

CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

BETOPTIC S, 2,5 mg/ml krople do oczu, zawiesina

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

1 ml zawiesiny zawiera 2,5 mg betaksololu (*Betaxololum*) w postaci chlorowodoru betaksololu

Substancje pomocnicze, patrz punkt 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Krople do oczu, zawiesina.

Preparat Betoptic S ma postać zawiesiny o kolorze białym lub białawym.

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE**4.1. Wskazania do stosowania**

Zmniejszenie podwyższonego ciśnienia śródgałkowego u pacjentów z przewlekłą jaskrą z otwartym kątem przesączania lub nadciśnieniem ocznym, jako monoterapia lub jako leczenie uzupełniające.

4.2 Dawkowanie i sposób podawania

Do stosowania do oka.

Dawkowanie

Stosowanie u osób dorosłych, w tym u osób w wieku podeszłym

Zaleca się stosowanie jednej kropli leku Betoptic S do worka spojówkowego chorego oka, dwa razy na dobę. U niektórych pacjentów konieczne jest stosowanie leku Betoptic S przez kilka tygodni do uzyskania stabilnego obniżenia ciśnienia śródgałkowego. Zaleca się staranne obserwowanie pacjentów z jaskrą.

W przypadku, gdy stosowanie leku nie powoduje odpowiedniego obniżenia ciśnienia śródgałkowego, należy zastosować leczenie skojarzone z pilokarpiną i innymi lekami z grupy miotyków i (lub) adrenaliną i (lub) inhibitorami anhidrazy węglanowej lub analogami prostaglandyn.

Zaleca się delikatnie zamknąć powieki i uciskać przewód nosowo-łzowy po wprowadzeniu leku w postaci kropli do oczu. Dzięki temu można zmniejszyć ogólnoustrojowe wchłanianie leków podawanych w postaci kropli do oczu oraz częstość i nasilenie ogólnoustrojowych działań niepożądanych.

Przy jednoczesnym stosowaniu z innymi lekami podawanymi miejscowo do oka należy zachować odstęp co najmniej dziesięciu do piętnastu minut przed podaniem kolejnego leku w postaci kropli do oczu.

Stosowanie u dzieci i młodzieży

Nie określono skuteczności i bezpieczeństwa stosowania leku Betoptic S u pacjentów w wieku poniżej 18 lat.

Stosowanie u pacjentów z upośledzeniem czynności wątroby i nerek

Nie przeprowadzono badań dotyczących stosowania leku Betoptic S u pacjentów z niewydolnością wątroby i nerek.

Sposób podawania

Przed podaniem leku należy dokładnie wstrząsnąć butelkę.

Aby zapobiec zakażeniu końcówki zakraplacza i zawiesziny, należy zachować ostrożność. Nie wolno dotykać końcówką zakraplacza powiek, okolic sąsiadujących z okiem lub innych powierzchni.

4.3. Przeciwwskazania

Nadwrażliwość na betaksolol lub na którąkolwiek substancję pomocniczą.

Lek Betoptic S jest przeciwwskazany do stosowania u pacjentów z bradykardią zatokową, blokiem przedsionkowo-komorowym większym niż pierwszego stopnia, wstrząsem kardiogenym oraz u pacjentów z niewydolnością serca w wywiadzie.

Preparatu Betoptic S nie wolno stosować u pacjentów z astmą albo z obturacyjną chorobą dróg oddechowych w wywiadzie, z wyjątkiem przypadków, gdy nie można zastosować innych leków obniżających ciśnienie śródgałkowe.

4.4. Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

W badaniach klinicznych preparat betaksololu do stosowania w postaci kropli do oczu miał niewielki wpływ na częstość rytmu serca i ciśnienie tętnicze krwi. Należy zachować ostrożność podczas jego stosowania u pacjentów z niewydolnością serca lub blokiem przedsionkowo-komorowym w wywiadzie. W razie wystąpienia pierwszych objawów niewydolności serca należy przerwać stosowanie preparatu Betoptic S.

U pacjentów z jaskrą z zamkniętym kątem przesączania bezpośrednim celem leczenia jest otwarcie kąta poprzez zwężenie źrenicy po podaniu leku zwężającego źrenicę. Betaksolol ma jedynie słabe działanie albo nie wywiera działania na źrenicę. Przy stosowaniu leku Betoptic S w celu zmniejszenia podwyższonego ciśnienia śródgałkowego w przebiegu jaskry z zamkniętym kątem przesączania, konieczne jest jednocześnie stosowanie leku zwężającego źrenicę. Nie wolno w takich przypadkach stosować leku Betoptic S w monoterapii.

Leki beta-adrenolityczne należy stosować ostrożnie u pacjentów, u których może wystąpić samoistna hipoglikemia, albo u pacjentów z cukrzycą (szczególnie z tzw. chwiejną cukrzycą), którzy przyjmują insulinę lub doustne leki przeciwcukrzycowe. Leki beta-adrenolityczne mogą maskować objawy podmiotowe i przedmiotowe ostrej hipoglikemii.

Leki beta-adrenolityczne mogą maskować niektóre objawy kliniczne nadczynności tarczycy (np. tachykardię). Należy zachować ostrożność przy stosowaniu leku u pacjentów z podejrzeniem nadczynności tarczycy. U takich pacjentów nie wolno nagle przerywać leczenia beta-adrenolitykiem, ponieważ mogłoby to spowodować przełom tarczycowy.

W badaniach klinicznych z grupą kontrolną wykazano, że betaksolol w postaci kropli do oczu ma niewielki wpływ na czynność układu oddechowego lub układu krążenia. Niemniej jednak, należy zachować ostrożność w leczeniu pacjentów z jaskrą i ze znacznym upośledzeniem czynności płuc. Opisywano ataki astmy oraz zaburzenia ze strony płuc u pacjentów przyjmujących betaksolol. Ponowne zastosowanie preparatu betaksololu w postaci kropli do oczu u niektórych pacjentów nie miało niekorzystnego wpływu na wyniki testów czynnościowych płuc. Niemniej jednak nie można wykluczyć ryzyka wystąpienia działań niepożądanych u pacjentów wrażliwych na beta-adrenolityki.

Blokowanie receptorów β -adrenergicznych może przyczynić się do osłabienia mięśni (np. podwójne widzenie, opadanie powiek, ogólne osłabienie).

Należy zachować ostrożność przy przepisywaniu leku Betoptic S pacjentom z miastenią.

Przed zastosowaniem znieczulenia ogólnego należy stopniowo zmniejszać dawkę leku betaadrenolitycznego, ponieważ następuje zmniejszenie zdolności serca do reakcji na bodźce z układu współczulnego, w przekazywaniu których uczestniczą receptory beta-adrenergiczne.

Preparat Betoptic S zawiera chlorek benzalkoniowy. Środek ten może powodować podrażnienie oraz zmiany koloru miękkich soczewek kontaktowych. Dlatego należy usunąć soczewki kontaktowe przed zastosowaniem leku Betoptic S. Po zakropleniu leku Betoptic S należy poczekać 15 minut do założenia soczewek kontaktowych.

4.5. Interakcje z innymi lekami i inne rodzaje interakcji

Wszystkie interakcje, które obserwuje się przy stosowaniu leków beta-adrenolitycznych podawanych ogólnie, mogą w zasadzie wystąpić także po podaniu leku beta-adrenolitycznego w postaci kropli do oczu.

Należy obserwować pacjentów, którzy przyjmują jednocześnie lek beta-adrenolityczny w postaci doustnej oraz preparat Betoptic S. Może bowiem wystąpić działanie addycyjne tych leków w postaci nasilonego działania na ciśnienie śródgałkowe albo znanych objawów działania ogólnego beta-adrenolityków. Leki beta-adrenolityczne podawane doustnie zmniejszają pojemność minutową u osób zdrowych oraz u pacjentów z chorobami serca. U pacjentów z ciężkim upośledzeniem czynności mięśnia sercowego, leki beta-adrenolityczne mogą hamować działanie pobudzające układu współczulnego, konieczne dla zachowania odpowiednich parametrów czynności serca.

Zaleca się ścisłą obserwację pacjenta w razie stosowania leku beta-adrenolitycznego u osoby przyjmującej leki zmniejszające zasoby katecholamin w zakończeniach neuronów, takie jak pochodne rezerpiny. Może dojść do działania addycyjnego tych leków, niedociśnienia i/lub bradykardii.

Betaksolol jest lekiem beta-adrenolitycznym i należy zachować ostrożność u pacjentów, przyjmujących jednocześnie leki psychotropowe oddziałujące na receptory adrenergiczne, z uwagi na ryzyko nasilenia ich działania.

4.6. Ciąża i laktacja

Stosowanie w ciąży

Brak jest danych klinicznych dotyczących stosowania betaksololu w czasie ciąży.

Preparat Betoptic S można stosować w okresie ciąży jedynie wówczas, gdy korzyści dla matki przeważają nad ryzykiem dla płodu (patrz punkt 5.3).

Stosowanie w okresie laktacji

Nie jest wiadomo, czy betaksolol przenika do mleka u kobiet karmiących.

Ponieważ wiele leków jest wydzielanych do mleka kobiecego, należy zachować szczególną ostrożność w przypadku decydowania o zastosowaniu leku Betoptic S u kobiet karmiących.

4.7. Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów mechanicznych i obsługiwanie urządzeń mechanicznych w ruchu

Podobnie jak inne leki w postaci kropli do oczu, preparat może powodować przemijające niewyraźne widzenie lub inne zaburzenia widzenia, które mogą upośledzać zdolność prowadzenia pojazdów mechanicznych i obsługiwanie urządzeń mechanicznych w ruchu. Jeśli po zakropleniu preparatu wystąpi niewyraźne widzenie, pacjent nie powinien prowadzić pojazdów mechanicznych ani obsługiwać niebezpiecznych urządzeń do czasu, aż będzie widział wyraźnie.

Zaburzenia oka

Często: dyskomfort (klucie, uczucie pieczenia)

Niezbyt często: łzawienie

Rzadko: zamazane widzenie, choroby rogówki, takie jak punktikowate zapalenie rogówki, powierzchniowe punktikowate zapalenie rogówki, zmniejszenie wrażliwości rogówki, reakcje alergiczne, zespół suchego oka, uczucie ciała obcego, rumień, świąd i światłowstręt.

Działania ogólnoustrojowe: Reakcje ogólnoustrojowe po podaniu miejscowym betaksololu były zgłaszane bardzo rzadko.

Zaburzenia ogólnoustrojowe:

Zaburzenia układu nerwowego

Rzadko: bezsenność, depresja

Organizm jako całość

Rzadko: ból głowy

Zaburzenia serca

Rzadko: bradykardia

Zaburzenia układu oddechowego, klatki piersiowej i śródpiersia

Rzadko: duszność, astma

Zaburzenia skóry i tkanki podskórnej

Rzadko: łysienie

Ponieważ środki blokujące receptor β -adrenergiczny stosowane miejscowo mogą być wchłaniane układowo, po zastosowaniu miejscowym mogą wystąpić te same działania niepożądane, które występują po układowym podaniu środków blokujących receptory β_1 -adrenergiczne (patrz punkt 4.4 Ostrzeżenia specjalne). Do objawów tych mogą należeć zwolnienie czynności serca (bradykardia), zwolnienie przewodzenia przedsionkowo-komorowego lub nasilenie występującego bloku przedsionkowo-komorowego, niedociśnienie, niewydolność serca, ziębnienie i zasinienie kończyn, objaw Raynauda, parestezje kończyn, nasilenie istniejących objawów chromania przestankowego, zmęczenie, bóle głowy, upośledzenie widzenia, halucynacje, psychozy, objawy splątania, impotencja, zawroty głowy, zaburzenia snu, depresja, koszmarne sny, problemy żołądkowo-jelitowe, nudności, wymioty, biegunka, skurcz oskrzeli u pacjentów z astmą oskrzelową lub objawami astmy w wywiadzie, zaburzenia skóry, szczególnie wysypka i suchość oczu. Środki blokujące receptor β -adrenergiczny mogą maskować objawy nadczynności tarczycy lub hipoglikemii. Obserwowano podwyższenie poziomu przeciwciał przeciwjądrowych (ANA), czego znaczenie kliniczne jest nieznane.

4.9. Przedawkowanie

W razie miejscowego przedawkowania leku Betoptic S należy przepłukać oko (oczy) letnią wodą.

W przypadku przedawkowania leków beta-adrenolitycznych mogą wystąpić takie objawy układowe, jak niedociśnienie, bradykardia i ostra niewydolność serca.

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

5.1. Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna; leki przeciwwąskrowe, leki zwężające źrenicę, beta-adrenolityki; kod ATC: S01E D02

Wydawnictwo Lekarskie PZ
00-952 Warszawa
ul. Miodowa 15

Mechanizm działania

Betaksolol jest kardioselektywnym beta-1-adrenolitykiem. Lek ten nie ma istotnego działania stabilizującego błony komórkowe (miejscowo znieczulającego) oraz nie posiada wewnętrznej aktywności sympatykomimetycznej.

Zwiększone ciśnienie śródgałkowe jest ważnym czynnikiem ryzyka utraty pola widzenia w przebiegu jaskry. Im większe jest ciśnienie śródgałkowe, tym większe jest ryzyko uszkodzenia nerwu wzrokowego oraz utraty pola widzenia. Po wkropleniu do oka, betaksolol zmniejsza zarówno podwyższone, jak i prawidłowe ciśnienie śródgałkowe, niezależnie od tego, czy towarzyszy temu jaskra, czy nie. Wydaje się, że mechanizm działania zmniejszającego ciśnienie śródgałkowe polega na tym, iż dochodzi do zmniejszenia wytwarzania cieczy wodnistej. Wskazują na to badania tonograficzne oraz fluorofotometria cieczy wodnistej. Na ogół działanie betaksololu pojawia się w ciągu 30 minut, a maksymalne działanie można stwierdzić po 2 godzinach od podania leku miejscowo. Pojedyncza dawka betaksololu powoduje zmniejszenie ciśnienia śródgałkowego przez okres 12 godzin.

Lek Betoptic S w postaci kropli do oczu, w zawiesinie (betaksolol 0,25%) zapewnia zmniejszenie ciśnienia śródgałkowego równoważne do stwierdzanego po podaniu leku Betoptic w postaci kropli do oczu, w roztworze (betaksolol 0,5%).

W badaniach in vivo, przeprowadzonych na psach, stwierdzono obwodowe działanie betaksololu w postaci rozszerzenia naczyń. W wielu badaniach in vitro, z zastosowaniem naczyń gałki ocznej oraz innych naczyń, pochodzących od szczurów, świnek morskich, królików, psów, świń lub krów, stwierdzono działanie betaksololu w postaci rozszerzenia naczyń oraz działanie blokujące kanały wapniowe. Zarówno w badaniach in vivo, jak i in vitro, na siatkówce królika, hodowlach komórek korowych szczura oraz komórek siatkówki kurczaka, stwierdzono neuroprotektoryjne działanie betaksololu.

Dane uzyskane w badaniach klinicznych z grupą kontrolną, z udziałem pacjentów z jaskrą przewlekłą z otwartym kątem przesączania oraz nadciśnieniem śródgałkowym, wskazują na to, że leczenie betaksololem daje większe korzyści w dalszej obserwacji pod względem wpływu na pole widzenia, w porównaniu do leczenia timololem, który jest niewybiórczym beta-adrenolitykiem. Ponadto, podczas leczenia betaksololem nie obserwowano niekorzystnego wpływu na dopływ krwi do nerwu wzrokowego. Betaksolol utrzymuje lub poprawia dopływ krwi i perfuzję w gałce ocznej.

Po podaniu miejscowo, w postaci kropli do oczu, betaksolol ma niewielki wpływ albo nie ma wpływu na zwężenie źrenicy. Betaksolol ma minimalny wpływ na parametry czynnościowe płuc i układu krążenia.

Betaksolol w postaci kropli do oczu nie ma istotnego wpływu na parametry czynnościowe płuc, takie jak maksymalna objętość wydechu pierwszosekundowa, maksymalna pojemność życiowa oraz iloraz tych parametrów. Nie stwierdzono działania leku w postaci zahamowania działania receptorów beta-adrenergicznych w układzie krążenia podczas wysiłku.

Po podaniu doustnym leki beta-adrenolityczne zmniejszają objętość minutową u osób zdrowych oraz u pacjentów z chorobami serca. U pacjentów ze znacznym upośledzeniem czynności myocardium, beta-adrenolityki mogą hamować działanie pobudzające układu współczulnego, konieczne do zachowania prawidłowej czynności serca.

Wyniki badań klinicznych wskazują na to, że lek Betoptic S w postaci kropli do oczu, w zawiesinie, jest znacznie bardziej wygodny w użyciu, niż lek Betoptic w postaci kropli do oczu, w roztworze.

Betaksolol jest związkiem polarnym. Po zakropleniu tego leku do oka może wystąpić dyskomfort ze strony oka. W preparacie Betoptic S cząsteczki betaksololu są jonowo związane z żywicą amberlitową. Po wkropleniu do oka, cząsteczki betaksololu są wypierane przez jony sodowe z warstwy łoż. Proces wypierania trwa kilka minut. Dzięki takiemu działaniu leku, stosowanie leku Betoptic S jest znacznie lepiej tolerowane.

5.2. Właściwości farmakokinetyczne

Betaksolol jest związkiem silnie lipofilowym. Dzięki temu łatwo przenika przez rogówkę a jego stężenie wewnątrz gałki ocznej jest duże. Po podaniu betaksololu w postaci kropli do oczu dochodzi do małej ekspozycji osocza krwi na betaksolol. W badaniach klinicznych nad właściwościami farmakokinetycznymi leku stężenia betaksololu w osoczu krwi były mniejsze od progu określenia ilościowego, wynoszącego 2 ng/ml. Betaksolol charakteryzuje się dobrym wchłanianiem po podaniu doustnym, niewielkim tzw. „efektem pierwszego przejścia” oraz względnie długim okresem półtrwania, który wynosi około 16-22 godzin. Betaksolol jest wydalany głównie przez nerki, w małym stopniu ze stolcem. W głównych szlakach metabolicznych powstają dwie formy kwasów karboksylowych. Występują one w moczu razem z niezmienionym betaksololem (który stanowi około 16% podanej dawki leku).

Na ogół działanie betaksololu można stwierdzić po 30 minutach. Maksymalne działanie obserwuje się w ciągu 2 godzin po podaniu leku w postaci kropli do oczu. Po podaniu dawki pojedynczej dochodzi do zmniejszenia ciśnienia śródgałkowego przez okres 12 godzin.

5.3. Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

Badania na myszach, które przez całe życie otrzymywały betaksolol doustnie, w dawkach 6, 20 albo 60 mg/kg masy ciała na dobę, oraz na szczurach, które przez całe życie otrzymywały ten lek doustnie, w dawkach 3, 12 albo 48 mg/kg masy ciała na dobę, nie wskazywały na działanie karcynogenne betaksololu. Nie badano większych dawek.

Przeprowadzono różnorodne badania in vitro oraz in vivo na komórkach bakteryjnych oraz na komórkach ssaków, które nie wskazywały na działanie mutagenne betaksololu.

Badania nad wpływem chlorowodoru betaksololu, podawanego doustnie, na rozmnażanie się, rozwój zarodka i płodu, oraz rozwój noworodka, przeprowadzone na szczurach i królikach, wykazywały wpływ leku na zmniejszenie wskaźnika implantacji u królików i szczurów, przy podawaniu leku w dawce odpowiednio ponad 12 mg/kg masy ciała na dobę oraz 128 mg/kg masy ciała na dobę.

Wykazano, że chlorowodorek betaksololu nie ma działania teratogenne. Przy podawaniu leku w dawkach mniejszych od dawek toksycznych nie stwierdzono innego niekorzystnego działania na rozmnażanie się i rozwój płodu.

6. DANE FARMACEUTYCZNE

6.1. Wykaz substancji pomocniczych

sulfonowany polistyren
karbomer 974P
kwas borowy
mannitol
disodu edetynian
benzalkoniowy chlorek
N-laurylosarkozyna
sodu wodorotlenek i/lub kwas solny (do uzyskania odpowiedniego pH)
woda oczyszczona

6.2. Niezgodności farmaceutyczne

Ponieważ nie wykonywano badań dotyczących zgodności, produktu leczniczego nie wolno mieszać z innymi lekami.

6.3. Okres trwałości

2 lata

Wyrzucić po upływie 4 tygodni od pierwszego otwarcia opakowania.

6.4. Specjalne środki ostrożności przy przechowywaniu

Brak specjalnych zaleceń dotyczących przechowywania.

Przechowywać w miejscu niedostępnym i niewidocznym dla dzieci.

Przechowywać opakowanie szczelnie zamknięte.

6.5. Rodzaj i zawartość opakowania

Butelka typu DROPTAINER z zakraplaczem z polietylenu o niskiej gęstości (LDPE) oraz z zabezpieczoną zakrętką z polipropylenu.

1 butelka o pojemności 5 ml lub 10 ml umieszczona w tekturowym pudełku.

Nie wszystkie rodzaje opakowań muszą znajdować się w obrocie.

6.6. Instrukcja dotycząca przygotowania leku do stosowania

Brak szczególnych wymagań.

7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

ALCON-COUVREUR

Rijksweg 14

2870 Puurs

Belgia

8. NUMER(Y) POZWOLENIA(N) NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Cert. Rej. Nr 2571/Z

Świad. Rej. Nr-R/1865

Pozwolenie Nr-R/1865

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

Data pierwszego wpisu: 14.09.1992 r.

Data przedłużenia wpisu: 31.05.1999 r.

Data przedłużenia wpisu: 16.08.2004 r. / 23.05.2005 r.

10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO