

ИНСТРУКЦИЯ  
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА  
**БЕТАКСОЛОЛ**

Регистрационный номер: ЛП-002502

Торговое наименование: Бетаксолол

Международное непатентованное наименование: бетаксолол

Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Состав

Одна таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит:

**Действующее вещество:**  
бетаксолола гидрохлорид – 20,0 мг

**Вспомогательные вещества:**

лактозы моногидрат (сахар молочный) – 128,1 мг, микрокристаллическая целлюлоза – 85,8 мг, магния стеарат – 2,5 мг, карбоксиметилкрахмал натрия (примогель) – 7,4 мг, аэросил (кремния диоксид коллоидный) – 1,2 мг.

**Пленочная оболочка:**

опадрай II белый 85F18422 [поливиниловый спирт – 2,0 мг, титана диоксид – 1,25 мг, макрогол (полиэтиленгликоль) – 1,01 мг, тальк – 0,74 мг].

**Описание:** Таблетки белого или почти белого цвета, двояковыпуклые круглые, покрытые пленочной оболочкой с риской. На разрезе – ядро белого или почти белого цвета.

**Фармакотерапевтическая группа:**  $\beta_1$ -адреноблокатор селективный.

**Код АТХ:** С07А05

**Фармакологические свойства**

**Фармакодинамика**

Бетаксолол характеризуется следующими тремя фармакологическими свойствами:

– кардиоселективное  $\beta_1$ -адреноблокирующее действие;

– отсутствие частичной агонистической активности (отсутствие внутренней симпатомиметической активности);

– слабое мембраностабилизирующее действие (подобное действию хинидина или местных анестетиков) в концентрациях, превышающих терапевтические.

Следует отметить, что селективное воздействие бетаксолола на  $\beta_1$ -адренергические рецепторы не является абсолютным, так при применении его в высоких дозах возможно воздействие бетаксолола на  $\beta_2$ -адренергические рецепторы, расположенные, главным образом, в гладкой мускулатуре бронхов и сосудов (однако воздействие бетаксолола на  $\beta_2$ -адренорецепторы значительно слабее такового у неселективных  $\beta$ -адреноблокаторов).

При применении бетаксолола его блокирующая  $\beta_1$ -адренергические рецепторы активность проявляется следующими фармакодинамическими эффектами:

– уменьшение частоты сердечных сокращений (ЧСС) в покое и при физической нагрузке (за счет блокады  $\beta_1$ -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 артериального давления (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  $\beta$ -адреноблокаторов полностью не установлен. У  $\beta$ -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 часа (время достижения максимальной концентрации бетаксолола в крови) и через 24 часа (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 атриовентрикулярного узла.

**Фармакокинетика**

**Всасывание**

Бетаксолол быстро и полностью (100 %) абсорбируется из желудочно-кишечного тракта.

Бетаксолол имеет незначительный эффект «первичного прохождения» через печень и высокую биодоступность – около 85 %. Максимальные концентра-

ции бетаксолола в плазме крови достигаются через 2-4 часа. Различия его плазменных концентраций у разных пациентов или у одного пациента при

длительном применении имеют незначительные различия, что связано с высокой биодоступностью бетаксолола.

Фармакокинетика бетаксолола является линейной после приема внутрь в

дозах 5-40 мг.

**Распределение**

Бетаксолол связывается с белками плазмы крови примерно на 50 %.

Проницаемость через гематоэнцефалический и плацентарный барьер – низкая. Секрция с грудным молоком – незначительная.

Объем распределения – около 6 л/кг. Растворимость в жирах умеренная.

**Метаболизм**

В организме бетаксолол в основном превращается в неактивные метаболиты.

**Выведение**

Выводится почками в виде метаболитов (более 80 %), 10-15 % в неизменном виде. Период полувыведения ( $T_{1/2}$ ) бетаксолола составляет 15-20 часов.

**Пациенты с нарушением функции почек**

Клиренс бетаксолола снижается пропорционально увеличению тяжести почечной недостаточности. У пациентов с почечной недостаточностью, находящихся на гемодиализе, АUC и  $T_{1/2}$  бетаксолола увеличиваются вдвое.

Бетаксолол не удаляется при диализе.

**Пациенты с нарушением функции печени**

При нарушении функции печени  $T_{1/2}$  увеличивается на 33 %, но клиренс не

изменяется.

**Пациенты пожилого возраста**

Результаты некоторых исследований свидетельствуют о возможности замедления выведения бетаксолола и увеличения  $T_{1/2}$  до 30 часов.

**Показания к применению**

– артериальная гипертензия (в монотерапии и составе комбинированной

терапии);

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

**Противопоказания**

– повышенная чувствительность к бетаксололу и вспомогательным веществам препарата;

– 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 (ангиотензинпревращающего фермента), другими вазодилататорами;

– кардиогенный шок;

– атриовентрикулярная блокада II и III степени (без установленного электрокардиостимулятора);

– стенокардия Принцметала (противопоказана монотерапия);

– синдром слабости синусового узла (включая синоатриальную блокаду);

– выраженная брадикардия (ЧСС менее 50 уд./мин);

– тяжелые формы болезни Рейно и облитерирующих заболеваний периферических артерий;

– феохромоцитома без одновременного приема  $\alpha$ -адреноблокаторов;

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

– анафилактические реакции в анамнезе;

– метаболический ацидоз;

– одновременное применение с флоксафенином (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами»);

– одновременное применение с сультопридом (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами»);

– одновременное применение ингибиторов моноаминоксидазы (MAO);

– кардиомиопатия (без признаков сердечной недостаточности);

– возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены);

– период грудного вскармливания (см. раздел «Применение при беременности и в период грудного вскармливания»);

– дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция (в связи с наличием в составе препарата лактозы).

**С осторожностью**

– бронхиальная астма и хроническая обструктивная болезнь легких среднего и тяжелого течения;

– хроническая сердечная недостаточность в стадии компенсации;

– атриовентрикулярная блокада I степени;

– облитерирующие заболевания периферических артерий, синдром Рейно (за исключением тяжелой формы, см. раздел «Противопоказания»);

– стенокардия Принцметала;

– леченная феохромоцитома;

– почечная недостаточность;

– печеночная недостаточность;

– сахарный диабет;

– псориаз;

– брадикардия (ЧСС менее 60 уд./мин);

– тиреотоксикоз;

– хирургические вмешательства и общая анестезия;

– аллергические реакции в анамнезе;

– беременность;

– у пациентов пожилого возраста;

– при проведении десенсибилизирующей терапии.



#### Применение при беременности и в период грудного вскармливания

##### Беременность

В экспериментах на животных у бетаксолола не было обнаружено тератогенного действия. До настоящего времени не сообщалось о тератогенных эффектах у человека.

Как правило,  $\beta$ -адреноблокаторы снижают кровоток в плаценте, что может привести к внутриутробной гибели плода, ранним и преждевременным родам. Следует отслеживать кровоток в плаценте и матке, а также наблюдать за острым и развитием будущего ребенка, и в случае появления нежелательных влений в отношении беременности и/или плода, принимать альтернативные терапевтические меры. Следует тщательно обследовать новорожденного после родов. В неонатальном и постнатальном периоде у новорожденных имеется повышенный риск кардиальных и дыхательных осложнений, так как действие  $\beta$ -адреноблокаторов, принимаемых матерями перед родами, сохраняется у новорожденных в течение нескольких дней после рождения. В случае возникновения сердечной недостаточности требуется госпитализация новорожденного в блок интенсивной терапии (см. раздел «Передозировка»). Избежать применения плазмозаместителей (риск развития острого легкого). 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 Бетаксолол при беременности не рекомендуется и возможно только в том случае, когда польза для матери превышает потенциальный риск для плода или ребенка.

##### Грудное вскармливание

$\beta$ -адреноблокаторы, включая бетаксолол, выделяются с грудным молоком (см. раздел «Фармакокинетика»). Риск гипогликемии или брадикардии у грудных детей не изучался, поэтому в качестве меры предосторожности кормление грудью в период лечения необходимо прекратить.

##### Способ применения и дозы

Препарат принимается внутрь и запивается достаточным количеством жидкости. Не следует разжевывать таблетки.

Начальная доза препарата Бетаксолол для обоих показателей к применению препарата составляет обычно 10 мг (1/2 таблетки 20 мг). Если в течение 7-14 дней лечения не достигаются целевые значения АД, то доза удваивается до 20 мг в сутки. Максимальная суточная доза препарата Бетаксолол – 40 мг. При артериальной гипертензии обычно не рекомендуется применение препарата Бетаксолол в дозах, превышающих 20 мг в сутки (в связи с тем, что при увеличении дозы более 20 мг не наблюдается статистически достоверного увеличения антигипертензивного эффекта препарата).

##### Пациенты с почечной недостаточностью

Рекомендуется коррекция дозы в зависимости от функционального состояния почек пациента.

При клиренсе креатинина (КК) более 20 мл/мин коррекция 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-му дню лечения.

При выраженной почечной недостаточности (КК менее 20 мл/мин) рекомендуемая начальная доза препарата составляет 5 мг/сутки (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.

##### Пациенты с печеночной недостаточностью

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

##### Побочное действие

Нежелательные реакции представлены по системам органов в соответствии с классификацией Медицинского словаря по нормативно-правовой деятельности (MedDRA). Частота возникновения побочных эффектов определена в соответствии с классификацией Всемирной Организации Здравоохранения: очень часто ( $\geq 10\%$ ), часто ( $\geq 1\%$  и  $< 10\%$ ); нечасто ( $\geq 0,1\%$  и  $< 1\%$ ); редко ( $\geq 0,01\%$  и  $< 0,1\%$ ); очень редко ( $< 0,01\%$ ); частота неизвестна (определять частоту возникновения побочного действия по имеющимся данным не представляется возможным).

##### Нарушения со стороны обмена веществ и питания

Очень редко: гипогликемия, гипергликемия.

##### Нарушения психики

Часто: астения, бессонница.

Редко: депрессия.

Очень редко: галлюцинации, спутанность сознания, ночные кошмары.

##### Нарушения со стороны нервной системы

Часто: головокружение, головная боль.

Очень редко: парестезия в дистальных отделах конечностей.

Частота неизвестна: летаргия.

##### Нарушения со стороны органа зрения

Редко: сухость глаз.

Очень редко: нарушения зрения.

##### Нарушения со стороны сердца

Часто: брадикардия (возможно тяжелая).

Редко: сердечная недостаточность, выраженное снижение АД, замедление атриовентрикулярной проводимости или усугубление атриовентрикулярной блокады.

Частота неизвестна: остановка синусового узла у предрасположенных па-

циентов (например, пожилые пациенты или пациенты с брадикардией, дисфункционацией синусового узла или атриовентрикулярной блокадой).

##### Нарушения со стороны сосудов

Часто: снижение кожной температуры верхних и нижних конечностей.

Редко: синдром Рейно, усиление нарушений периферического кровообращения, в том числе и «пережимающейся хромоты».

##### Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения

Редко: бронхоспазм.

##### Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта

Часто: гастралгия, диарея, тошнота, рвота.

##### Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей

Редко: кожные реакции, включая псориазоподобные высыпания или об-

острение течения псориаза (см. раздел «С осторожностью»).

Частота неизвестна: крапивница, кожный зуд, гипергидроз.

##### Нарушения со стороны половых органов и молочной железы

Часто: импотенция.

##### Лабораторные и инструментальные данные

Редко: появление антиядерных антител, только в исключительных случаях сочетается с клиническими проявлениями волчаночноподобного синдрома, исчезающего после прекращения приема препарата.

##### Передозировка

###### Симптомы

Тяжелая брадикардия, головокружение, атриовентрикулярная блокада, выраженное снижение АД, аритмии, желудочковая экстрасистолия, обморочное состояние, сердечная недостаточность, затруднение дыхания, бронхоспазм, цианоз ногтей пальцев и ладоней, судороги.

Промывание желудка, применение адсорбирующих средств.

В случае развития брадикардии рекомендуется:

- атропин 1-2 мг внутривенно;
- затем (в случае необходимости) медленная инфузия 25 мкг изопrenalина или инфузия добутамина 2,5-10 мкг/кг/мин;

При брадикардии иногда может потребоваться временная постановка искусственного водителя ритма.

При выраженном снижении АД рекомендуется:

- внутривенное введение плазмозамещающих растворов и вазопрессорных препаратов.

###### При бронхоспазме:

- назначение бронходилататоров, в том числе  $\beta_2$ -адреномиметиков и/или аминофиллина.

В случае сердечной недостаточности (декомпенсации) у новорожденных, матери которых в период беременности принимали  $\beta$ -адреноблокаторы, рекомендуется:

- госпитализация в отделение интенсивной терапии;
- изопrenalин и добутамин: длительно и обычно в высоких дозах, наблюдение специалиста.

##### Взаимодействие с другими лекарственными средствами

###### Противопоказанные комбинации

###### С флоксафенином

В случае шока или артериальной гипотензии, обусловленной флоксафенином,  $\beta$ -адреноблокаторы вызывают снижение компенсаторных сердечно-сосудистых реакций.

###### С сульпридом

Нарушения автоматизма сердца (выраженная брадикардия) вследствие дополнительного эффекта, индуцирующего развитие брадикардии.

###### Нерекомендуемые комбинации

###### С амлодипином

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

###### С сердечными гликозидами

Риск развития или усугубления брадикардии, атриовентрикулярной блокады, остановки сердца.

###### С ингибиторами MAO

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

###### С финголимодом

Финголимод может усилить отрицательный хронотропный эффект  $\beta$ -адреноблокаторов и привести к выраженной брадикардии. Одновременное применение финголимодом и бетаксолола не рекомендуется. В случае необходимости одновременного применения указанных препаратов требуется тщательное наблюдение за состоянием пациента. Рекомендуется начинать комбинированную терапию в условиях стационара и осуществлять соответствующий мониторинг (показан длительный контроль ЧСС, по меньшей мере, до утра следующего дня после первого одновременного приема финголимодом и  $\beta$ -адреноблокатора).

###### Комбинации, которые следует применять с осторожностью

С блокаторами «медленных» кальциевых каналов (дилтиазем и верапамил)

Нарушения автоматизма (выраженная брадикардия, остановка синусового узла), нарушения атриовентрикулярной проводимости, сердечная недоста-

точность [синергетические (взаимо усиливающиеся) эффекты].

Такая комбинация может применяться только под тщательным клиническим и электрокардиографическим наблюдением, особенно у пожилых пациентов

или в начале лечения.





## С дилтиаземом

Сообщалось о повышении риска развития депрессии при одновременном применении β-адреноблокаторов с дилтиаземом.

## С йодсодержащими контрастными веществами

В случае развития шока или резкого снижения АД при введении йодсодержащих контрастных веществ, β-адреноблокаторы уменьшают компенсаторные сердечно-сосудистые реакции. Если возможно, то перед проведением рентгенографического исследования с применением йодсодержащих контрастных средств следует отменить лечение β-адреноблокатором. При необходимости продолжения терапии β-адреноблокатором, врач должен обеспечить соответствующие условия для проведения интенсивной терапии.

## С ингаляционными галогенсодержащими анестетиками

β-адреноблокаторы уменьшают компенсаторные сердечно-сосудистые реакции (ингибирование β-адренергических рецепторов может быть уменьшено при введении β-адреноблокаторов). Как правило, лечение β-адреноблокаторами не прекращается и в любом случае следует избегать резкой отмены β-адреноблокаторов. Врачу-анестезиологу необходимо информировать о приеме β-адреноблокатора.

С препаратами, способными вызывать желудочковые нарушения ритма сердца, включая полиморфную желудочковую тахикардию типа «пируэт»

Увеличение риска желудочковых нарушений ритма сердца, в частности полиморфной желудочковой тахикардии типа «пируэт», при одновременном применении бетаксолола с такими препаратами, как:

- антиаритмические лекарственные средства IA класса (хинидин, гидрохинидин, дизопирамид, прокаинамид);
- антиаритмические лекарственные средства III класса (амиодарон, дофетил-лид, ибутирид, бретилия тозилат, дронедазон), соталол;
- другие (нейролептики) лекарственные средства, такие как:
  - нейролептики: фенотиазины (хлорпромазин, циамемазин, левомепромазин, тiorидазин, трифлюоперазин, флуфеназин), бензамиды (амисульприд, сультоприд, сульпирид, тиаприд), бутирофеноны (дроперидол, галоперидол);
  - прочие нейролептики (пимозид, сертиндол);
- антидепрессанты: трициклические антидепрессанты, селективные ингибиторы обратного захвата серотонина (циталопрам, эсциталопрам);
- антибактериальные средства (левлофлоксацин, моксифлоксацин, спарфлоксацин, ципрофлоксацин), макролиды (эритромицин при внутривенном введении, спирамицин при внутривенном введении, азитромицин, кларитромицин, рокситромицин), котримоксазол;
- противогрибковые средства: азолы (вориконазол, итраконазол, кетоконазол, флуконазол); противомаларийные средства (хинин, хлорохин, мефлохин, галопантрин, лумефантрин); противопрозоиные средства (пентамидин при внутривенном введении);
- антиангинальные средства (ранолазин);
- противосудорожные средства (вандатаниб, мышьяка триоксид, оксалиплатин, такролимус);
- противорвотные средства (домперидон, ондансетрон);
- средства, влияющие на моторику желудочно-кишечного тракта (цизаприд);
- антигистаминные средства (астемизол, терфенадин, мизоластин);
- прочие лекарственные средства (анагредид, вазопрессин, дифеманил метилсульфат, кетансерин, пробукол, пропופол, севофлуран, терлипрессин, теродилин, флекаинид, цилостазол).

При одновременном применении бетаксолола с указанными лекарственными средствами требуется тщательный клинический и электрокардиографический контроль.

## С пропранололом и антиаритмическими средствами класса IA (хинидин, гидрохинидин и дизопирамид)

Нарушения сократимости, автоматизма и проводимости (подавление симпатических компенсаторных механизмов). Требуется клинический и электрокардиографический 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 (см. разделы «С осторожностью», «Побочное действие», «Особые указания»)

Все β-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 (донепезил, галантамин, неостигмин, пиридостигмин, ривастигмин)

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

## С гипотензивными средствами центрального действия (клопидин, α-метилдопа, гуанфацин, моксонидин, рилменидин)

Повышенный риск развития брадикардии, нарушения атриовентрикулярной 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, внутривенно 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 электрокардиографическое наблюдение и, возможно, контроль концентрации лидокаина в плазме крови во время лечения β-адреноблокаторами и после его прекращения. При необходимости проводится коррекция дозы лидокаина.

## Комбинации, которые следует принимать во внимание

С нестероидными противовоспалительными препаратами (НПВП) (препаратами с системным действием), включая селективные ингибиторы циклооксигеназы-2 (ЦОГ-2)

Снижение антигипертензивного эффекта бетаксолола (НПВП ингибируют синтез простагландинов и, являясь пиразолоновыми производными, приводят к задержке воды и натрия).

## С блокаторами «медленных» кальциевых каналов из группы дигидропиридинов (нифедипин)

Взаимное усиление антигипертензивного действия блокаторов «медленных» кальциевых каналов и бетаксолола, развитие сердечной недостаточности у пациентов с латентной или неконтролируемой сердечной недостаточностью. Лечение β-адреноблокаторами может также 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 развития ортостатической гипотензии (аддитивное действие).

## С мефлохином

Риск развития брадикардии (аддитивное действие).

## С дилтиаземом (внутривенное введение)

Усиление антигипертензивного эффекта бетаксолола.

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

Усиление антигипертензивного эффекта бетаксолола. Повышенный риск ортостатической гипотензии.

## С амифостеном

Усиление антигипертензивного эффекта бетаксолола.

## С аллергенами, применяемыми для иммунотерапии или экстрактами аллергенов для кожных проб

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

## С фенитоином (внутривенное 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 глюкокортикостероидами и тетракозактидом

Ослабление антигипертензивного эффекта бетаксолола (за счет задержки натрия и воды, обусловленной действием глюкокортикостероидов и тетракозактида).

## С диуретиками

Возможно чрезмерное снижение АД.

## С недеполяризирующими миорелаксантами

Бетаксолол удлиняет действие недеполяризирующих миорелаксантов.

## С кумаринами

Усиление антикоагулянтного эффекта кумаринов.

## С этанолом (алкоголь), седативными и снотворными лекарственными средствами

Усиление угнетения центральной нервной системы.

## С негидрированными алкалоидами спорыньи

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

## С симпатомиметиками

Риск снижения эффектов β-адреноблокаторов.

## С препаратами, индуцирующими остановку синусового узла

Остановка синусового узла возможна при одновременном применении β-адреноблокаторов, включая препарат Бетаксолол, с препаратами, которые могут вызвать остановку синусового узла.

## Особые указания

### Прекращение терапии и «синдром отмены»

Пациент должен быть информирован о том, что не следует резко прерывать лечение бетаксололом и не менять рекомендованную дозу без предварительной консультации с врачом, так как это может привести к временному ухудшению деятельности сердца.

Не следует внезапно прекращать терапию препаратом Бетаксолол, особенно у пациентов с ишемической болезнью сердца (ИБС). 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 препарат Бетаксолол, следует контролировать:



ЧСС и АД (в начале лечения ежедневно, затем – 1 раз в 3-4 месяца), концентрацию глюкозы в крови у пациентов с 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  $\beta$ -адреноблокаторы неэффективны. Основные причины – тяжелый коронарный атеросклероз с низким порогом ишемии (ЧСС в момент развития приступа стенокардии менее 100 уд./мин) и повышенное конечное диастолическое давление левого желудочка, нарушающее субэндокардиальный кровоток. При одновременном приеме клонидина его прием может быть прекращен только через несколько дней после отмены препарата Бетаксолон.

**Влияние бетаксолона на результаты лабораторных исследований**  
Препарат Бетаксолон 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**  
 $\beta$ -адреноблокаторы могут назначаться пациентам с бронхиальной астмой и хронической обструктивной болезнью легких только среднетяжелого течения. Лечение следует начинать с малых доз и желательно под контролем показателя функции внешнего дыхания; при возникновении приступа бронхиальной астмы на фоне терапии бетаксолоном возможно применение  $\beta_2$ -адреномиметиков для купирования приступа.

**Сердечная недостаточность**  
У пациентов с сердечной недостаточностью, контролируемой терапевтически, в случае необходимости бетаксолон может использоваться под строгим медицинским наблюдением в очень малых 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 Бетаксолон необходимо уменьшить.

**Атриовентрикулярная блокада I степени**  
Учитывая отрицательный дромотропный эффект  $\beta$ -адреноблокаторов, при атриовентрикулярной блокаде I степени препарат следует применять с осторожностью. Требуется тщательное наблюдение, включая ЭКГ-контроль.

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

**Нарушения периферического кровообращения**  
 $\beta$ -адреноблокаторы могут приводить к ухудшению состояния пациентов с нарушениями периферического кровообращения (болезнь Рейно или синдром Рейно, артрит или хронические облитерирующие заболевания артерий нижних конечностей).

**Феохромоцитомы**  
В случае применения  $\beta$ -адреноблокаторов при лечении артериальной гипертензии, вызванной феохромоцитомой, требуется тщательный контроль АД. Назначение препарата Бетаксолон возможно только на фоне применения  $\alpha$ -адреноблокаторов.

**Пожилые пациенты**  
Лечение пожилых пациентов следует начинать с малых доз и под тщательным медицинским наблюдением.

**Пациенты с почечной недостаточностью**  
Дозу необходимо корректировать в зависимости от концентрации креатинина в сыворотке крови или КК. При КК более 20 мл/мин требуется 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 (см. раздел «Способ применения и дозы»).

**Пациенты с печеночной недостаточностью**  
При печеночной недостаточности требуется более тщательное клиническое наблюдение в начале лечения.

**Пациенты с сахарным диабетом**  
У пациентов с сахарным диабетом необходим регулярный контроль концентрации глюкозы в крови, включая активный самоконтроль пациентом, в начале лечения. Пациент должен быть информирован о том, что бетаксолон может маскировать начальные симптомы гипогликемии (особенно тахикардия, ощущение сердцебиения и повышенное потоотделение).

**Псориаз**  
Требуется тщательная оценка необходимости применения препарата, так как имеются сообщения об ухудшении течения псориаза во время лечения  $\beta$ -адреноблокаторами.

**Аллергические реакции**  
 $\beta$ -адреноблокаторы, включая препарат Бетаксолон, могут повышать чувствительность к аллергенам и тяжесть анафилактических реакций из-за ослабления адренергической компенсаторной регуляции под действием  $\beta$ -адреноблокаторов. Терапия анафилактических реакций эпинефрином (адреналином) не всегда дает ожидаемый терапевтический эффект. У пациентов, склонных к развитию тяжелых анафилактических реакций, в особенности связанных с применением йодсодержащих контрастных веществ, флоктаденина или при проведении десенсибилизации, терапия  $\beta$ -адреноблокаторами может привести к дальнейшему усилению реакций и

снижению эффективности лечения.

**Хирургические вмешательства и общая анестезия**  
При проведении общей анестезии следует учитывать риск возникновения блокады  $\beta$ -адренорецепторов (уменьшение ЧСС, снижение сердечного выброса, снижение систолического и диастолического АД).

$\beta$ -адреноблокаторы маскируют рефлекторную тахикардию и повышают риск развития артериальной гипотензии. Продолжение терапии  $\beta$ -адреноблокаторами снижает риск развития аритмии, ишемии миокарда и пациент получает лечение  $\beta$ -адреноблокаторами.

В целом, не рекомендуется прекращать прием  $\beta$ -адреноблокаторов в периоперационном периоде без явной необходимости.

Если необходимо прекратить терапию препаратом Бетаксолон перед хирургическим вмешательством, это следует делать постепенно и завершить за 48 часов до проведения общей анестезии, так как прекращение терапии на 48 часов позволяет восстановить чувствительность рецепторов к катехоламинам.

Терапия  $\beta$ -адреноблокаторами в некоторых случаях не может быть прервана: – у пациентов с коронарной недостаточностью желательно продолжить лечение вплоть до хирургического вмешательства, учитывая риск, связанный с внезапной отменой  $\beta$ -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 следует применять вещества, в наименьшей степени угнетающие миокард, и восполнять кровопотери.

Необходимо учитывать риск развития анафилактических реакций.

**Тиреотоксикоз**

$\beta$ -адреноблокаторы могут маскировать симптомы тиреотоксикоза.

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

**Алкоголь**

На время лечения следует исключить употребление алкоголя.

**Глаукома**

$\beta$ -адреноблокаторы снижают внутриглазное давление и могут влиять на скрининговые тесты на наличие глаукомы. Пациент должен сообщить офтальмологу о том, что он принимает бетаксолон. Пациенты, принимающие  $\beta$ -адреноблокаторы или применяющие их в качестве глазных капель, должны находиться под наблюдением врача по причине потенциального аддитивного действия  $\beta$ -адреноблокаторов.

**Контактные линзы**

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

**Курение**

У курящих пациентов эффективность  $\beta$ -адреноблокаторов ниже.

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

**Форма выпуска**

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 20 мг.  
По 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой или гибкой упаковки на основе алюминиевой фольги.

1, 2, 3, 5 или 10 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению в пачку из картона.

**Условия хранения**

В сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

**Срок годности**

3 года. Не применять после истечения срока годности, указанного на упаковке.

**Условия отпуска**

Отпускают по рецепту.

**Производитель:**

Федеральное государственное унитарное предприятие

«Московский эндокринный завод»

**Производство готовой лекарственной формы:**

г. Москва, ул. Новохоловская, д. 25, стр. 2

**Выпускающий контроль качества:**

г. Москва, ул. Новохоловская, д. 25, стр. 1

**Владелец регистрационного удостоверения/наименование, адрес организации, принимающей претензии потребителя:**

Федеральное государственное унитарное предприятие

«Московский эндокринный завод»

Россия, 109052, г. Москва, ул. Новохоловская, д. 25

Тел./факс: (495) 678-00-50/911-42-10

http://www.endopharm.ru

