

## **Состав**

*действующее вещество:* бетаксоллол;

1 таблетка содержит бетаксоллола гидрохлорида 20 мг;

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

*оболочка:* гипромеллоза, титана диоксид (Е 171), полиэтиленгликоль.

## **Лекарственная форма**

Таблетки, покрытые оболочкой.

*Основные физико-химические свойства:* белого цвета двояковыпуклые круглые таблетки, покрытые оболочкой, с линией распределения с одной стороны и гравировкой с другой.

## **Фармакотерапевтическая группа**

Селективные блокаторы бета-адренорецепторов. Код АТХ С07А В05.

## **Фармакодинамика**

*Бетаксоллол 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. Бетаксоллол 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**

- Гиперчувствительность к бетаксололу или к любой другой составляющей препарата.
- Тяжелые формы бронхиальной астмы и хронического обструктивного заболевания легких.
- Сердечная недостаточность, не контролируется лечением.
- Кардиогенный шок.
- Блокада II и III степени у больных, не имеющих водителя ритма.
- Стенокардия Принцметала (противопоказана монотерапия препаратом при изолированной / типовой форме этого заболевания).
- Дисфункция синусового узла (включая синоатриальную блокаду).
- Брадикардия (частота сердечных сокращений <45-50 уд / мин).
- Тяжелые формы синдрома Рейно и других заболеваний периферических артерий.
- Нелеченная феохромоцитома.
- Артериальная гипотензия.
- Анафилактические реакции в анамнезе.
- Метаболический ацидоз.
- Препарат противопоказан для применения в комбинации с флоктафенином и сультопридом (см. Раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»).

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

*Препараты, вызывающие брадикардию.*

Брадикардия может быть обусловлена целым рядом лекарственных средств: бета-адреноблокаторами, антиаритмическими препаратами класса Ia, некоторыми антиаритмическими препаратами класса III, некоторыми блокаторами кальциевых каналов, препаратами наперстянки, пилокарпином и антихолинэстеразными препаратами.

При применении бета-блокаторов, в том числе лекарственного средства ЛОКРЕНА в комбинации с другими лекарственными средствами, для которых известен эффект индуцирования остановки синусового узла, возможна остановка синусового узла (см. Раздел «Побочные реакции»).

#### Нежелательные комбинации.

*Дилтиазем.* Сообщалось о случаях нарушения автоматизма (чрезмерная брадикардия, остановка синусового узла), нарушения синоатриальной и AV проводимости, сердечной недостаточности. Одновременное применение с бетаксололом требует тщательного клинического и электрокардиографического мониторинга, особенно у пациентов пожилого возраста или в начале лечения.

Сообщалось о повышенном риске депрессии в случае одновременного применения бета-адреноблокаторов и дилтиазема (см. Раздел «Побочные реакции»).

*Верапамил.* Сообщалось о случаях нарушения автоматизма (чрезмерная брадикардия, остановка синусового узла), нарушения синоатриальной и AV проводимости, сердечной недостаточности. Одновременное применение с бетаксололом требует тщательного клинического и электрокардиографического мониторинга, особенно у пациентов пожилого возраста или в начале лечения.

*Финголимод.* Одновременное применение Финголимод с бета-блокаторами может усиливать эффекты замедления сердечного ритма, что может приводить к летальному исходу. Это особенно актуально для бета-блокаторов, которые подавляют адренергические компенсаторные механизмы.

Необходим непрерывный клинический и ЭКГ-контроль в течение 24 часов после первой дозы препарата.

#### Комбинации, требующие мер при одновременном применении.

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

Необходим клинический и ЭКГ-контроль.

Летучие анестетики, содержащие галоген. Бета-адреноблокаторы вызывают снижение сердечно-сосудистых компенсаторных реакций. Ингибирования бета-адренорецепторов во время оперативного вмешательства можно устранить с помощью бета-стимуляторов. Как правило, терапию бета-блокаторами не следует прекращать, а резкой отмены препарата следует избегать в любом случае. Необходимо сообщить анестезиолога о лечении бета-блокаторами, что производится.

Антиаритмические препараты I класса (кроме лидокаина): цибензолин, дизопирамид, флекаинид, гидрохинидин, мексилетин, пропрафенон, хинидин. Нарушение сократимости, автоматизма и проводимости миокарда (угнетение симпатических компенсаторных механизмов).

Необходим клинический и ЭКГ-контроль.

Антигипертензивные препараты центрального действия (клонидин, метилдопа, гуанфацин, моксонидин, рименидин). Выраженное повышение артериального давления в случае внезапной отмены антигипертензивных препаратов центрального действия. Следует избегать внезапного прекращения лечения антигипертензивными препаратами центрального действия.

Необходим клинический контроль.

Инсулин, производные сульфонилмочевины, глиниды, глиптины. Все бета-блокаторы могут маскировать некоторые симптомы гипогликемии, такие как ощущение усиленного сердцебиения и тахикардия. Пациента следует предупредить об этом и о необходимости усилить самоконтроль уровня сахара в крови, особенно в начале лечения (см. Раздел «Особенности применения»).

Лидокаин (внутривенно). Увеличение концентрации лидокаина в плазме крови с возможным усилением неврологических и сердечных побочных реакций (снижение метаболизма лидокаина в печени). Рекомендуется клинический и ЭКГ-контроль и в случае необходимости определения концентрации лидокаина в плазме крови как при лечении бета-адреноблокаторами, так и после его прекращения. В случае необходимости корректируют дозу лидокаина.

Препараты, которые могут провоцировать пароксизмальную желудочковую тахикардию типа «torsades de pointes». Повышение риска развития желудочковой аритмии и особенно пароксизмальную тахикардию типа «torsades de pointes». Необходим клинический и ЭКГ-контроль.

Пропрафенон. Нарушение сократимости, автоматизма и проводимости миокарда (угнетение симпатических компенсаторных механизмов). Необходим клинический и ЭКГ-контроль.

## Комбинации, которые требуют особого внимания.

Альфа-блокаторы, применяемые в урологии. Усиление антигипертензивного эффекта. Повышенный риск ортостатической гипотензии.

Антигипертензивные альфа-блокаторы. Усиление антигипертензивного эффекта. Повышенный риск ортостатической гипотензии.

Нестероидные противовоспалительные препараты. Снижение антигипертензивного эффекта (индуцированное НПВП подавление вазодилатирующих простагландинов и задержка жидкости и натрия фенилбутаноном).

Другие лекарственные средства, вызывающие брадикардию. Риск развития чрезмерной брадикардии (аддитивный эффект).

Дигидропиридина (амлодипин, барнидипин, клеvidипин, фелодипин, исрадипин, лацидипин, лерканидипин, манидипин, никардипин, нифедипин, нимодипин, нитрендипин). Артериальная гипотензия, сердечная недостаточность у пациентов с латентной или неконтролируемой сердечной недостаточностью (аддитивные негативные инотропные эффекты). Лечение бета-блокаторами также может минимизировать рефлекторную симпатическую ответ, запускается в случае чрезмерных гемодинамических эффектов.

Дипиридамол (внутривенное применение). Повышенный антигипертензивный эффект.

Производные нитратов / нитритов. Увеличение риска развития артериальной гипотензии, особенно ортостатической гипотензии.

Лекарственные средства, которые способствуют возникновению ортостатической гипотензии (особенно нитраты, ингибиторы фосфодиэстеразы типа 5, альфа-блокаторы при приеме за урологическими показаниям, Имипраминовые антидепрессанты, нейролептики класса фенотиазин, агонисты допамина и леводопа). Риск развития артериальной гипотензии, особенно ортостатической гипотензии.

## **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 нерезервированной 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 бетаксол. 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.

Это лекарственное средство содержит 4 мг / доза натрия. Следует соблюдать осторожность при применении у пациентов, применяют натрий-контролируемую диету.



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

Исследований влияния бетаксолола на способность управлять автотранспортом не проводили. При управлении автотранспортом или работе с другими механизмами необходимо учитывать, что на фоне приема этого препарата иногда могут возникать головокружение или повышенная утомляемость.

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

### *Беременность.*

В исследованиях на животных не было выявлено никаких тератогенных эффектов препарата. До сих пор нет сообщений о тератогенных эффектах у людей, а в результате контролируемых проспективных исследований нескольких бета-адреноблокаторов не было обнаружено никаких врожденных пороков развития.

Некоторые бета-адреноблокаторы могут уменьшать перфузию плаценты.

Действие бета-адреноблокатора сохраняется в течение нескольких дней после рождения у новорожденных, матери которых получали лечение данным лекарственным средством, и может привести к брадикардии, респираторный дистресс и гипогликемию, но чаще всего это остаточный эффект не имеет никаких клинических последствий. Однако высокие дозы бета-блокаторов могут обусловить развитие сердечной недостаточности из-за ослабления сердечно-сосудистых компенсаторных реакций. В случае возникновения сердечной недостаточности новорожденного необходимо госпитализировать в отделение интенсивной терапии (см. Раздел «Передозировка»), а также следует избегать применения плазмозаменителей (из-за риска развития острого отека легких).

Применение бетаксолола в период беременности не рекомендуется, за исключением случаев, когда польза от применения препарата превышает возможные риски. Если лечение продолжается до самого рождения ребенка, рекомендуется тщательное наблюдение за новорожденным в специализированных условиях (контроль частоты сердечных сокращений и уровня глюкозы в крови в течение первых 3-5 дней жизни).

### *Кормление грудью.*

Бета-адреноблокаторы проникают в грудное молоко. Кормление грудью в период лечения препарата Локрен<sup>®</sup> следует прекратить, поскольку риск развития гипогликемии или брадикардии у новорожденных не исследовалась.

## **Способ применения и дозы**

Препарат предназначен для перорального применения.

Обычная доза для лечения артериальной гипертензии и для профилактики приступов стенокардии напряжения - 1 таблетка по 20 мг один раз в сутки. Календарная упаковка, на которой обозначены дни недели, обеспечивает лучшие условия для лечения, облегчая для пациента соблюдения инструкций по приему лекарственного средства.

### Дозирование для пациентов с почечной недостаточностью.

Дозу необходимо корректировать в зависимости от состояния функции почек больного.

При КК <sup>3</sup> 20 мл / мин коррекция дозы не требуется. Однако рекомендуется проводить клиническое наблюдение со старта терапии и до достижения равновесных уровней препарата в крови (в среднем 4 суток).

Для пациентов 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).

### Дозирование для пациентов с печеночной недостаточностью.

Нет необходимости корректировать дозу однако в начале терапии рекомендуется 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**

Частота побочных реакций классифицирована по следующим категориям: очень часто ( $\geq 1 / 10$ ), часто (от  $\geq 1/100$  до  $<1/10$ ), нечасто (от  $\geq 1/1000$  до  $<1/100$ ), редко (от  $\geq 1 / 10000$  до  $<1/1000$ ), очень редко ( $<1/10\ 000$ ), частота неизвестна (нельзя оценить по доступным данным).

Побочные реакции представлены в рамках каждого класса в порядке убывания частоты.

*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 сопровождалась клиническими проявлениями типа системной красной волчанки, которые проходят после прекращения лечения.

#### Сообщение о подозреваемых побочных реакциях

Сообщение о подозреваемых побочных реакциях, которые возникли после регистрации препарата, очень важны. Это позволяет продолжать мониторить соотношение польза / риск для этого лекарственного средства. Медицинских работников просят сообщать обо всех подозреваемых побочных реакциях через национальную систему сообщений.

#### **Срок годности**

3 года.

#### **Условия хранения**

Хранить в недоступном для детей месте. Не требует специальных условий хранения.

#### **Упаковка**

По 14 таблеток в блистере, по 2 блистера в картонной коробке.

#### **Категория отпуска**

По рецепту.

#### **Производитель**

САНОФИ Уинтроп ИНДАСТРИА.

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

30-36 авеню Гюстав Эйфель, ТУРЗ, 37100, Франция.

## **Источник инструкции**

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