Локрен



Код АТХ:

- C07AB05

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Бетаксолол

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с риской на одной стороне и гравировкой "КЕ 20" - на другой.

	1 таб.
бетаксолола гидрохлорид	20 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 100 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 113 мг, карбоксиметилкрахмал натрия (тип А) - 4 мг, кремния диоксид коллоидный - 1.6 мг, магния стеарат - 1.4 мг.

Состав пленочной оболочки: гипромеллоза - 3.9 мг, макрогол 400 - 0.43 мг, титана диоксид (Е171) - 0.67 мг.

14 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Вегетотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Селективный бета$_1$-адреноблокатор. Бетаксолол характеризуется тремя фармакологическими свойствами: кардиоселективным бета$_1$-адреноблокирующим действием; отсутствием частичной агонистической активности (отсутствие внутренней симпатомиметической активности); слабым мембраностабилизирующим действием (подобно действию хинидина или местных анестетиков) в концентрациях, превышающих терапевтические.

Следует отметить, что селективное воздействие бетаксолола на β_1-адренорецепторы не является абсолютным, так при применении его в высоких дозах возможно воздействие бетаксолола на β_2-адренорецепторы, расположенные, главным образом, в гладкой мускулатуре бронхов и сосудов (однако воздействие бетаксолола на β_2-адренорецепторы значительно слабее такового у неселективных бета-адреноблокаторов).

При применении бетаксолола его блокирующая β_1-адренорецепторы активность проявляется следующими фармакодинамическими эффектами:

— уменьшение ЧСС в покое и при физической нагрузке (за счет блокады β-адренорецепторов в синусовом узле, что в сочетании с отсутствием у бетаксолола внутренней симпатомиметической активности приводит к замедлению автоматизма синусового узла);

— снижение сердечного выброса в покое и при физической нагрузке за счет конкурентного антагонизма с катехоламинами в периферических (особенно кардиальных) адренергических нервных окончаниях;

— снижение систолического и диастолического АД в покое и при физической нагрузке (механизм антигипертензивного действия описан ниже);

— уменьшение рефлекса ортостатической тахикардии.

В результате этих эффектов происходит уменьшение нагрузки на сердце в покое и при физической нагрузке.

Механизм антигипертензивного действия бета-адреноблокаторов полностью не установлен.

У бета-адреноблокаторов предполагаются следующие механизмы антигипертензивного действия:

— снижение сердечного выброса;

— устранение спазма периферических артерий (за счет центрального действия, приводящего к снижению симпатической импульсации на периферию, к сосудам, и за счет ингибирования активности ренина).

Антигипертензивное действие бетаксолола при его длительном приеме не уменьшается. При однократном в течение суток приеме бетаксолола (от 5 до 40 мг) антигипертензивное действие является одинаковым через 3-4 ч (время достижения C_{max} бетаксолола в крови) и через 24 ч (перед приемом очередной дозы). При приеме 5 мг и 10 мг бетаксолола его антигипертензивное действие составляет, соответственно, 50% и 80% от антигипертензивного действия при приеме 20 мг бетаксолола.

Таким образом, в диапазоне доз 5-20 мг наблюдается дозозависимость антигипертензивного эффекта, причем при увеличении дозы с 10 мг до 20 мг прирост антигипертензивного эффекта является незначительным. Увеличение дозы с 20 мг до 40 мг мало изменяет антигипертензивное действие бетаксолола. Максимальный антигипертензивный эффект каждой дозы бетаксолола достигается через 1-2 недели.

В отличие от антигипертензивного действия бетаксолола эффект уменьшения ЧСС при увеличении его дозы (с 10 мг до 40 мг) не нарастает.

Кроме этого, бетаксолол способен замедлять проводимость AV-узла.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь бетаксолол быстро и полностью (100%) абсорбируется из ЖКТ. C_{max} бетаксолола в плазме крови достигается через 2-4 ч. Бетаксолол имеет незначительный эффект "первого прохождения" через печень и высокую биодоступность - около 85%. Различия его плазменных концентраций у разных пациентов или у одного пациента при длительном применении имеют незначительные различия, что связано с высокой биодоступностью бетаксолола.

Распределение

Бетаксолол связывается с белками плазмы крови примерно на 50%. Плохо проникает через ГЭБ и плацентарный барьер, в незначительной степени выделяется с грудным молоком. V_d - около 6 л/кг. Растворимость в жирах умеренная.

Метаболизм

Бетаксолол метаболизируется в печени с образованием неактивных метаболитов.

Выведение

Выводится почками в виде метаболитов (более 80%), 10-15% - в неизмененном виде. $T_{1/2}$ бетаксолола - 15-20 ч.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

$T_{1/2}$ при нарушении функции печени удлиняется на 33%, но клиренс не изменяется; при нарушении функции почек $T_{1/2}$ удваивается (необходимо снижение доз).

Не удаляется при гемодиализе.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия (в монотерапии и составе комбинированной терапии);

— профилактика приступов стенокардии напряжения (в монотерапии и составе комбинированной терапии).

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Стенокардия

Противопоказания:

— тяжелые формы бронхиальной астмы и хронической обструктивной болезни легких;

— острая сердечная недостаточность, хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации, не компенсирующаяся в результате лечения диуретиками, инотропными средствами, ингибиторами АПФ, другими вазодилататорами;

— кардиогенный шок;

— AV-блокада II и III степени (без установленного искусственного водителя ритма);

— стенокардия Принцметала (противопоказана монотерапия);

— СССУ (в т.ч. синоатриальная блокада);

— выраженная брадикардия (ЧСС менее 45-50 уд./мин);

— тяжелые формы болезни Рейно и облитерирующих заболеваний периферических артерий;

— феохромоцитома без одновременного приема альфа-адреноблокаторов;

— артериальная гипотензия (систолическое АД <100 мм рт. ст.);

— анафилактические реакции в анамнезе;

— метаболический ацидоз;

— кардиомегалия (без признаков сердечной недостаточности);

— одновременное применение с сультопридом и флоктафенином;

— одновременный прием ингибиторов МАО;

— детский и подростковый возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены);

— дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция (в связи с присутствием в составе препарата лактозы);

— повышенная чувствительность к бетаксололу и вспомогательным веществам препарата.

С *осторожностью* применяют препарат:

— при бронхиальной астме и хронической обструктивной болезни легких среднетяжелого течения (начинать лечение с малых доз и желательно под контролем показателей функции внешнего дыхания; благодаря бета$_1$-селективности бетаксолола при возникновении приступа бронхиальной астмы на фоне его приема возможно купирование приступа бета$_2$-адреномиметиками);

— при хронической сердечной недостаточности в стадии компенсации (лечение бетаксололом возможно только под строгим медицинским наблюдением; лечение следует начинать с очень малых доз с постепенным их повышением);

— при AV-блокаде I степени (требуется тщательное наблюдение, включая ЭКГ-контроль);

— при облитерирующих заболеваниях периферических артерий, синдроме Рейно (за исключением тяжелой формы) (возможно усиление нарушений периферического кровообращения);

— при стенокардии Принцметала (возможно учащение приступов стенокардии; применение селективного бета$_1$-адреноблокатора возможно только при одновременном применении вазодилататоров);

— при леченной феохромоцитоме (при лечении препаратом Локрен артериальной гипертензии на фоне леченной феохромоцитомы требуется тщательное наблюдение за показателями АД);

— у пациентов пожилого возраста (следует начинать лечение с малых доз и под тщательным медицинским наблюдением);

— при почечной недостаточности (при КК более 20 мл/мин - тщательное наблюдение за пациентом в течение первых 4-х дней лечения; при КК менее 20 мл/мин и/или проведении гемодиализа требуется коррекция режима дозирования);

— при печеночной недостаточности (требуется более тщательное клиническое наблюдение в начале лечения);

— у пациентов с сахарным диабетом (необходим регулярный контроль концентрации глюкозы в крови, включая активный самоконтроль пациентом, в начале лечения; возможно уменьшение выраженности предвестников развития гипогликемии, таких как тахикардия, ощущение сердцебиения и повышенное потоотделение);

— при псориазе (бета-адреноблокаторы могут утяжелять течение псориаза);

— при проведении десенсибилизирующей терапии.

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь и запивают достаточным количеством жидкости. Не следует разжевывать таблетку.

Начальная доза препарата Локрен для обоих показаний к применению препарата составляет обычно 10 мг (1/2 таб. 20 мг). Если в течение 7-14 дней лечения не достигаются целевые значения АД, то доза удваивается до 20 мг/сут.

Обычно не используются дозы препарата Локрен, превышающие 20 мг (в связи с тем, что при увеличении дозы более 20 мг не наблюдается статистически достоверного увеличения антигипертензивного эффекта препарата).

Максимальная суточная доза препарата Локрен - 40 мг.

У **пациентов с почечной недостаточностью** рекомендуется коррекция дозы в зависимости от функционального состояния почек пациента. При **КК более 20 мл/мин** коррекции дозы не требуется. Однако, в начале лечения, рекомендуется проводить клиническое наблюдение до достижения равновесной концентрации препарата в крови, (что достигается в среднем к 4-7 дню лечения). При **выраженной почечной недостаточности** (**КК менее 20 мл/мин**) рекомендуемая начальная доза препарата составляет 5 мг/сут (вне зависимости от частоты и дней проведения процедуры гемодиализа у пациентов, находящихся на гемодиализе), которая при недостаточной эффективности может увеличиваться в 2 раза каждые 1-2 недели. Максимальная суточная доза составляет 20 мг.

У **пациентов с печеночной недостаточностью** коррекции дозы обычно не требуется. Однако в начале терапии рекомендуется более тщательное клиническое наблюдение за пациентом.

Побочное действие:

Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд, крапивница.

Указанные ниже побочные эффекты даются в соответствии со следующими градациями частоты их возникновения: очень часто (≥1/10), часто (≥1/100, <1/10); нечасто (≥1/1000, <1/100); редко (≥1/10 000, <1/1000); очень редко (<1/10 000) (включая отдельные сообщения).

Дерматологические реакции: редко - различные кожные реакции, включая кожную сыпь, зуд, крапивницу, псориазоподобные высыпания или обострение течения псориаза.

Со стороны нервной системы: часто - головокружение, головная боль, астения, бессонница; редко - депрессия; очень редко - галлюцинации, спутанность сознания, ночные кошмары, парестезия.

Со стороны органа зрения: редко - сухость глаз, снижение внутриглазного давления (из-за возможности его

снижения под влиянием бета-адреноблокаторов); очень редко - нарушения зрения.

Со стороны пищеварительной системы: часто - гастралгия, диарея, тошнота, рвота.

Со стороны обмена веществ: очень редко - гипогликемия, гипергликемия.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - брадикардия, возможно тяжелая, снижение кожной температуры верхних и нижних конечностей; редко - развитие (или усугубление) симптомов сердечной недостаточности (отечность лодыжек, стоп, голеней), выраженное снижение АД, замедление AV-проводимости, проявления ангиоспазма: синдром Рейно, усиление нарушений периферического кровообращения, в т.ч. и перемежающейся хромоты, учащение приступов стенокардии.

Со стороны дыхательной системы: редко - бронхоспазм.

Со стороны половых органов: часто - импотенция.

Со стороны лабораторных показателей: редко - появление антинуклеарных антител, только в исключительных случаях сочетающееся с клиническими проявлениями волчаночноподобного синдрома, проходящего после прекращения лечения.

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

Прочие: синдром "отмены" (усиление или учащение приступов стенокардии, повышение АД).

Передозировка:

Симптомы: выраженная брадикардия, головокружение, AV-блокада, выраженное снижение АД, аритмии, желудочковая экстрасистолия, обморочное состояние, сердечная недостаточность, затруднение дыхания, бронхоспазм, цианоз ногтей пальцев и ладоней, судороги.

Лечение: промывание желудка, назначение адсорбирующих средств; в случае развития брадикардии рекомендуется атропин 1-2 мг в/в; затем (в случае необходимости) медленная инфузия 25 мкг изопреналина или инфузия добутамина 2.5-10 мкг/кг/мин; иногда может потребоваться временная постановка искусственного водителя ритма; в случае чрезмерного снижения АД рекомендуется в/в введение плазмозамещающих растворов и вазопрессорных препаратов; при бронхоспазме - назначение бронходилататоров, в т.ч. бета$_2$-адреномиметиков и/или аминофиллина; в случае сердечной недостаточности (декомпенсации) у новорожденных, матери которых в период беременности принимали бета-адреноблокаторы, рекомендуется госпитализация в отделение интенсивной терапии, изопреналин и добутамин - длительно и обычно в высоких дозах, наблюдение специалиста.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Беременность

В *экспериментальных исследованиях* не выявлено тератогенного действия бетаксолола.

До настоящего времени не сообщалось о тератогенных эффектах у человека.

Как правило, бета-адреноблокаторы снижают кровоток в плаценте и могут влиять на развитие плода. Следует отслеживать кровоток в плаценте и матке, а также наблюдать за ростом и развитием будущего ребенка, и в случае появления нежелательных явлений в отношении беременности и/или плода, принимать альтернативные терапевтические меры.

Следует тщательно обследовать новорожденного после родов. В первые 3-5 дней жизни могут возникать симптомы брадикардии гипогликемии, т.к. действие бета-адреноблокаторов у новорожденных, матери которых принимали их перед родами, сохраняется в течение нескольких дней после рождения. В неонатальном и постнатальном периоде у новорожденных имеется повышенный риск кардиальных и дыхательных осложнений. В случае возникновения сердечной недостаточности требуется госпитализация новорожденного в блок интенсивной терапии. Следует избегать применения плазмозаменителей (риск развития острого отека легких). Также сообщалось о развитии брадикардии, дыхательной недостаточности и гипогликемии. В связи с этим в течение первых 3-5 дней жизни требуется тщательное наблюдение за такими новорожденными в специализированном отделении (ЧСС, концентрация глюкозы в крови).

В связи с этим применение препарата Локрен при беременности не рекомендуется и возможно только в том случае, когда польза для матери превышает потенциальный риск для плода или ребенка.

Период лактации

Бета-адреноблокаторы, включая бетаксолол, выделяются с грудным молоком. Риск гипогликемии или брадикардии у грудных детей не изучался, поэтому в качестве меры предосторожности кормление грудью в период лечения

необходимо прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Противопоказанные комбинации

С флоктафенином

В случае шока или артериальной гипотензии, обусловленной флоктафенином, бета-адреноблокаторы вызывают уменьшение компенсаторных сердечно-сосудистых реакций.

С сультопридом

Нарушения автоматизма сердца (выраженная брадикардия) вследствие дополнительного уменьшения ЧСС.

Нерекомендуемые комбинации

С амиодароном

Нарушения сократимости, автоматизма и проводимости (угнетение симпатических компенсаторных механизмов).

С блокаторами медленных кальциевых каналов (бепридил, дилтиазем и верапамил)

Нарушения автоматизма (выраженная брадикардия, остановка синусового узла), нарушения AV-проводимости, сердечная недостаточность (синергетические /взаимно усиливающиеся/ эффекты).

Такая комбинация может применяться только под тщательным клиническим и ЭКГ наблюдением, особенно у пожилых пациентов или в начале лечения.

С сердечными гликозидами

Риск развития или усугубления брадикардии, AV-блокады, остановки сердца.

С ингибиторами МАО

Не рекомендуется одновременное применение с ингибиторами МАО вследствие значительного усиления антигипертензивного действия бетаксолола, перерыв в лечении между приемом ингибиторов МАО и бетаксолола должен составлять не менее 14 дней.

С йодсодержащими контрастными веществами

В случае развития шока или резкого снижения АД при введении йодсодержащих контрастных веществ, бета-адреноблокаторы уменьшают компенсаторные сердечно-сосудистые реакции. Если возможно, то перед проведением рентгенографического исследования с применением йодсодержащих контрастных средств следует отменить лечение бета-адреноблокатором.

Комбинации, которые следует применять с осторожностью

С ингаляционными галогенсодержащими анестетиками

Бета-адреноблокаторы обладают кардиодепрессивным действием (ингибирование β-адренорецепторов может быть уменьшено при введении бета-адреностимуляторов). Как правило, лечение бета-адреноблокаторами не прекращается и в любом случае следует избегать резкой отмены бета-адреноблокаторов. Врача-анестезиолога необходимо поставить в известность о приеме бета-адреноблокатора.

С препаратами, способными вызывать желудочковые нарушения ритма сердца, включая желудочковую тахикардию типа "пируэт": антиаритмические средства класса I A (хинидин, гидрохинидин и дизопирамид) и класса III (амиодарон, дофетилид, ибутилид), соталол, некоторые нейролептики из группы фенотиазина (хлорпромазин, циамемазин, левомепромазин, тиоридазин), бензамиды (амисульприд, сульпирид, тиаприд), бутирофеноны (дроперидол, галоперидол), прочие нейролептики (пимозид) и другие препараты (цизаприд, дифеманил, вводимый в/в эритромицин, галофантрин, мизоластин, моксифлоксацин, пентамидин, вводимый в/в спирамицин и вводимый в/в винкамин

Увеличение риска желудочковых нарушений ритма, в частности желудочковой тахикардии типа "пируэт". Требуется клинический и ЭКГ контроль.

С пропафеноном

Нарушения сократимости, автоматизма и проводимости (подавление симпатических компенсаторных механизмов). Требуется клинический и ЭКГ контроль.

С баклофеном

Усиление антигипертензивного действия бетаксолола. Необходим контроль АД и коррекция дозы бетаксолола в случае необходимости.

С инсулином и гипогликемическими средствами для приема внутрь, производными сульфонилмочевины

Все бета-адреноблокаторы могут маскировать определенные симптомы гипогликемии, такие как ощущение сердцебиения и тахикардия. Пациент должен быть предупрежден о необходимости усиления регулярного контроля концентрации глюкозы в крови, включая активный самоконтроль пациентом, особенно в начале лечения.

С ингибиторами холинэстеразы (амбеномиум, донепезил, галантамин, неостигмин, пиридостигмин, ривастигмин, такрин)

Риск усиления брадикардии (аддитивное действие). Требуется регулярный клинический контроль.

С гипотензивными средствами центрального действия (клонидин, апраклонидин, альфа-метилдопа, гуанфацин, моксонидин, рилменидин)

Повышенный риск развития брадикардии, нарушения AV-проводимости. Значительное повышение АД при резкой отмене гипотензивного средства центрального действия. Необходимо избегать резкой отмены гипотензивного средства и проводить клинический контроль.

С лидокаином 10% раствор (в/в в качестве антиаритмического средства)

Увеличение концентрации лидокаина в плазме крови с возможным увеличением нежелательных неврологических симптомов и эффектов со стороны сердечно-сосудистой системы (снижение метаболизма лидокаина в печени). Рекомендуется клиническое и ЭКГ наблюдение и, возможно, контроль концентрации лидокаина в плазме крови во время лечения бета-адреноблокаторами и после его прекращения. При необходимости - коррекция дозы лидокаина.

Комбинации, которые следует принимать во внимание

С НПВС (препаратами с системным действием), включая селективные ингибиторы ЦОГ-2

Снижение антигипертензивного эффекта бетаксолола (угнетение синтеза простагландинов НПВС и задержка воды и натрия пиразолоновыми производными).

С блокаторами медленных кальциевых каналов из группы дигидропиридинов

Взаимное усиление антигипертензивного действия блокаторов медленных кальциевых каналов и бетаксолола, развитие сердечной недостаточности у пациентов с латентнопротекающей сердечной недостаточностью или неконтролируемой сердечной недостаточностью. Лечение бета-адреноблокаторами может минимизировать рефлекторную активацию симпатической нервной системы в ответ на вазодилатацию под влиянием блокаторов медленных кальциевых каналов из группы дигидропиридинов.

С трициклическими антидепрессантами (типа имипрамина), нейролептиками

Усиление антигипертензивного эффекта бетаксолола и риск ортостатической гипотензии (аддитивное действие).

С мефлохином

Риск брадикардии (аддитивное действие).

С *дипиридамолом (в/в введение)*

Усиление антигипертензивного эффекта бетаксолола.

С альфа-адреноблокаторами, включая применяемые в урологии (альфузозин, доксазозин, празозин, тамсулозин, теразозин)

Усиление антигипертензивного эффекта бетаксолола. Повышенный риск ортостатической гипотензии.

С амифостином

Усиление антигипертензивного эффекта бетаксолола.

С аллергенами, используемыми для иммунотерапии или экстрактами аллергенов для кожных проб

Повышенный риск возникновения тяжелых системных аллергических реакций или анафилаксии у пациентов, получающих бетаксолол.

С фенитоином (в/в введение)

Повышение выраженности кардиодепрессивного действия и вероятности снижения АД.

С ксантинами

Бетаксолол снижает клиренс ксантинов (кроме дифиллина) и повышает их концентрацию в плазме крови, особенно у пациентов с исходно повышенным клиренсом теофиллина (например, под влиянием курения).

С эстрогенами

Ослабление антигипертензивного эффекта бетаксолола (задержка натрия и воды).

С ГКС и тетракозактидом

Ослабление антигипертензивного эффекта бетаксолола (задержка натрия и воды).

С диуретиками

Возможно чрезмерное снижение АД.

С недеполяризующими миорелаксантами

Бетаксолол удлиняет действие недеполяризующих миорелаксантов.

С кумаринами

Усиление антикоагулянтного эффекта кумаринов.

С алкоголем (этанол), седативными и снотворными лекарственными средствами

Усиление угнетения ЦНС.

С негидрированными алкалоидами спорыньи

Негидрированные алкалоиды спорыньи повышают риск развития нарушений периферического кровообращения при приеме бетаксолола.

Особые указания и меры предосторожности:

Не следует прерывать лечение препаратом Локрен резко и менять рекомендованную дозу без предварительной консультации с врачом, т.к. это может привести к временному ухудшению деятельности сердца. Лечение не следует прерывать внезапно, особенно у пациентов с ИБС, т.к. внезапная отмена может привести к тяжелым нарушениям сердечного ритма, инфаркту миокарда или остановке сердца. Дозу следует уменьшать постепенно, то есть в течение 2 недель, и в случае необходимости можно одновременно начинать заместительную терапию другим антиангинальным средством, чтобы избежать учащения приступов стенокардии.

У пациентов, принимающих Локрен, следует контролировать ЧСС и АД (в начале лечения ежедневно, затем 1 раз в 3-4 месяца), концентрацию глюкозы в крови у пациентов сахарным диабетом (1 раз в 4-5 месяцев), функцию почек у пожилых пациентов (1 раз в 4-5 месяцев).

Следует обучить пациента методике подсчета ЧСС, и пациент должен быть проинструктирован о необходимости обращения к врачу при уменьшении ЧСС менее 50 уд./мин.

Примерно у 20% пациентов со стенокардией бета-адреноблокаторы неэффективны. Основные причины - тяжелый коронарный атеросклероз с низким порогом ишемии (ЧСС в момент развития ангинального приступа менее 100 уд./мин) и повышенное конечно-диастолическое давление левого желудочка, нарушающее субэндокардиальный кровоток.

При одновременном приеме клонидина его прием может быть прекращен только через несколько дней после отмены препарата Локрен.

Локрен следует отменить перед исследованием концентрации катехоламинов, норметанефрина и ванилинминдальной кислоты в крови и моче; а также титров антинуклеарных антител в крови.

Бронхиальная астма и хроническая обструктивная болезнь легких

Бета-адреноблокаторы могут назначаться только пациентов 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 - бета$_2$-адреномиметики.

Сердечная недостаточность

У пациентов с сердечной недостаточностью, контролируемой терапевтически, в случае необходимости бетаксолол может использоваться под строгим медицинским наблюдением в очень низких начальных дозах с постепенным их увеличением при необходимости и в случае хорошей переносимости (сохранения компенсированного состояния хронической сердечной недостаточности).

Брадикардия

Если ЧСС в состоянии покоя становится ниже 50-55 уд./мин дозу препарата Локрен необходимо уменьшить.

AV-блокада I степени

Учитывая отрицательный дромотропный эффект бета-адреноблокаторов, при блокаде I степени препарат следует применять с осторожностью.

Стенокардия Принцметала

Бета-адреноблокаторы могут увеличивать частоту и продолжительность приступов у пациентов со стенокардией Принцметала. Применение кардиоселективных бета$_1$-адреноблокаторов возможно при легкой степени тяжести стенокардии Принцметала или стенокардии смешанного типа при условии, что лечение проводится в сочетании с вазодилататорами.

Нарушения периферического кровообращения

Бета-адреноблокаторы могут приводить к ухудшению состояния пациентов с нарушениями периферического кровообращения (болезнь Рейно или синдром Рейно, артериит или хронические облитерирующие заболевания артерий нижних конечностей).

Феохромоцитома

В случае применения бета-адреноблокаторов при лечении артериальной гипертензии, вызванной феохромоцитомой, требуется тщательный контроль АД. Назначение препарата Локрен возможно только на фоне применения альфа-адреноблокаторов.

Пожилые пациенты

Лечение пациентов пожилого возраста следует начинать с малой дозы и под строгим наблюдением.

Пациенты с почечной недостаточностью

Дозу необходимо корректировать в зависимости от концентрации креатинина в крови или КК.

Пациенты с сахарным диабетом

Следует предупредить пациента о необходимости усилить контроль концентрации глюкозы в крови, включая активный самоконтроль пациентом, в начале лечения. Пациенту следует знать, что начальные симптомы гипогликемии (особенно тахикардия, ощущение сердцебиения и потливость) могут быть маскированы бетаксололом.

Псориаз

Требует тщательная оценка необходимости применения препарата, т.к. имеются сообщения об утяжелении течения псориаза во время лечения бета-адреноблокаторами.

Аллергические реакции

Бета-адреноблокаторы, включая препарат Локрен, могут повышать чувствительность к аллергенам и тяжесть анафилактических реакций из-за ослабления адренергической компенсаторной регуляции под действием бета-адреноблокаторов. Терапия анафилактических реакций эпинефрином (адреналином) не всегда дает ожидаемый терапевтический эффект.

У пациентов, склонных к тяжелым анафилактическим реакциям, в особенности связанных с применением флоктафенина или при проведении десенсибилизации, терапия бета-адреноблокаторами может привести к дальнейшему усилению реакций и снижению эффективности лечения.

Общая анестезия

При проведении общей анестезии следует учитывать риск возникновения блокады β-адренорецепторов (уменьшение ЧСС, снижение сердечного выброса, снижение систолического и диастолического АД).

Бета-адреноблокаторы маскируют рефлекторную тахикардию и повышают риск развития артериальной гипотензии. Продолжение терапии бета-адреноблокаторами снижает риск развития аритмии, ишемии миокарда и гипертонических кризов. Врачу-анестезиологу следует сообщить о том, что пациент получает лечение бета-адреноблокаторами.

Если необходимо прекратить терапию препаратом Локрен перед хирургическим вмешательством, это следует делать постепенно и завершить за 48 ч до проведения общей анестезии, т.к. считается, что прекращение терапии на 48 ч позволяет восстановить чувствительность рецепторов к катехоламинам.

Терапия бета-адреноблокаторами в некоторых случаях может не прерываться:

— у пациентов с коронарной недостаточностью желательно продолжать лечение вплоть до хирургического вмешательства, учитывая риск, связанный с внезапной отменой бета-адреноблокаторов;

— в случае экстренных хирургических вмешательств или в тех случаях, когда прекращение лечения невозможно, пациента следует защитить от последствий возбуждения блуждающего нерва путем соответствующей премедикации атропином, с повторением в случае необходимости.

У таких пациентов для общей анестезии необходимо применять вещества, в наименьшей степени угнетающие миокард, и следует восполнять кровопотери.

Должен учитываться риск развития анафилактических реакций.

Тиреотоксикоз

Симптомы тиреотоксикоза могут маскироваться при терапии бета-адреноблокаторами.

Спортсмены

Спортсмены должны учитывать, что препарат содержит активное вещество, которое может давать положительную реакцию при проведении тестов допингового контроля.

На время лечения следует исключить употребление алкоголя.

Пациенты, пользующиеся контактными линзами должны учитывать, что на фоне лечения бета-адреноблокаторами возможно уменьшение выработки слезной жидкости.

У курящих пациентов эффективность бета-адреноблокаторов ниже.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и заниматься другими потенциально опасными видами деятельности

При управлении транспортными средствами или занятии другими потенциально опасными видами деятельности при приеме препарата Локрен следует соблюдать осторожность (в связи с риском развития головокружения, слабости, которые могут снизить внимание и скорость психомоторных реакций, необходимых для этих видов деятельности).

При нарушениях функции почек

С осторожностью применять при почечной недостаточности (при КК более 20 мл/мин - тщательное наблюдение за пациентом в течение первых 4-х дней лечения; при КК менее 20 мл/мин и/или проведении гемодиализа требуется коррекция режима дозирования.

При нарушениях функции печени

С осторожностью применять при печеночной недостаточности (требуется более тщательное клиническое наблюдение в начале лечения).

Применение в пожилом возрасте

С *осторожностью* применяют препарат у лиц пожилого возраста (следует начинать лечение с малых доз и под тщательным медицинским наблюдением).

Применение в детском возрасте

Противопоказание: детский и подростковый возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре ниже 25°С.

Срок годности:

5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Lokren