

## **Состав**

*действующее вещество:* 1 таблетка содержит бетаксолола гидрохлорида 20 мг;

*вспомогательные вещества:* лактозы моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая, натрия крахмалгликолят (тип А), кремния диоксид коллоидный безводный, магния стеарат;

*оболочка:* смесь для пленочного покрытия Opadry II White (гипромеллоза, лактозы моногидрат, полиэтиленгликоль, титана диоксид (Е 171), триацетин).

## **Лекарственная форма**

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

*Основные физико-химические свойства:* таблетки круглой формы с двояковыпуклой поверхностью с чертой, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета.

## **Фармакотерапевтическая группа**

Селективные блокаторы бета-адренорецепторов. Код АТХ С07А В05.

## **Фармакодинамика**

Бетаксолол характеризуется тремя фармакологическими свойствами:

- кардиоселективным бета-адреноблокирующим действием;
- отсутствием частичной агонистической активности (т.е. не проявляет собственной симпатомиметической активности);
- слабым мембраностабилизирующим эффектом (подобно хинидину или местным анестетикам) в концентрациях, превышающих рекомендуемые терапевтические дозы.

## **Фармакокинетика**

Абсорбция. Лекарственное средство быстро и полностью всасывается после приема внутрь при очень небольшом эффекте «первого прохождения» через

печень и очень высокой биодоступности - примерно 85 %, что обеспечивает незначительные отличия его концентрации в плазме крови у разных пациентов или у одного пациента при длительном применении. Бетаксолол связывается с белками плазмы крови приблизительно на 50 %.

Метаболизм. Объем распределения составляет около 6 л/кг. В организме бетаксолол в основном превращается в неактивные метаболиты, и только 10-15 % бетаксолола обнаруживается в моче в неизмененном виде. Основной путь элиминации - через почки.

Выведение. Период полувыведения бетаксолола из организма составляет 15-20 часов.

### **Показания**

Артериальная гипертензия. Профилактика приступов стенокардии напряжения.

### **Противопоказания**

- Тяжелые формы бронхиальной астмы хронических обструктивных заболеваний легких;
- сердечная недостаточность, которая не контролируется лечением;
- кардиогенный шок;
- атриовентрикулярная блокада II-III степени у больных, которые не имеют водителя ритма;
- стенокардия Принцметала (противопоказана монотерапия препаратом при изолированной/типичной форме этого заболевания);
- дисфункция синусового узла (включая синоатриальную блокаду);
- брадикардия (частота сердечных сокращений < 45-50 уд/мин);
- тяжелые формы синдрома Рейно и других нарушений периферического кровообращения;
- нелеченная феохромоцитома;
- артериальная гипотензия;
- гиперчувствительность к бетаксололу;
- анафилактические реакции в анамнезе;
- метаболический ацидоз.

Лекарственное средство противопоказано для применения в комбинации с флоктафенином и сультопридом (см. раздел «Взаимодействие с другими

лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»).

Применение лекарственного средства не рекомендуется в комбинации с амиодароном, бепридиллом, дилтиаземом и верапамиллом (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»).

В связи с наличием лактозы это лекарственное средство противопоказано пациентам с врожденной галактоземией, мальабсорбцией глюкозы/галактозы или синдромом дефицита лактазы.

### **Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий**

Брадикардия может быть обусловлена рядом лекарственных средств: бета-адреноблокаторами, антиаритмическими препаратами класса Ia (хинидин, дизопирамид), класса III (амиодарон и соталол), класса IV (дилтиазем и верапамил), а также гликозидами наперстянки, клонидином, гуанфацином, мефлохином и ингибиторами холинэстеразы, которые применяют для лечения болезни Альцгеймера.

Противопоказано одновременное применение лекарственного средства с указанными ниже препаратами.

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

*Сультонприд.* Нарушение автоматизма сердца (чрезмерная брадикардия), обусловленное аддитивным эффектом уменьшения частоты сокращений.

Не рекомендуется применять лекарственное средство с указанными ниже препаратами.

*Блокаторы кальциевых каналов (бепридил, дилтиазем и верапамил).*

Нарушение автоматизма (чрезмерная брадикардия, остановка синусового узла), синоатриальной и атриовентрикулярной проводимости, сердечная недостаточность (синергическое действие). Такие комбинации можно применять только при тщательном клиническом контроле и электрокардиографическом наблюдении, особенно для больных пожилого возраста или в начале лечения.

*Амиодарон.* Нарушение сократимости, автоматизма и проводимости (угнетение симпатических компенсаторных механизмов).

Следует с осторожностью применять лекарственное средство с указанными ниже препаратами.

*Ингаляционные анестетики, содержащие галоген.* Бета-адреноблокаторы вызывают снижение сердечно-сосудистых компенсаторных реакций (во время операции угнетение бета-адренорецепторов можно устранить с помощью бета-стимуляторов). Как правило, терапию бета-блокаторами не следует прекращать, а резкой отмены лекарственного средства следует избегать в любом случае. Необходимо сообщить анестезиологу о лечении, которое проводится.

*Лекарственные средства, которые могут провоцировать пароксизмальную желудочковую тахикардию типа «torsades de pointes» (кроме сультоприда).* Антиаритмические лекарственные средства класса Ia (хинидин, гидрохинидин и дизопирамид) и класса III (амиодарон, дофетилид, ибутилид, сотатол); некоторые нейролептики группы фенотиазина (хлорпромазин, циамемазин, левомепромазин, тиоридазин), бензамиды (амисульприд, сульпирид, тиаприд), бутирофеноны (дроперидол, галоперидол), другие нейролептики (пимозид) и другие лекарственные средства (цисаприд, дифеманил, внутривенный эритромицин, галофантрин, мизоластин, моксифлоксацин, пентамидин, внутривенные спирамицин и винкамин). Повышение риска развития желудочковой аритмии и особенно пароксизмальной тахикардии типа «torsades de pointes» (гипокалиемия является провоцирующим фактором). Необходим клинический и электрокардиографический контроль.

*Пропафенон.* Нарушение сократимости, автоматизма и проводимости (угнетение симпатических компенсаторных механизмов). Необходим клинический и

электрокардиографический контроль.

*Баклофен.* Усиление антигипертензивного действия. Необходим контроль артериального давления и коррекция дозы антигипертензивного средства.

*Инсулин и антидиабетические сульфонамиды.* Все бета-блокаторы могут маскировать некоторые симптомы гипогликемии, такие как тахикардия, ощущение сердцебиения (см. раздел «Особенности применения»). Пациент должен быть предупрежден о необходимости усилить самоконтроль уровня сахара в крови.

*Ингибиторы холинэстеразы (амбеномиум, донепезил, галантамин, неостигмин, пиридостигмин, ривастигмин, такрин).* Риск усиления брадикардии (аддитивное действие).

Необходим регулярный клинический контроль.

*Антигипертензивные средства центрального действия (клонидин, апраклонидин, альфа-метилдопа, гуанфацин, моксонидин, рилменидин).* Значительное повышение артериального давления при резкой отмене антигипертензивного лекарственного средства центрального действия. Необходимо избегать внезапной отмены антигипертензивного средства и проводить клинический контроль.

*Лидокаин (внутривенно).* Увеличение концентрации лидокаина в плазме крови с возможным усилением нежелательных неврологических и сердечных эффектов (снижение метаболизма лидокаина в печени). Рекомендуются клинический и электрокардиографический контроль и, возможно, определение концентрации лидокаина в плазме крови как во время лечения бета-адреноблокаторами, так и после его прекращения. При необходимости – коррекция дозы лидокаина.

Комбинации, требующие особого внимания.

*Нестероидные противовоспалительные препараты (системного действия), в том числе селективные ингибиторы ЦОГ-2.* Снижение гипотензивного эффекта (угнетение вазодилатирующих простагландинов нестероидными противовоспалительными препаратами и задержка жидкости и натрия пиразолоновыми производными).

*Блокаторы кальциевых каналов (дигидропиридины).* Артериальная гипотензия, недостаточность кровообращения у пациентов с латентной или неконтролируемой сердечной недостаточностью. Лечение бета-адреноблокаторами может минимизировать рефлекторные симпатические механизмы, которые запускаются при чрезмерных гемодинамических реакциях.

*Антидепрессанты, родственные с имипрамином, нейролептики.* Усиление гипотензивного эффекта и риск ортостатической гипотензии (аддитивное действие).

*Мефлохин.* Риск брадикардии (аддитивное действие относительно развития брадикардии).

*Дипиридамол (внутривенно).* Усиление антигипертензивного эффекта.

*Альфа-блокаторы, применяющиеся в урологии (альфузозин, доксазозин, празозин, тамсулозин, теразозин).* Усиление антигипертензивного эффекта. Повышенный риск ортостатической гипотензии.

*Амифостин.* Усиление антигипертензивного эффекта.

*Сердечные гликозиды.* Комбинация, которая может удлинять время атриовентрикулярной проводимости и вызывать брадикардию.

*Финголимод.* Одновременное применение финголимода с бета-блокаторами может потенцировать брадикардический эффект и поэтому эта комбинация не рекомендована. Если нужно одновременное применение, необходим соответствующий мониторинг с момента начала лечения; рекомендовано как минимум проводить ночной мониторинг.

*Йодсодержащие контрастные вещества.* В случае возникновения шока или артериальной гипотензии на введение йодсодержащих контрастных веществ бета-блокаторы вызывают снижение сердечно-сосудистых компенсаторных реакций.

Когда возможно, лечение бета-блокаторами следует прекратить перед проведением радиографического исследования. Если применение является необходимым, врач должен иметь возможность проведения интенсивной терапии.

*Кортикостероиды и тетракозактид.* Снижение антигипертензивного эффекта (задержка воды и натрия в комбинации с кортикостероидами).

### **Особенности применения**

Никогда не следует внезапно прекращать лечение лекарственным средством у больных со стенокардией: резкое прекращение применения лекарственного средства может привести к серьезным нарушениям сердечного ритма, инфаркту миокарда или внезапному летальному исходу.

В связи с наличием лактозы это лекарственное средство противопоказано пациентам с врожденной галактоземией, мальабсорбцией глюкозы/галактозы или синдромом дефицита лактазы.

## Меры предосторожности при применении.

*Отмена лекарственного средства.* Лечение лекарственным средством не следует прекращать внезапно, особенно для больных с ишемической болезнью сердца. Дозу необходимо снижать постепенно, в течение 1-2 недель, а при необходимости можно одновременно начать заместительную терапию, чтобы избежать прогрессирования стенокардии.

*Бронхиальная астма и хроническое обструктивное заболевание легких.* Бета-адреноблокаторы можно назначать только больным с умеренной степенью тяжести заболевания, с выбором селективного бета-адреноблокатора в низкой начальной дозе. Перед началом лечения рекомендуется провести оценку дыхательной функции. При развитии приступов во время лечения можно применять бронходилататоры (бета<sub>2</sub>-адреномиметики).

*Сердечная недостаточность.* Для лечения больных с нерифрактерной сердечной недостаточностью лекарственное средство при необходимости можно применять под тщательным медицинским наблюдением в низких дозах, которые постепенно повышаются.

*Брадикардия.* Дозу необходимо уменьшить, если частота сердечных сокращений в состоянии покоя ниже 50-55 ударов за минуту и у больного есть клинические проявления брадикардии.

*Атриовентрикулярная блокада I степени.* Учитывая отрицательный дромотропный эффект бета-блокаторов, лекарственное средство с осторожностью следует назначать пациентам с атриовентрикулярной блокадой I степени.

*Стенокардия Принцметала.* Количество и длительность приступов стенокардии могут увеличиться при применении бета-блокаторов у больных с стенокардией Принцметала.



Применение лекарственного средства возможно при заболевании умеренной степени тяжести и при условии, что лечение проводить одновременно с применением сосудорасширяющих средств.

*Нарушения периферического кровообращения.* Бета-адреноблокаторы могут приводить к ухудшению состояния больных с нарушениями периферического кровообращения (болезнь Рейно или синдром Рейно, артериит или хронические облитерирующие заболевания артерий нижних конечностей). В таких случаях рекомендуется применять кардиоселективный бета-блокатор с наличием свойств частичного агониста бета-рецепторов; назначать его следует с осторожностью.

*Феохромоцитома.* При применении бета-адреноблокаторов для лечения артериальной гипертензии, вызванной феохромоцитомой, нужен тщательный мониторинг артериального давления.

*Пациенты пожилого возраста.* У пациентов пожилого возраста обязательным является строгое соблюдение рекомендаций относительно противопоказаний. Нужно быть осторожными: лечение пациентов пожилого возраста следует начинать с малой дозы и под тщательным наблюдением (см. раздел «Способ применения и дозы»).

*Больные с почечной недостаточностью.* Для пациентов с почечной недостаточностью дозировку необходимо корректировать в зависимости от концентрации креатинина в крови или клиренса креатинина (см. раздел «Способ применения и дозы»).

*Пациенты больные сахарным диабетом.* Следует предупредить больного о необходимости усилить самоконтроль уровня глюкозы в крови в начале лечения. Продромальные симптомы гипогликемии могут быть замаскированными, особенно тахикардия, ощущение сердцебиения и повышенная потливость (см. разделы «Взаимодействие с другими лекарственными средствами» и «Побочные реакции»).

*Псориаз.* Назначение лекарственного средства требует тщательной оценки необходимости его применения, поскольку есть сообщения об ухудшении состояния больных с псориазом во время лечения бета-адреноблокаторами (см. раздел «Побочные реакции»).

*Аллергические реакции.* У пациентов, склонных к тяжелым анафилактическим реакциям, особенно связанных с применением флоктафенина (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами»), или при проведении десенсибилизации терапия бета-адреноблокаторами может привести к дальнейшему усилению реакции и снижению эффективности лечения этого состояния обычными дозами адреналина.

*Общая анестезия.* Бета-блокаторы вызывают ослабление рефлекторной тахикардии и увеличивают риск артериальной гипотензии. Продолжение лечения бета-блокаторами снижает риск развития аритмии, миокардиальной ишемии и гипертонических кризов. Следует сообщить анестезиологу о том, что больной проходит лечение бета-блокатором.

При необходимости прекращения лечения и отмены лекарственного средства считается достаточным 48 часов для восстановления чувствительности к катехоламинам.

Терапию бета-адреноблокаторами не следует прекращать:

- у больных с коронарной недостаточностью, которым желательно применять лекарственное средство до операции, учитывая риск, связанный с внезапной отменой бета-адреноблокаторов;
- в случае urgentных операций или в тех случаях, когда прекращение лечения невозможно.

Больного нужно защитить от последствий возбуждения блуждающего нерва, назначая премедикацию атропином, с повторением при необходимости. Для анестезии необходимо применять средства, угнетающие миокард в наименьшей степени, а потеря крови должна быть компенсирована.

Необходимо учитывать риск развития анафилактических реакций.

*Офтальмология.* Блокада бета-адренорецепторов обуславливает снижение внутриглазного давления и может приводить к изменению результатов скринингового исследования на глаукому. Офтальмолог должен быть проинформирован о том, что пациент применяет бетаксолол. За пациентами, применяющими бета-блокаторы и системно, и в виде глазных капель, необходимо установить наблюдение, учитывая возможный аддитивный эффект этих лекарственных средств.

*Тиреотоксикоз.* Бета-блокаторы маскируют сердечно-сосудистые симптомы тиреотоксикоза.

*Спортсмены.* Спортсмены должны учитывать, что лекарственное средство содержит активную субстанцию, которая может давать положительную реакцию при проведении тестов антидопингового контроля.

Лекарственное средство содержит лактозу, поэтому его противопоказано применять пациентам с редкими наследственными формами непереносимости галактозы, недостаточностью лактазы или синдромом глюкозо/галактозной мальабсорбции.

### **Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами**

Исследования по изучению влияния бетаксолола на способность управления автотранспортом не проводились. При управлении автотранспортом или работе с другими механизмами необходимо учитывать, что на фоне приема данного препарата иногда могут возникать головокружение, нарушение остроты зрения и другие побочные реакции, что может негативно повлиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или другими механизмами.

### **Применение в период беременности или кормления грудью**

*Беременность.*

Тератогенный аспект. В настоящее время нет сообщений о тератогенных эффектах у людей, а также информации о выявлении врожденных пороков развития.

Неонатальный аспект. Действие бета-адреноблокатора сохраняется в течение нескольких дней после рождения у новорожденных, матери которых получали лечение данным лекарственным средством. Хотя этот остаточный эффект может не иметь клинических последствий, тем не менее сохраняется возможность развития сердечной недостаточности. В таком случае новорожденного необходимо поместить в отделение интенсивной терапии (см. раздел «Передозировка»), а также следует избегать применения плазмозаменителей (из-за риска развития острого отека легких). Также есть сообщения о случаях развития брадикардии, респираторного дистресс-синдрома и гипогликемии. В связи с этим рекомендуется тщательное наблюдение за новорожденным в специализированных условиях (контроль частоты сердечных сокращений и уровня глюкозы в крови в течение первых 3-5 дней жизни).

В связи с этим применение бетаксолола в период беременности не рекомендуется, за исключением случаев, когда польза от применения препарата превышает возможные риски.

*Кормление грудью.*

Бета-адреноблокаторы проникают в грудное молоко. Кормление грудью в период лечения лекарственным средством следует прекратить, поскольку риск развития гипогликемии или брадикардии у новорожденных не исследовался.

### **Способ применения и дозы**

Обычная доза при артериальной гипертензии и для профилактики приступов стенокардии напряжения - 1 таблетка по 20 мг в сутки.

Дозирование для больных с почечной недостаточностью. У больных с почечной недостаточностью клиренс бетаксолола уменьшается со снижением функции почек. Дозу необходимо адаптировать к состоянию почечной функции больного:

при клиренсе креатинина  $\geq 20$  мл/мин коррекции дозы не требуется. Однако рекомендуется проводить клиническое наблюдение, начиная с 1-й недели лечения до достижения равновесных уровней препарата в крови (в среднем 4 суток).

Для больных с тяжелой почечной недостаточностью (клиренс креатинина  $< 20$  мл/мин) рекомендуемая начальная доза составляет 10 мг в сутки (независимо от частоты и расписания процедур диализа у больных, которым проводится гемодиализ).

Для больных с печеночной недостаточностью нет необходимости корректировать дозу; однако в начале терапии желательно клиническое наблюдение.

## **Дети**

Безопасность и эффективность применения лекарственного средства у детей не установлены, поэтому применение его этой категории пациентов противопоказано.

## **Передозировка**

Симптомы передозировки лекарственного средства: брадикардия или чрезмерное снижение артериального давления.

При брадикардии или чрезмерном снижении артериального давления необходимо ввести:

- 1-2 мг атропина внутривенно;
- 1 мг глюкагона (введение препарата повторить при необходимости);
- при необходимости провести медленную инфузию 25 мкг изопреналина или вводить 2,5-10 мкг/кг/мин добутамина.

При сердечной декомпенсации у новорожденных, матери которых в период беременности применяли бета-адреноблокаторы:

- глюкагон в дозе 0,3 мг/кг массы тела;
- госпитализация в отделение интенсивной терапии;
- изопреналин и добутамин: обычно в достаточно высоких дозах и длительное время, под наблюдением специалиста.

## **Побочные реакции**

*Со стороны кожи и подкожной клетчатки:* кожные реакции, включая псориазоподобную сыпь или обострение псориаза (см. раздел «Особенности применения»); крапивница, зуд, гипергидроз.

*Со стороны нервной системы:* головокружение, головная боль; дистальная парестезия; летаргия.

*Со стороны органов зрения:* ощущение сухости в глазах, нарушение остроты зрения.

*Со стороны психики:* астения, бессонница, усталость; депрессия; ночные кошмары, спутанность сознания, галлюцинации.

*Со стороны желудочно-кишечной системы:* желудочно-кишечные расстройства (боль в животе, диарея, тошнота и рвота).

*Со стороны метаболизма и нутритивные расстройства:* гипогликемия, гипергликемия, брадикардия (возможно, тяжелая); замедление атриовентрикулярной проводимости или усиление существующей атриовентрикулярной блокады, сердечная недостаточность, снижение артериального давления.

*Со стороны сосудов:* похолодание конечностей; синдром Рейно, ухудшение перемежающейся хромоты.

*Со стороны респираторной системы, грудной клетки и средостения:* бронхоспазм, диспноэ.

*Со стороны репродуктивной системы:* импотенция.

*Лабораторные показатели.* Редко наблюдается появление антинуклеарных антител, которое только в исключительных случаях сопровождалось клиническими проявлениями типа системной красной волчанки, которые проходят после прекращения лечения.

### **Срок годности**

4 года.

### **Условия хранения**

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

### **Упаковка**

По 10 таблеток в блистере; по 3 блистера в пачке.

### **Категория отпуска**

По рецепту.

### **Производитель**

АО «КИЕВСКИЙ ВИТАМИННЫЙ ЗАВОД».

### **Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности**

04073, Украина, г. Киев, ул. Копыловская, 38.

### **Источник инструкции**

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).