

Состав

действующее вещество: бетаксолола гидрохлорид;

1 мл суспензии содержит бетаксолола гидрохлорида 2,8 мг, что эквивалентно 2,5 мг бетаксолола;

вспомогательные вещества: маннит (Е 421), кислота полистиролсульфонова, карбомер 974Р, натрия эдетат, бензалкония хлорид, N-лауроилсаркозин, кислота борная, натрия гидроксид и/или кислота соляная концентрированная (для регулирования рН), вода очищенная.

Лекарственная форма

Капли глазные.

Основные физико-химические свойства: суспензия от белого до почти белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа

Средства, применяемые в офтальмологии. Противоглаукомные препараты и миотические средства. Блокаторы бета-адренорецепторов. Код АТХ S01E D02.

Фармакодинамика

Бетаксолол - кардиоселективный блокатор бета-1-адренорецепторов, не оказывает значительного мембраностабилизирующей (местной анестезирующего) и выраженной симпатомиметической действия.

Повышенное внутриглазное давление является главным фактором риска развития глаукоматозной слепоты. Чем выше уровень внутриглазного давления, тем больше вероятность повреждения глазного нерва и потере поля зрения. После введения в глаз бетаксолол способен снижать как повышенное, так и нормальное внутриглазное давление, независимо от того, сопровождается это глаукомой или нет, механизм его гипотензивного действия связан с уменьшением выработки внутриглазной жидкости, как показывает тонография и флюорофотометрия. Бетаксолол начинает действовать через 30 минут, а максимальный эффект, как правило, достигается через 2 часа после местного применения. Разовая доза обеспечивает снижение внутриглазного давления в течение 12 часов.

Бетоптик S в форме суспензии (бетаксолол 0,25%) обеспечивает снижение внутриглазного давления, эквивалентное тому, что продемонстрировал препарат Бетоптик S в форме раствора (бетаксолол 0,5%).

Вазорелаксивное действие бетаксолола на периферические сосуды была продемонстрирована в исследовании *in vivo* на собаках. Также вазорелаксивная действие бетаксолола и его способность блокировать кальциевые каналы были продемонстрированы в некоторых исследованиях *in vivo*, в которых использовали модели глазных и не глазных сосудов крыс, морских свинок, кроликов, собак, свиней и коров. Действие бетаксолола как нейропротектора была продемонстрирована в экспериментах как *in vivo*, так и *in vitro* на сетчатке кроликов, кортикальных культурах крыс и культурах сетчатки цыплят.

Данные, полученные в ходе контролируемых клинических исследований на пациентах с хронической открытоугольной глаукомой и глазной гипертензией, указывают на то, что лечение с применением бетаксолола обеспечивает длительный положительное влияние на поле зрения, чем полученный при применении тимолола, неселективного бета-блокатора. Более того, при применении бетаксолола не наблюдалось негативного влияния на кровоснабжение глазного нерва. Бетаксолол поддерживает или улучшает глазное кровообращение/перфузию.

При местном применении бетаксолола в форме глазных капель он оказывает незначительное воздействие или совсем не влияет на сужение зрачка и имеет минимальное влияние на легочную и сердечно-сосудистую функцию. Бетаксолол для офтальмологического применения не имел существенного влияния на функцию легких, было установлено при измерении объема максимального выдоха в секунду, максимального жизненного объема легких и их соотношение. Никаких признаков сердечно-сосудистой бета-адренергической блокады во время проведения исследования не наблюдалось.

При пероральном введении бета-адренорецепторов уменьшают сердечный выброс у здоровых добровольцев и у пациентов с заболеваниями сердца. У пациентов с тяжелыми нарушениями функции миокарда антагонисты бета-адренорецепторов могут подавлять симпатичный стимулирующий эффект, необходимый для поддержания адекватной сердечной функции.

Результаты клинических исследований указывают на то, что суспензия Бетоптик S переносилась гораздо лучше, чем раствор Бетоптик S.

Полярная природа бетаксолола может вызвать ощущение дискомфорта в глазах. В препарате Бетоптик S молекулы бетаксолола связаны ионной связью с амберлитовой смолой. После инстилляций молекулы бетаксолола переносятся

ионами натрия в слезную пленку. Этот процесс перемещения происходит в течение нескольких минут и усиливает офтальмологический комфорт при применении препарата Бетоптик S.

Доклинические данные по безопасности

Исследование продолжительности жизни при применении бетаксолола, введенного перорально в дозах, составляли 6, 20 или 60 мг/кг/сут, проведенные на мышах и на крысах в дозах 3 или 12 или 48 мг/кг/сут, продемонстрировали отсутствие канцерогенного эффекта.

Во время различных опытов на клетках бактерий и млекопитающих как *in vitro*, так и *in vivo*, мутагенный эффект бетаксолола не наблюдалось.

Исследование действия бетаксолола на репродуктивную функцию, а также тератологические, перинатальные и постнатальные исследования, осуществляли на крысах и кроликах при пероральном применении бетаксолола гидрохлорида, продемонстрировали доказательства связи постимплантационного выкидыша у крыс и кроликов с применением препарата в дозе, превышающей 12 мг/кг и 128 мг/кг соответственно.

Бетаксолола гидрохлорид не выявил тератогенного эффекта, а также не наблюдалось какого-либо другого негативного влияния на репродуктивную функцию при субтоксических дозах.

Фармакокинетика

Бетаксолол обладает высокой липофильностью, что приводит к высокой степени проницаемости в роговицу и высоких концентраций в тканях глаза. Содержание бетаксолола в плазме после местного применения низкий. При осуществлении клинических фармакокинетических исследований концентрации в плазме крови были ниже предела количественного определения, равна 2 нг/мл. Бетаксолол характеризуется хорошей абсорбцией при пероральном применении, низкими потерями при первом прохождении и относительно длительным периодом полувыведения, который составляет приблизительно 16-22 часа. Выводится бетаксолол, как правило, почками, меньше - с калом. Основными метаболитами являются две формы карбоксильной кислоты и бетаксолол в неизмененном виде, которые выводятся с мочой (примерно 16% от принятой дозы).

Бетаксолол начинает действовать, как правило, через 30 минут, а максимальный эффект, как правило, достигается через 2 часа после местного применения. Разовая доза обеспечивает снижение внутриглазного давления в течение 12 часов.

Показания

Для снижения внутриглазного давления у больных хронической открытоугольной глаукомой или очную гипертензией (в качестве монотерапии, так и в комбинации с другими лекарственными средствами).

Противопоказания

Повышенная чувствительность к активной субстанции или к любому из компонентов препарата.

Синусовая брадикардия, синдром дисфункции синусового узла, дисфункция синусно-предсердного узла, блокада II-III степени, неконтролируемая водителем ритма. Выраженная сердечная недостаточность или кардиогенный шок.

Реактивное заболевание дыхательных путей, включая бронхиальную астму тяжелой степени или бронхиальной астмой тяжелой степени в анамнезе, хронические обструктивные заболевания легких тяжелой степени.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Специальных исследований бетаксолола по их взаимодействию с другими лекарственными средствами не проводили.

Существует вероятность возникновения дополнительных эффектов, приводящих к артериальной гипотензии и/или выраженной брадикардии при применении офтальмологического раствора, содержащего бета-блокаторы, одновременно с пероральными блокаторами кальциевых каналов, бета-адренергическими блокирующими средствами, антиаритмическими средствами (включая амиодарон) или гликозидами наперстянки, парасимпатомиметиками, гуанетидином.

Бета-блокаторы могут снижать чувствительность к адреналину, который применяется для лечения анафилактических реакций. Следует назначать с осторожностью пациентам с атопией или анафилаксией в анамнезе.

В редких случаях сообщалось про мидриаз, возникающий при одновременном применении офтальмологических бета-блокаторов и адреналина (эпинефрина).

Если одновременно применять несколько лекарственных средств для местного применения в глаза, необходимо подождать не менее 5 минут между их применением. Глазные мази следует применять последними.

Поскольку бетаксолол является блокатором адренорецепторов, его следует с осторожностью назначать пациентам, которые параллельно применяют адренергические психотропные средства, из-за риска усиления их действия.

Особенности применения

Только для офтальмологического применения.

После вскрытия флакона следует снять защитное кольцо, предназначенное для контроля вскрытия.

Частота возникновения побочных реакций при местном применении в глаз ниже, чем при системном применении. Для получения информации по уменьшению системной абсорбции см. раздел «Способ применения и дозы».

Заболевания роговицы

При местном применении бета-блокаторов в глаз может возникать сухость глаз. Следует с осторожностью применять бета-блокаторы пациентам с заболеваниями роговицы.

Другие бета-блокаторы

При применении бетаксолола пациентам, которые уже получают системный бета-блокирующее средство, влияние на внутриглазное давление может усиливаться или известные эффекты системной бета-блокады. При применении бета-блокирующих средств пациентам данной категории следует внимательно наблюдать за реакцией. Не рекомендуется применять два бета-адренергических средства местного действия одновременно (см. Раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»).

При применении глазных капель Бетоптик S для снижения внутриглазного давления у пациентов с закрытоугольной глаукомой его необходимо применять только в комбинации с миотическими средствами.

Хориоидальная отслойка

При применении лекарственных средств, угнетающих выработку слезной жидкости (например, тимолол, ацетазоламид), после проведения фильтрационной хирургии сообщалось про отслойку хориоидальной оболочки.

Хирургическая анестезия

Бета-блокирующие анестезирующие препараты могут блокировать действие системных бета-агонистов, например, адреналина. При приеме пациентом

бетаксолола следует сообщить об этом анестезиолога.

При осуществлении носослезной окклюзии или при содержании век закрытыми в течение 2 минут, можно уменьшить системную абсорбцию препарата. Это может уменьшить системное действие и увеличить местное действие лекарств.

Общие

Как и другие офтальмологические препараты для местного применения, бетаксолол абсорбируется системно. Из-за наличия бета-адренергического компонента при применении бетаксолола могут возникнуть такие же побочные реакции со стороны сердечно-сосудистой, дыхательной системы и другие виды побочных реакций, как и при применении системных блокаторов бета-адренорецепторов.

Со стороны сердца

У пациентов с сердечно-сосудистыми заболеваниями (например, коронарное заболевание сердца, стенокардия Принцметала и сердечная недостаточность) и артериальной гипотензии следует критически оценивать необходимость осуществления терапии с применением бета-блокаторов и рассмотреть возможность терапии с применением других действующих веществ. Следует наблюдать за отсутствием признаков ухудшения состояния и побочных реакций у пациентов с сердечно-сосудистыми заболеваниями. Из-за неблагоприятного влияния бета-блокаторов на время проводимости их с осторожностью можно назначать только пациентам с блокадой сердца первой степени.

Со стороны сосудистой системы

Следует с осторожностью проводить лечение пациентов с нарушением периферического кровообращения тяжелой степени (то есть тяжелые формы заболевания Рейно или синдрома Рейно).

Со стороны дыхательных путей

Поступали сообщения про реакции со стороны дыхательной системы, в том числе летальные случаи вследствие бронхоспазма у пациентов с астмой после применения некоторых бета блокаторов. Следует с осторожностью назначать этот препарат пациентам с бронхиальной астмой легкого/средней степени и бронхиальной астмой легкого/средней степени в анамнезе или хроническими обструктивными заболеваниями легких (ХОБЛ) легкой/средней степени.

Гипогликемия/диабет

Бета-адреноблокаторы следует с осторожностью применять пациентам, склонным к спонтанной гипогликемии, или пациентам с лабильным диабетом, поскольку бета-блокаторы могут маскировать признаки и симптомы острой гипогликемии.

Гипертиреоз

Бета-адреноблокаторы также могут маскировать признаки гипертиреоза.

Мышечная слабость

Бета-адреноблокаторы могут усиливать слабость мышц, связано с определенными симптомами миастении (например, диплопия, птоз и общая слабость).

Анафилактические реакции

При применении бета-блокаторов пациенты с атопией в анамнезе или анафилактическими реакциями тяжелой степени на различные аллергены в анамнезе могут иметь высшее реактивность при повторном применении с этими же аллергенами, а также могут не реагировать на обычные дозы адреналина, которые применяют для лечения анафилактических реакций.

Контактные линзы

Бетоптик S содержит бензалкония хлорид, который может вызывать раздражение глаз и, как известно, обесцвечивать мягкие контактные линзы. Следует избегать контакта с мягкими контактными линзами. Пациентов следует предупредить о том, что необходимо снимать контактные линзы перед применением глазных капель Бетоптик S и подождать 15 минут, прежде чем вставить контактные линзы.

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

Бетоптик S не имеет или имеет незначительное влияние на способность управлять автотранспортом или работать с механизмами. Временное помутнение зрения или другие нарушения зрения могут негативно влиять на способность управлять автотранспортом или работать с механизмами. Если нечеткость зрения возникает во время закапывания, пациенту необходимо подождать, пока зрение восстановится, прежде чем управлять автотранспортом или другими механизмами.

Применение в период беременности или кормления грудью

Репродуктивная функция

Данные о влиянии данного лекарственного препарата на организм человека отсутствуют.

Беременность

Нет достаточных данных относительно применения бетаксолола беременным женщинам. Для получения информации по уменьшению системной абсорбции см. раздел «Способ применения и дозы».

При осуществлении эпидемиологических исследований не было выявлено отрицательного влияния на формирование плода, но при пероральном применении бета-блокаторов было обнаружено риск задержки внутриутробного развития. Кроме этого, при применении бета-блокаторов до родов у новорожденных наблюдались признаки и симптомы бета-блокады (например, брадикардия, артериальная гипотензия, респираторный дистресс и гипогликемия).

Бетаксолол не следует применять в период беременности, кроме случаев крайней необходимости. Однако если Бетоптик S применяли к родам, в первые дни после рождения следует осуществлять тщательный мониторинг новорожденного.

Период кормления грудью

Бета-блокаторы проникают в грудное молоко может вызвать серьезных побочных эффектов у новорожденного на грудном вскармливании. Однако при применении терапевтических доз бетаксолола в виде глазных капель вряд ли в грудное молоко попадет количество препарата, может вызвать клинические симптомы бета-блокады новорожденного. Для получения информации по уменьшению системной абсорбции см. раздел «Способ применения и дозы».

Способ применения и дозы

Для офтальмологического применения.

Дозировка

Применение взрослым, включая пожилых людей

Рекомендуемая доза составляет 1 каплю Бетоптик S в конъюнктивальный мешок пораженного глаза (глаз) 2 раза в сутки. У некоторых пациентов для стабилизации гипотензивного действия Бетоптик S нужно применять несколько недель. Рекомендуется тщательное наблюдение за пациентами, больными

глаукомой.

Если при применении в рекомендованных дозах внутриглазное давление пациента не контролируется должным образом, можно применять сопутствующую терапию с другими противоглаукомными препаратами.

После инстилляций рекомендуется плотное закрытие веки или носослезная окклюзия. Это уменьшает системную абсорбцию лекарств, введенных в глаза, что уменьшает вероятность возникновения системных побочных эффектов.

В случае сопутствующей терапии с использованием других местных офтальмологических препаратов следует соблюдать интервал 10-15 минут между их применением.

Применение детям и подросткам

Эффективность и безопасность глазных капель Бетоптик S при применении пациентам в возрасте до 18 лет не установлена.

Применение при нарушениях функции печени и почек

Бетоптик S не исследовалась для этой категории пациентов.

Способ применения

Перед применением препарата флакон следует хорошо встряхнуть.

Чтобы предупредить загрязнение кончика капельницы и суспензии, необходимо быть осторожными и не касаться века или других поверхностей кончиком флакона-капельницы.

Дети

Эффективность и безопасность глазных капель Бетоптик S при применении пациентам в возрасте до 18 лет не установлена.

Передозировка

При случайном проглатывании препарата симптомы передозировки бета-блокаторами могут включать брадикардии, артериальной гипотензии, сердечной недостаточности и бронхоспазм.

В случае передозировки препаратом Бетоптик S лечение должно быть симптоматическим и поддерживающим.

Побочные реакции

Обзор данных по безопасности

Частым побочным эффектом, который наблюдался в течение клинических исследований препарата Бетоптик S, было ощущение дискомфорта в глазу, встречалось в 12% пациентов.

Нижеприведенные побочные эффекты наблюдались во время клинических исследований препарата и классифицированы следующим образом: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$ до $<1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$ до $<1/100$), редкие ($\geq 1/10000$ до $<1/1000$), редкие ($<1/10000$). В рамках каждой группы побочные эффекты представлены в порядке уменьшения их степени тяжести.

Система органов.	Побочные реакции согласно классификатору MedDRA (версия 13.0)
Кардиологические нарушения	Нечасто: брадикардия, тахикардия
Со стороны нервной системы	Часто: головная боль Редкие: синкопе

Офтальмологические нарушения	Очень часто: ощущение дискомфорта в глазу Часто: затуманивание зрения, усиленное слезотечение, ощущение инородного тела в глазах Нечасто: точечный кератит, кератит, конъюнктивит, блефарит, снижение остроты зрения, нарушение зрения, светобоязнь, боль в глазах, сухость глаз, астиопия, блефароспазм, необычное ощущение в глазах, зуд глаз, выделения из глаз, образование чешуек по краям век, воспаление глаз, раздражение глаз, конъюнктивальные нарушения, конъюнктивальный отек, гиперемия Редкие: катаракта, офтальмологические нарушения
Со стороны дыхательных путей, торакальные и медиастинальные нарушения	Нечасто: астма, одышка, нарушения со стороны дыхательных путей, ринит Редкие: кашель, ринорея
Со стороны желудочно-кишечного тракта	Нечасто: тошнота Редкие: дисгевзия
Со стороны кожи и подкожных тканей	Редкие: дерматит, сыпь
Со стороны сосудов	Одиночные: артериальная гипотензия
Психические расстройства	Редкие: беспокойство
Со стороны репродуктивной функции и молочных желез	Одинокие: снижение либидо

По результатам постмаркетинговых исследований были обнаружены нижеприведенные побочные реакции. По имеющимся данным невозможно рассчитать частоту их возникновения.

Система органів	Побочные реакции согласно классификатору MedDRA (версия 13.0)
Со стороны иммунной системы	повышенная чувствительность
Психические расстройства	бессонница, депрессия
Со стороны нервной системы	головокружение
Офтальмологические нарушения	эритема век
Кардиологические нарушения	аритмия
Со стороны кожи и подкожных тканей	облысение
Нарушение общего и состояние места введения	астения

Описание приведенных побочных реакций

Как и при применении других офтальмологических лекарственных средств местного действия, бетаксолол абсорбируется в системный кровоток. Это может привести к подобным побочным эффектам, как и при применении системных бета-блокаторов. Частота возникновения системных побочных реакций при местном применении в глаз меньше, чем при системном применении. Приведенные побочные реакции включают в себя реакции, которые наблюдались в пределах класса бета-блокаторов для офтальмологического применения.

Дополнительные побочные реакции наблюдались при применении офтальмологических бета-блокаторов и могут возникнуть при применении глазных капель Бетоптик S:

Со стороны иммунной системы: системные аллергические реакции, включающие ангионевротического отека, крапивница, локализованные и генерализованные высыпания, зуд, анафилактические реакции, токсический эпидермальный некролиз.

Со стороны метаболизма и усвоения питательных веществ: гипогликемия.

Психические расстройства: депрессия, ночные кошмары, потеря памяти, галлюцинации, психоз, спутанность сознания.

Со стороны нервной системы: обмороки, нарушения мозгового кровообращения, ишемия головного мозга, усиление признаков и симптомов миастении gravis, парестезии.

Офтальмологические нарушения: признаки и симптомы раздражения глаз (например, жжение, покалывание, зуд, слезотечение, покраснение), блефарит, отслоение хориоидальной оболочки после фильтрационной хирургии (см. Раздел

«Особенности применения»), уменьшение чувствительности роговицы, эрозия роговицы, птоз, диплопия.

Кардиологические нарушения: боль в груди, учащенное сердцебиение, отек, застойная сердечная недостаточность, AV блокада, остановка сердца, сердечная недостаточность.

Со стороны сосудистой системы: артериальная гипотензия, феномен Рейно, похолодание конечностей, усиление перемежающейся хромоты.

Респираторные, торакальные и медиастинальные нарушения: бронхоспазм (преимущественно у пациентов с предварительно существующим бронхоспастическим заболеванием).

Со стороны желудочно-кишечного тракта: диспепсия, диарея, боль в животе, рвота, сухость во рту, глоссит.

Со стороны кожи и подкожных тканей: псориазоподобные высыпания или обострение псориаза.

Со стороны костно-мышечной системы и соединительных тканей: миалгия.

Со стороны репродуктивной системы и молочных желез: половая дисфункция, импотенция.

Нарушение общего и состояния, связанные с местом введения: астения/усталость.

Дополнительно было выявлено повышение уровня антинуклеарных антител
клиническая релевантность не установлена.

Срок годности

2 года.

Срок хранения после вскрытия флакона - 4 недели.

Условия хранения

Держать флакон в картонной коробке. Хранить при температуре 8-30 °С. Хранить в недоступном для детей месте. Держать флакон плотно закрытым.

Упаковка

По 5 мл во флаконе-капельнице «Дроп-Тейнера», по 1 флакону в коробке из картона.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

Алкон-Куврьор.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Рийксвег 14, В-2870 Пуурс, Бельгия.

Источник инструкции

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