki.

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1 Wskazania do stosowania

Leczenie nadciśnienia tętniczego.

Leczenie profilaktyczne dławicy piersiowej wysiłkowej stabilnej.

Produkt wskazany jest do leczenia dorosłych pacjentów.

4.2 Dawkowanie i sposób podawania

Dawkowanie

Dorośli

Nadciśnienie tętnicze

W leczeniu łagodnego nadciśnienia tętniczego dawka początkowa wynosi 10 mg raz na dobę. Jeśli działanie jest niewystarczające, dawkę można zwiększyć do 20 mg na dobę.

W leczeniu ciężkiego nadciśnienia tętniczego zwykła dawka wynosi 20 mg raz na dobę.

Dławica piersiowa wysiłkowa stabilna

Dawkę należy dostosować indywidualnie dla każdego pacjenta. Dawka początkowa wynosi 10 mg na dobę. Dawkę można zwiększyć do zwykle stosowanej dawki 20 mg raz na dobę. W niektórych przypadkach konieczne może być zwiększenie dawki dobowej do 40 mg.

Pacjenci z zaburzeniami czynności nerek lub wątroby

- U pacjentów z niewydolnością nerek (klirens kreatyniny większy, niż 20 ml/min) nie ma konieczności dostosowania dawkowania, jednakże zaleca się obserwację kliniczną na początku leczenia, do czasu uzyskania stabilnych stężeń produktu leczniczego w osoczu (średnio 4 dni).

- U pacjentów z ciężkim zaburzeniem czynności nerek (klirens kreatyniny mniejszy, niż 20 ml/min) oraz u pacjentów poddawanych hemodializie lub dializie otrzewnowej nie należy przekraczać dawki 10 mg/dobę.
- U pacjentów z niewydolnością wątroby nie ma konieczności dostosowania dawkowania. Zaleca się uważną kontrolę kliniczną na początku leczenia.

Pacjenci w podeszłym wieku

U pacjentów w podeszłym wieku leczenie należy rozpoczynać ostrożnie od małych dawek oraz ściśle kontrolować stan kliniczny pacjenta (patrz punkt 4.4).

Dzieci i młodzież

Nie ustalono dotąd bezpieczeństwa stosowania i skuteczności betaksololu u dzieci i młodzieży, z tego względu nie zaleca się jego stosowania w tych grupach wiekowych (patrz punkt 4.4).

Sposób podawania

Podanie doustne.

Spożyty równocześnie pokarm oraz jego skład nie wpływają na dostępność biologiczną betaksololu. Produkt należy przyjmować o tej samej porze każdego dnia, najlepiej rano.

4.3 Przeciwwskazania

- nadwrażliwość na substancję czynną lub na którąkolwiek substancję pomocniczą, wymienioną w punkcie 6.1,
- ciężkie postaci astmy oskrzelowej lub przewlekłej, obturacyjnej choroby płuc,
- niewyrównana niewydolność serca,
- wstrząs kardiogeny,
- blok przedsionkowo-komorowy II i III stopnia, z wyjątkiem osób z wszczepionym stymulatorem,
- dławica Prinzmetala (w czystej postaci i jako monoterapia),
- zespół chorego węzła zatokowo-przedsionkowego, w tym blok zatokowo-przedsionkowy,
- ciężka bradykardia (poniżej 45-50 uderzeń na minutę),
- ciężkie postaci choroby Raynauda i zaburzeń tętnic obwodowych,
- nieleczone guz chromochłonny nadnerczy,
- niedociśnienie tętnicze,
- reakcje anafilaktyczne w wywiadzie,
- kwasica metaboliczna,
- jednoczesne stosowanie z floktafenią lub z sultoprydem (patrz punkt 4.5),
- jednoczesne stosowanie z inhibitorami MAO (z wyjątkiem inhibitorów MAO-B)
- dożylnie podawanie antagonistów kanału wapniowego, takich, jak werapamil lub diltiazem i innych leków przeciwaritmicznych (jak dizopiramid lub amiodaron) u pacjentów leczonych betaksololem jest przeciwwskazane. Wyjątkiem jest leczenie w oddziale intensywnej opieki medycznej, gdzie zagwarantowane jest uważne i ciągłe monitorowanie pacjenta (patrz punkt 4.5).

4.4 Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

U pacjentów z dławicą piersiową, nie należy nagle przerwać stosowania produktu, ponieważ może to spowodować ciężkie zaburzenia rytmu serca, zawał mięśnia sercowego lub nagły zgon.

Przerwanie leczenia

Nie należy nagle przerywać leczenia, szczególnie u pacjentów z chorobą niedokrwienną serca. Dawkę należy zmniejszać stopniowo, przez okres 1 do 2 tygodni. Jeżeli jest to konieczne, leczenie innym lekiem przeciwdławicowym należy rozpocząć równocześnie ze zmniejszaniem dawki betaksololu, w celu uniknięcia zaostrzenia dławicy piersiowej.

Astma i przewlekła obturacyjna choroba płuc

Leki hamujące receptory beta-adrenergiczne mogą być podawane tylko w przypadku łagodnych postaci tych chorób. Zaleca się stosowanie kardioselektywnych leków beta-adrenolitycznych w najmniejszych, możliwych dawkach. Przed oraz po rozpoczęciu leczenia lekiem beta-adrenolitycznym zaleca się przeprowadzenie badań czynności płuc.

Jeśli podczas leczenia wystąpi napad astmy można zastosować leki pobudzające receptory beta₂, rozszerzające oskrzela.

Niewydolność serca

U pacjentów ze skompensowaną niewydolnością serca, w razie potrzeby można podawać betaksolol w stopniowo zwiększających się dawkach. Leczenie należy rozpocząć od bardzo małych dawek. Pacjenci powinni znajdować się pod stałą obserwacją lekarza.

Bradykardia

Konieczne jest zmniejszenie dawki betaksololu, jeżeli częstość akcji serca w spoczynku jest mniejsza niż 50-55 uderzeń na minutę oraz jeśli wystąpią objawy bradykardii.

Blok przedsionkowo- komorowy I stopnia

Ze względu na ujemne dromotropowe działanie leków beta-adrenolitycznych należy zachować ostrożność podczas stosowania betaksololu u pacjentów z blokiem przedsionkowo-komorowym I stopnia.

Dławica Prinzmetala

Leki hamujące receptory beta-adrenergiczne mogą zwiększyć częstość i czas trwania napadów u pacjentów z dławicą Prinzmetala. W postaciach łagodnych i mieszanych można stosować kardioselektywne beta-adrenolityki, pod warunkiem, że jednocześnie stosuje się lek rozszerzający naczynia krwionośne.

Zaburzenia tętnic obwodowych

Stosowanie leków beta-adrenolitycznych u pacjentów z chorobami tętnic obwodowych (zespół lub choroba Raynauda, zapalenie tętnic lub przewlekłe niedokrwienie kończyn dolnych) może prowadzić do nasilenia objawów.

Guz chromochłonny nadnerczy

Podczas stosowania leków beta-adrenolitycznych w leczeniu wtórnego nadciśnienia tętniczego spowodowanego leczeniem guza chromochłonnego nadnerczy wymagane jest ściśle monitorowanie ciśnienia tętniczego krwi pacjenta.

Stosowanie u dzieci i młodzieży

Nie ustalono dotąd bezpieczeństwa stosowania i skuteczności betaksololu u dzieci i młodzieży, z tego względu nie zaleca się jego stosowania w tych grupach wiekowych.

Pacjenci w podeszłym wieku

U pacjentów w podeszłym wieku leczenie należy rozpoczynać od małych dawek oraz ściśle kontrolować stan kliniczny pacjenta.

Pacjenci z zaburzeniem czynności nerek

U pacjentów z zaburzeniem czynności nerek dawkowanie należy dostosować do stężenia kreatyniny we krwi lub do klirensu kreatyniny (patrz punkt 4.2).

Pacjenci z cukrzycą

Leki beta-adrenolityczne mogą maskować niektóre objawy hipoglikemii, szczególnie tachykardię, kołatanie serca i pocenie się. (patrz punkt 4.5).

Pacjentów należy poinformować o konieczności częstszego kontrolowania stężenia glukozy we krwi, szczególnie na początku leczenia.

Łuszczyca

Należy dokładnie rozważyć korzyści z zastosowania leków beta-adrenolitycznych u pacjentów z łuszczycą lub z łuszczycą w wywiadzie rodzinnym, ponieważ donoszono o nasileniu objawów łuszczycy u pacjentów leczonych lekami beta-adrenolitycznymi.

Reakcje alergiczne

U pacjentów podatnych na występowanie ciężkich reakcji anafilaktycznych, niezależnie od przyczyny, szczególnie po podaniu środków kontrastowych, zawierających jod lub floktafeniny oraz u pacjentów poddawanych terapii odczulającej, leczenie lekiem beta-adrenolitycznym może prowadzić do zaostrzenia reakcji uczuleniowej i oporności na działanie adrenaliny, podawanej w zwykle stosowanych dawkach.

Znieczulenie ogólne

U pacjentów poddawanych znieczuleniu ogólnemu blokada receptorów beta-adrenergicznych zmniejsza częstość występowania zaburzeń rytmu serca oraz niedokrwienia mięśnia sercowego w czasie indukcji i intubacji, a także w okresie pooperacyjnym. Obecnie zaleca się kontynuowanie leczenia lekiem beta-adrenolitycznym w okresie okołoperacyjnym.

Należy poinformować anestezjologa o stosowaniu leku beta-adrenolitycznego, ponieważ potencjalne interakcje z innymi lekami mogą wywołać bradyarytmie, osłabienie odruchowej tachykardii oraz zmniejszenie zdolności odruchowej do kompensacji utraty krwi.

Jeżeli konieczne jest przerwanie leczenia, to uznaje się, że 48 godzin jest wystarczającym okresem na uzyskanie prawidłowej wrażliwości na katecholaminy.

W niektórych przypadkach nie należy przerywać stosowania leku beta-adrenolitycznego:

- u pacjentów z chorobą niedokrwinną serca, ze względu na ryzyko związane z nagłym przerwaniem stosowania leków beta-adrenolitycznych, zaleca się kontynuowanie leczenia aż do czasu operacji;
- w nagłych wypadkach oraz jeśli przerwanie leczenia jest niemożliwe, pacjentów należy chronić przed nadmiernymi reakcjami przywspółczulnymi za pomocą odpowiedniej premedykacji atropiną. W razie konieczności można powtórzyć podanie atropiny,

Okulistka

Blokada beta-adrenergiczna zmniejsza ciśnienie wewnątrzgałkowe i może mieć wpływ na niewłaściwy wynik testu na wykrycie jaskry. Należy poinformować lekarza okulistę o tym, że pacjent jest leczony betaksololem. Należy monitorować pacjentów, u których zastosowano leczenie ogólne i miejscowe, w postaci kropli do oczu, lekami hamującymi receptory beta-adrenergiczne, ze względu na możliwość sumowania się efektów leczenia.

Nadczynność tarczycy

Leki beta-adrenolityczne mogą maskować objawy sercowo-naczyniowe nadczynności tarczycy.

Pacjenci z zaburzeniem czynności wątroby

Zaleca się uważną kontrolę kliniczną pacjentów na początku leczenia.

Hipoglikemia

Podatność na hipoglikemię jest zwiększona, np. podczas długotrwałej głodówki lub ciężkiego wysiłku fizycznego.

Sportowcy

Należy zwrócić uwagę na stosowanie produktu u sportowców, ponieważ Betaxolol PMCS zawiera substancję czynną, która może powodować dodatni wynik testu antydopingowego.

4.5 Interakcje z innymi produktami leczniczymi i inne rodzaje interakcji

Leczenie skojarzone przeciwwskazane:

- *Floktafenia*

W przypadku wstrząsu lub niedociśnienia tętniczego wywołanego floktafeniną, leki o działaniu beta-adrenolitycznym powodują zmniejszenie reakcji kompensacyjnych.

- *Sultopryd*

Zaburzenia automatyzmu serca (nasiloną bradykardia) z powodu dodatkowego czynnika wywołującego bradykardię.

Leczenie skojarzone niezalecane:

- *Amiodaron*

Zaburzenia kurczliwości, automatyzmu i przewodnictwa mięśnia sercowego (zahamowanie mechanizmów wyrównawczych ze strony układu współczulnego).

- *Leki przeciwnadciśnieniowe o działaniu ośrodkowym, glikozydy naparstnicy*

Jednoczesne stosowanie betaksololu z tymi produktami leczniczymi może prowadzić do wydłużenia czasu przewodzenia przedsionkowo-komorowego i powodować ciężką bradykardię.

Leczenie skojarzone wymagające zachowania środków ostrożności

- *Leki znieczulające*

Jednoczesne stosowanie betaksololu z lekami znieczulającymi może prowadzić do nadmiernego zmniejszenia ciśnienia tętniczego krwi. Może wystąpić addytywne ujemne działanie inotropowe leków znieczulających i betaksololu (w celu zniesienia efektów blokady receptorów beta-adrenergicznych podczas zabiegu można zastosować leki pobudzające receptory beta-adrenergiczne).

Jednakże, nie należy przerywać stosowania betaksololu podczas znieczulenia ogólnego lub przed podaniem leków zwiotczających mięśnie szkieletowe. Należy poinformować anestezjologa o leczeniu lekami beta-adrenolitycznymi. Jeżeli jest to konieczne, leczenie betaksololem należy przerwać na 48 godzin przed znieczuleniem, w celu uzyskania prawidłowej wrażliwości na działanie katecholamin (patrz punkt 4.4).

- *Antagoniści kanału wapniowego (beprydyl, diltiazem, mibefradyl i werapamil)*

Zaburzenia automatyzmu mięśnia sercowego (nasiloną bradykardia, zatrzymanie czynności węzła zatokowo-predsionkowego), zaburzenia przewodzenia przedsionkowo-komorowego i niewydolność serca (działanie synergiczne).

Leczenie skojarzone tymi lekami można stosować wyłącznie pod ścisłą kontrolą EKG, szczególnie u pacjentów w podeszłym wieku lub na początku leczenia.

- *Leki przeciwartmyczne (propafenon i klasa Ia: chinidyna, hydrochinidyna i dizopiramid)*
Zaburzenia kurczliwości, automatyzmu i przewodnictwa w mięśniu sercowym (zahamowanie wyrównawczych mechanizmów współczulnych).

Zaleca się kontrolowanie EKG.

- *Baklofen*
Zwiększenie ryzyka niedociśnienia tętniczego.
Należy regularnie kontrolować ciśnienie tętnicze krwi i w razie potrzeby dostosować dawkę leku przeciwnadciśnieniowego.

- *Insulina i sulfonamidy zmniejszające stężenie glukozy we krwi (patrz punkty 4.4. i 4.8)*
Wszystkie leki beta-adrenolityczne mogą maskować niektóre objawy hipoglikemii takie, jak kołatanie serca i tachykardia.
Należy poinformować pacjentów o tym oraz o konieczności częstszego kontrolowania stężenia glukozy we krwi, zwłaszcza na początku leczenia.

- *Lidokaina*
Opisano interakcje lidokainy z propranololem, metoprololem i nadololem.

Zwiększenie stężenia lidokainy we krwi z możliwym nasileniem działań niepożądanych neurologicznych i kardiologicznych (zmniejszenie metabolizmu lidokainy w wątrobie).

Należy dostosować dawkowanie lidokainy. Zaleca się ścisłą kontrolę kliniczną, kontrolę EKG oraz monitorowanie stężenia lidokainy we krwi podczas stosowania leku beta-adrenolitycznego i po zakończeniu jego stosowania.

- *Środki kontrastowe zawierające jod*
W przypadku wstrząsu lub niedociśnienia tętniczego związanego z zastosowaniem środków kontrastowych, zawierających jod, leki hamujące receptory beta-adrenergiczne powodują zmniejszenie reakcji wyrównawczych ze strony układu sercowo-naczyniowego.
Zawsze, gdy jest to możliwe, należy przerwać stosowanie leków beta-adrenolitycznych przed badaniem radiologicznym z zastosowaniem środków kontrastowych. Jeśli konieczna jest kontynuacja leczenia lekiem beta-adrenolitycznym, badanie można wykonać jedynie, gdy zapewniony jest dostęp do oddziału intensywnej opieki medycznej.

Leczenie skojarzone wymagające rozważenia

- *Niesteroidowe leki przeciwzapalne (NLPZ)*
Zmniejszenie działania obniżającego ciśnienie tętnicze krwi (NLPZ hamują prostaglandyny rozszerzające naczynia i zatrzymanie wody i sodu w organizmie przez NLPZ pochodne pirazolonu).

- *Antagoniści kanału wapniowego: dihydropirydyny, takie, jak nifedypina*
Niedociśnienie tętnicze i niewydolność serca u pacjentów z utajoną lub niewyrównaną niewydolnością serca (ujemne inotropowe działanie dihydropirydyny *in vitro*, różniące się stopniem nasilenia w zależności od konkretnego produktu i prawdopodobnie addytywne do ujemnego inotropowego działania leków beta-adrenolitycznych).
Leczenie lekami beta-adrenolitycznymi może zmniejszyć reakcję odruchową układu współczulnego występującą w przypadku nasilonych zaburzeń hemodynamicznych.

- *Trójpierścieniowe leki przeciwdepresyjne pochodne imipraminy, neuroleptyki*
Nasilenie działania obniżającego ciśnienie tętnicze krwi oraz ryzyko wystąpienia niedociśnienia ortostatycznego (działanie addytywne).

- *Kortykosteroidy i tetrakozaktyd*

Zmniejszenie działania obniżającego ciśnienie tętnicze krwi (zatrzymanie sodu i wody).

- *Meflochina*

Ryzyko wystąpienia bradykardii (addytywne działanie powodujące bradykardię).

- *Leki sympatykomimetyczne*

Ryzyko zmniejszenia działania leków beta-adrenolitycznych.

- *Adrenalina*

Jednoczesne stosowanie betaksololu z adrenaliną może prowadzić do nadmiernego zmniejszenia ciśnienia tętniczego krwi.

- *Alfa-adrenolityki*

Nasilenie działania przeciwnadciśnieniowego. Zwiększenie ryzyka niedociśnienia ortostatycznego.

- *Nitraty i pochodne nitratów*

Zwiększenie ryzyka niedociśnienia tętniczego, szczególnie ortostatycznego.

4.6 Wpływ na ciążę i laktację

Ciąża

Działanie teratogenne: Badania na zwierzętach nie wykazały żadnego działania teratogennego. Dotychczas nie donoszono o działaniu teratogennym u ludzi.

Leki beta-adrenolityczne zmniejszają przepływ przez łożysko, co może powodować wewnątrzmaciczną śmierć płodu, poronienie i przedwczesny poród. Ponadto, u płodu mogą wystąpić działania niepożądane (zwłaszcza hipoglikemia i bradykardia).

Noworodki: U noworodków matek leczonych lekami beta-adrenolitycznymi działanie tych leków utrzymuje się przez kilka dni po porodzie. Istnieje zwiększone ryzyko wystąpienia powikłań sercowych i płucnych u noworodków w okresie pourodzeniowym. Jeśli wystąpi niewydolność serca, noworodka należy przewieźć do oddziału intensywnej opieki medycznej (patrz punkt 4.9); należy unikać podawania środków zwiększających objętość osocza (ryzyko wystąpienia ostrego obrzęku płuc). Donoszono również o występowaniu bradykardii, zaburzeniach oddychania i hipoglikemii u noworodka.

Zaleca się ścisły nadzór nad noworodkiem w specjalistycznym ośrodku (monitorowanie częstości akcji serca i stężenia glukozy we krwi) przez pierwsze 3 do 5 dni po porodzie.

Nie zaleca się stosowania betaksololu podczas ciąży, chyba, że możliwe korzyści z leczenia matki przeważają nad ryzykiem dla noworodka.

Karmienie piersią

Betaksolol przenika do mleka matki. Ryzyko wystąpienia hipoglikemii i bradykardii nie zostało ocenione, dlatego nie zaleca się karmienia piersią podczas leczenia betaksololem.

4.7 Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn

Nie przeprowadzono badań nad wpływem betaksololu na zdolność prowadzenia pojazdów. Podczas prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn należy wziąć pod uwagę występujące sporadycznie zawroty głowy i uczucie zmęczenia.

4.8 Działania niepożądane

Do określenia częstości występowania działań niepożądanych zastosowany będzie następujący zapis:

Bardzo często (≥ 10)

Często ($\geq 1/100$ do $< 1/10$)

Niezbyt często ($\geq 1/1\ 000$ do $< 1/100$)

Rzadko ($\geq 1/10\ 000$ do $< 1/1\ 000$)

Bardzo rzadko ($< 1/10\ 000$)

Nie znana (częstość nie może być określona na podstawie dostępnych danych)

Kliniczne:

Zaburzenia skóry i tkanki podskórnej

Często: alergiczne reakcje skórne (zaczerwienienie, świąd, wysypka) i łysienie.

Rzadko: leki beta-adrenolityczne mogą powodować łuszczycę lub nasilenie istniejącej łuszczycy lub wystąpienie wysypki podobnej do łuszczycy (patrz punkt 4.4).

Zaburzenia układu nerwowego

Często: szczególnie na początku leczenia wystąpić może zmęczenie, zawroty głowy, ból głowy i nadmierne pocenie się.

Niezbyt często: objawy podobne do miastenii, z osłabieniem mięśni.

Bardzo rzadko: nasilenie istniejącej miastenii, parestezje obwodowe.

Zaburzenia oka

Niezbyt często: zmniejszenie wydzielania łez (należy mieć to na uwadze u pacjentów stosujących soczewki kontaktowe).

Bardzo rzadko: zaburzenie widzenia.

Zaburzenia psychiczne

Często: osłabienie, bezsenność.

Rzadko: depresja.

Bardzo rzadko: omamy, splątanie, koszmary senne.

Zaburzenia żołądka i jelit

Często: ból żołądka, biegunka, nudności i wymioty.

Zaburzenia metabolizmu i odżywiania

Bardzo rzadko: hipoglikemia, hiperglikemia. Może się ujawnić utajona klinicznie cukrzyca lub pogorszyć istniejąca cukrzyca.

Nie znana: u pacjentów z nadczynnością tarczycy kliniczne objawy tyreotoksykozy (tachykardia i drżenie) mogą być zamaskowane. Podczas długotrwałej głodówki lub ciężkiego wysiłku fizycznego może wystąpić hipoglikemia. Ostrzegawcze objawy hipoglikemii (szczególnie tachykardia i drżenie) mogą być osłabione.

Zaburzenia serca

Często: bradykardia, możliwa ciężka bradykardia.

Rzadko: niewydolność serca, spadek ciśnienia tętniczego krwi, zwolnienie przewodzenia lub nasilenie istniejącego bloku przedsionkowo-komorowego.

Zaburzenia naczyniowe

Często: ziębnięcie kończyn.

Rzadko: zespół Raynauda, nasilenie istniejącego chromania przestankowego.

Zaburzenia układu oddechowego, klatki piersiowej i śródpiersia

Rzadko: skurcz oskrzeli

Zaburzenia układu rozrodczego i piersi

Często: impotencja.

Badania diagnostyczne:

W rzadkich przypadkach obserwowano pojawienie się przeciwciał przeciwjądrowych, którym w wyjątkowych przypadkach towarzyszyły objawy kliniczne, takie, jak układowy toczeń rumieniowaty, które ustępowały po zakończeniu leczenia.

Podczas leczenia betaksololem mogą wystąpić zaburzenia metabolizmu lipidów (zmniejszenie stężenia cholesterolu HDL, zwiększenie stężenia triglicerydów).

4.9 Przedawkowanie

Objawy przedawkowania: ciężkie niedociśnienie tętnicze, bradykardia aż do zatrzymania akcji serca, ostra niewydolność serca, wstrząs kardiogeny, skurcz oskrzeli i w pojedynczych przypadkach uogólnione drgawki.

W przypadku wystąpienia zagrażającej życiu bradykardii lub znacznego obniżenia ciśnienia tętniczego krwi należy zastosować następujące leczenie:

- atropina: 1 do 2 mg dożylnie,
- glukagon: początkowo 1-10 mg dożylnie, następnie 2-2,5 mg/h w ciągłym wlewie dożylnym.
- leki sympatykomimetyczne, w zależności od masy ciała i działania leczniczego: dopamina, dobutamina, orcyprenalina i adrenalina.

W przypadku wystąpienia skurczu oskrzeli można podać leki beta-mimetyczne w postaci aerozolu (w razie niewystarczającego działania także dożylnie) lub aminofilinę i.v.

Betaksolol i jego metabolity można usunąć za pomocą hemodializy lub dializy otrzewnowej jedynie w niewielkim stopniu.

W przypadku dekompensacji kardiologicznej u noworodków matek leczonych lekami beta-adrenolitycznymi należy:

- podać glukagon w dawce 0,3 mg/kg mc.
- przewieźć noworodka do oddziału intensywnej opieki medycznej
- podać izoprenalinę i dobutaminę: długotrwałe leczenie i stosowanie dużych dawek wymaga specjalistycznego monitorowania.

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

5.1 Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: wybiórcze beta-adrenolityki
kod ATC: C07AB05

Betaksolol jest długodziałającym, kardioselektywnym lekiem blokującym receptory beta₁-adrenergiczne. Działanie blokujące receptory występuje w ciągu 24 godzinach po podaniu doustnym 20 mg betaksololu. Po podaniu terapeutycznych dawek betaksololu obserwowane znaczne zmniejszenie ciśnienia tętniczego krwi, częstości akcji serca i objętości wyrzutowej serca.

Betaksolol wykazuje słabe działanie stabilizujące błony komórkowe, bez wewnętrznej aktywności sympatykomimetycznej. Betaksolol nie zmniejsza wydalania sodu przez nerki. Betaksolol zmniejsza aktywność reninową osocza.

Stosowane dawki nie powodują istotnych reakcji ze strony układu sercowo-naczyniowego.

Znany wpływ leków beta-adrenolitycznych na lipidy krwi jest mniejszy w przypadku betaksololu.

Działanie obniżające ciśnienie tętnicze krwi:

Po podaniu dawki dobowej 20 mg betaksololu działanie obniżające ciśnienie krwi jest podobne, jak po podaniu dawki 100 mg atenololu lub 160-320 mg propranololu na dobę

Działanie zapobiegające niedokrwieniu serca:

Po podaniu pojedynczej dawki dobowej 20 mg betaksololu działanie zapobiegające niedokrwieniu serca jest podobne, jak po podaniu pojedynczej dawki 100 mg atenololu lub 160 mg propranololu w dwóch dawkach podzielonych.

5.2 Właściwości farmakokinetyczne

Po podaniu doustnym substancja czynna wchłania się całkowicie i szybko. Efekt pierwszego przejścia przez wątrobę jest minimalny. Biodostępność jest wysoka i wynosi około 85%. Betaksolol wiąże się z białkami osocza w około 50%, objętość dystrybucji wynosi około 6 l/kg.

85-90% podanej dawki jest metabolizowane w wątrobie. Tylko jeden metabolit (2-3% podanej dawki), powstający w wyniku hydroksylowania alifatycznego, wykazuje działanie blokujące receptory beta-adrenergiczne. Metabolit ma właściwości selektywne, siła jego działania stanowi 50% siły działania betaksololu. 10 do 15% podanej dawki wydalane jest w postaci niezmienionej przez nerki. Metabolity są wydalane głównie przez nerki. Maksymalne stężenia w osoczu po doustnym podaniu dawki 20 mg są osiągane w ciągu 2-4 godzin i wynoszą od 30 do 60 ng / ml. Zmienność wewnątrz- i międzypersoniczna maksymalnych stężeń w osoczu w stanie stacjonarnym jest niewielka. Okres półtrwania w fazie eliminacji (16-20 h) umożliwia podawanie produktu w jednej dawce dobowej. Okres półtrwania w fazie eliminacji jest wydłużony u pacjentów w podeszłym wieku i pacjentów dializowanych (24-30 h). Nie obserwowano żadnych istotnych zmian parametrów farmakokinetycznych u pacjentów z niewydolnością wątroby.

5.3 Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

Badania niekliniczne nie wykazały działania mutagennego i rakotwórczego betaksololu. Badania na zwierzętach nie wykazały żadnego działania teratogennego betaksololu.

6. DANE FARMACEUTYCZNE

6.1 Wykaz substancji pomocniczych

Celuloza mikrokrystaliczna
Kroskarmeloza sodowa
Krzemionka koloidalna bezwodna
Magnezu stearynian

6.2 Niezgodności farmaceutyczne

Nie dotyczy.

6.3 Okres ważności

4 lata.

6.4 Specjalne środki ostrożności podczas przechowywania

Nie przechowywać w temperaturze powyżej 30°C.

6.5 Rodzaj i zawartość opakowania

Blister PVC/PVDC/Aluminium w pudełku tekturowym.
Wielkość opakowań: 10, 20, 30, 50, 60, 90 i 100 tabletek.

Nie wszystkie wielkości opakowań muszą znajdować się w obrocie.

6.6 Specjalne środki ostrożności dotyczące usuwania i przygotowania produktu leczniczego do stosowania

Bez specjalnych zaleceń.

7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

PRO.MED.CS Praha a.s., Telčská 1, 140 00 Prague 4, Republika Czeska

8. NUMER POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

21594

9. DATA WYDANIA PIERWSZEGO POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU/ I DATA PRZEDŁUŻENIA POZWOLENIA

Data wydania pierwszego pozwolenia na dopuszczenie do obrotu: 2013-11-22

10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO

2013-11-22