

POVZETEK GLAVNIH ZNAČILNOSTI ZDRAVILA

1. IME ZDRAVILA

BETOPTIC S 2,5 mg/ml kapljice za oko, suspenzija

2. KAKOVOSTNA IN KOLIČINSKA SESTAVA

1 ml suspenzije vsebuje 2,5 mg betaksolola v obliki betaksololijevega klorida (2,8 mg).

Pomožna(e) snov(i) z znanim učinkom:

1 ml suspenzije vsebuje 0,20 mg benzalkonijevga klorida.

Za celoten seznam pomožnih snovi glejte poglavje 6.1.

3. FARMACEVTSKA OBLIKA

kapljice za oko, suspenzija

Zdravilo BETOPTIC S je bela do belkasta suspenzija.

4. KLINIČNI PODATKI

4.1 Terapevtske indikacije

Znižanje zvišanega očesnega tlaka pri bolnikih s kroničnim glavkomom z odprtim zakotjem ali očesno hipertenzijo, kot monoterapija ali kot adjuvantna terapija.

4.2 Odmerjanje in način uporabe

Odmerjanje

Uporaba pri odraslih, vključno s starostniki

Priporočeni odmerek je ena kapljica zdravila BETOPTIC S v veznično vrečko prizadetega očesa (oči) dvakrat na dan. Pri nekaterih bolnikih je za stabilizacijo odziva na zdravilo BETOPTIC S pri zniževanju očesnega tlaka lahko potrebnih več tednov. Svetujemo skrbno spremljanje bolnikov z glavkomom.

Če s takšnim režimom odmerjanja pri bolniku ne dosežete ustreznega nadzora očesnega tlaka, lahko uvedete sočasno terapijo s pilokarpinom in drugimi miotiki in/ali adrenalinom (epinefrinom) in/ali zaviralci karboanhidraze ali prostaglandinskimi analogi.

Z zaprtjem nazolakrimalnega kanala ali vek za dve minuti bolnik zmanjša sistemsko absorpcijo zdravila, kar lahko vodi tudi do zmanjšanja njegovih sistemskih neželenih učinkov in do močnejšega lokalnega delovanja.

Pediatrična populacija

Varnost in učinkovitost zdravila BETOPTIC S pri bolnikih, mlajših od 18 let, še nista bili dokazani.

Uporaba pri bolnikih z jetrno ali ledvično okvaro

Zdravila BETOPTIC S niso raziskovali pri teh skupinah bolnikov.

Način uporabe

Pred uporabo naj bolnik dobro pretrese kapalni vsebnik.

Če je varnostni obroček po odstranitvi zaporke ohlapien, ga je treba pred uporabo zdravila odstraniti.

Kontaminacijo vrha kapalke in suspenzije preprečimo tako, da pazimo, da se z vrhom kapalnega vsebnika ne dotaknemo vek, kože v bližini ali drugih površin.

4.3 Kontraindikacije

Preobčutljivost na učinkovino ali katero koli pomožno snov, navedeno v poglavju 6.1.

Reaktivna bolezen dihalnih poti, vključno s hudo bronhialno astmo ali hudo bronhialno astmo v pretekli anamnezi, huda kronična obstruktivna bolezen.

Bolniki s sinusno bradikardijo, sindromom sinusnega vozla, sinoatrialnim blokom, atrioventrikularnim blokom druge ali tretje stopnje, ki ga ni mogoče nadzorovati s srčnim spodbujevalnikom, očitnim srčnim popuščanjem, kardiogenim šokom.

4.4 Posebna opozorila in previdnostni ukrepi

Splošna informacija

Samo za okularno uporabo.

Tako kot druge topikalno uporabljene očesne učinkovine se tudi betaksolol absorbira sistemsko. Zaradi učinkovine betaksolol, ki je antagonist adrenergičnih receptorjev beta, se lahko pojavi isti tip srčnožilnih, pulmonarnih in drugih neželenih učinkov, kot so jih opazili pri sistemskih antagonistih adrenergičnih receptorjev beta. Incidenca sistemskih neželenih učinkov po topikalni očesni uporabi zdravila je manjša kot pri njegovi sistemski uporabi. Glede zmanjšanja sistemske absorpcije glejte poglavje 4.2.

Srčne bolezni

Pri bolnikih s srčnožilnimi boleznimi (npr. koronarno srčno boleznijo, Prinzmetalovo angino in srčnim popuščanjem) ter hipotenzijo je treba zdravljenje z antagonistom adrenergičnih receptorjev beta kritično oceniti in upoštevati možnost zdravljenja z drugimi učinkovinami. Bolnike s srčnožilnimi boleznimi je treba spremljati, da boste pri njih pravočasno ugotovili znake poslabševanja bolezni in morebitne neželene učinke.

Zaradi neugodnega delovanja antagonistov adrenergičnih receptorjev beta na čas srčnega prevajanja jih smete pri bolnikih s srčnim blokom prve stopnje uporabljati le previdno.

Zaradi možnih učinkov antagonistov adrenergičnih receptorjev beta na krvni tlak in srčno frekvenco (hipotenzija, bradikardija) je potrebna previdnost pri bolnikih z možganskožilno insuficienco, nezdravljenim feokromocitomom ali metabolično acidozo, saj antagonisti adrenergičnih receptorjev beta lahko škodljivo vplivajo na te bolezni. Če se pojavijo znaki ali simptomi, je treba razmisliti o alternativnem zdravljenju.

Žilne bolezni

Bolnike s hudimi motnjami oziroma boleznimi perifernega ožilja (npr. s hudimi oblikami Raynaudove bolezni ali z Raynaudovim sindromom) je treba zdraviti previdno.

Bolezni dihal

Previdnost je potrebna pri zdravljenju bolnikov z glavkomom, ki imajo prekomerno zmanjšano pljučno funkcijo. Po uporabi nekaterih očesnih antagonistov adrenergičnih receptorjev beta so poročali o učinkih na dihalo, vključno s smrtjo zaradi bronhospazma pri bolnikih z astmo.

Previdnost je potrebna pri zdravljenju bolnikov z blago ali zmerno bronhialno astmo, blago ali zmerno bronhialno astmo v pretekli anamnezi ali blago ali zmerno kronično obstruktivno pljučno boleznijo (KOPB).

Hipoglikemija/diabetes

Antagoniste adrenergičnih receptorjev beta morate uporabljati previdno pri bolnikih, ki so nagnjeni k spontani hipoglikemiji ali pri sladkornih bolnikih (še posebej tistih z labilno sladkorno boleznijo). Antagonisti adrenergičnih receptorjev beta lahko prikrijejo znake in simptome akutne hipoglikemije.

Hipertiroidizem

Bolnike s tirotoksikozo ali sumom na nastajajočo tirotoksikozo je treba med očesnim zdravljenjem z betaksololom pazljivo spremljati, saj antagonisti adrenergičnih receptorjev beta lahko prikrijejo nekatere znake (npr. tahikardijo) in simptome hipertiroidizma. Njihova nagla ukinitve lahko povzroči tirotoksično krizo.

Mišična slabost

Poročali so, da antagonisti adrenergičnih receptorjev beta okrepijo mišično slabost, ki kaže na nekatere simptome miastenije (npr. diplopijo, ptozo in občutek splošne telesne nemoči).

Anafilaktične reakcije

Bolniki z atopijo v anamnezi ali s hudo anafilaktično reakcijo na različne alergene v anamnezi so lahko med jemanjem antagonistov adrenergičnih receptorjev beta bolj odzivni na večkratno izpostavljenost takim alergenom in neodzivni na običajne odmerke adrenalina, uporabljene za zdravljenje anafilaktičnih reakcij.

Drugi antagonisti adrenergičnih receptorjev beta

Betaksolol lahko medsebojno deluje z drugimi zdravili (glejte poglavje 4.5). Učinek na očesni tlak ali znani učinki sistemskih antagonistov adrenergičnih receptorjev beta se lahko okrepijo, če damo betaksolol bolniku, ki že jemlje sistemski antagonist adrenergičnih receptorjev beta. Odziv takih bolnikov je treba pozorno spremljati. Uporaba dveh antagonistov adrenergičnih receptorjev beta ni priporočljiva (glejte poglavje 4.5).

Kirurška anestezija

Očesna zdravila z antagonisti adrenergičnih receptorjev beta lahko zavrejo sistemske učinke beta agonistov npr. učinke adrenalina. Če bolnik prejema betaksolol, mora biti o tem obveščen tudi anesteziolog.

Pred splošno anestezijo boste morda morali postopoma ukiniti antagonist adrenergičnih receptorjev beta zaradi zmanjšane sposobnosti srca, da se odzove na beta adrenergične simpatične refleksne dražljaje.

Odstop žilnice

Med uporabo zdravil za zaviranje izločanja očesne vodke (npr. timolola, acetazolamida) so poročali o odstopu žilnice po filtracijskih posegih.

Bolezni roženice

Očesni antagonisti adrenergičnih receptorjev beta lahko povzročijo suhost oči, zato je potrebna previdnost pri zdravljenju bolnikov z boleznimi roženice.

Glavkom z zaprtim zakotjem

Pri bolnikih z glavkomom z zaprtim zakotjem je takojšnji cilj zdravljenja ponovno odpreti zakotje s konstrikcijo zenice z uporabo miotika. Betaksolol ima le majhen učinek ali nobenega učinka na zenico. Pri uporabi zdravila BETOPTIC S za zniževanje zvišanega očesnega tlaka pri glavkomu z zaprtim zakotjem ga morate uporabljati skupaj z miotikom in ne samega.

Kontaktne leče

Zdravilo BETOPTIC S vsebuje konzervans benzalkonijev klorid, ki lahko povzroči draženje oči in znano je, da spremeni barvo mehkih kontaktnih leč. Stiku z mehкими kontaktnimi lečami se je treba

izogibati. Bolnikom je treba svetovati, naj po vkapanju zdravila BETOPTIC S počakajo najmanj 15 minut, preden si kontaktne leče spet vstavijo.

4.5 Medsebojno delovanje z drugimi zdravili in druge oblike interakcij

Specifičnih študij medsebojnega delovanja drugih zdravil z betaksololom niso izvedli.

Pri sočasni uporabi očesne raztopine antagonistov adrenergičnih receptorjev beta s peroralnimi zaviralci kalcijevih kanalčkov, antagonisti adrenergičnih receptorjev beta, antiaritmiki (vključno z amiodaronom), glikozidi digitalisa, parasimpatikomimetiki ali gvanetidinom obstaja možnost aditivnega delovanja, ki vodi do hipotenzije in/ali izrazite bradikardije. Sočasna uporaba očesnega antagonista adrenergičnih receptorjev beta z digitalisom ima lahko aditivne učinke na podaljšanje časa atrioventrikularnega prevajanja.

Pri dajanju antagonista adrenergičnih receptorjev beta bolnikom, ki prejemajo zdravila, ki zmanjšajo količino kateholaminov, npr. rezerpin, je priporočljivo skrbno opazovanje bolnika zaradi možnega aditivnega delovanja in nastanka hipotenzije in/ali bradikardije, ki se kaže kot vrtočlavica, sinkopa ali položajna hipotenzija.

Učinek betaksolol kapljic za oko na znižanje očesnega tlaka se lahko okrepi tudi v kombinaciji s topikalnimi miotiki in/ali s sistemskimi inhibitorji karboanhidraze.

Očesni antagonisti adrenergičnih receptorjev beta in zdravila, ki vsebujejo fenotiazine, imajo lahko hipotenzivne učinke zaradi medsebojne inhibicije presnove.

Antagonisti adrenergičnih receptorjev beta lahko povečajo hipoglikemični učinek antidiabetikov, lahko pa tudi prikrijejo znake in simptome hipoglikemije (glejte poglavje 4.4).

Antagonisti adrenergičnih receptorjev beta lahko zmanjšajo učinek adrenalina, uporabljenega za zdravljenje anafilaktičnih reakcij. Posebna previdnost je potrebna pri bolnikih z atopijo in anafilakso v pretekli anamnezi.

Občasno so poročali o midriazi, ki se je pojavila kot posledica sočasne uporabe očesnih antagonistov adrenergičnih receptorjev beta in adrenalina (epinefrina).

Če bolnik uporablja več kot eno topikalno očesno zdravilo, naj jih uporablja z razmikom najmanj 5 minut. Mazila za oko naj uporabi na koncu.

4.6 Plodnost, nosečnost in dojenje

Plodnost

Podatkov o učinkih uporabe zdravila BETOPTIC S na plodnost pri ljudeh ni.

Nosečnost

Ni zadostnih podatkov o uporabi betaksolola pri nosečnicah. Zdravila BETOPTIC S ne smete uporabljati med nosečnostjo, če ni nujno potrebno. Glede zmanjšanja sistemske absorpcije zdravila glejte poglavje 4.2.

Epidemiološke študije niso pokazale malformacijskih učinkov zdravila, kažejo pa tveganje za intrauterini zastoj rasti ploda pri peroralni uporabi antagonistov adrenergičnih receptorjev beta. Poleg tega so pri novorojenčkih opazili znake in simptome zavore adrenergičnih receptorjev beta (npr. bradikardijo, hipotenzijo, dihalno stisko in hipoglikemijo), če je mati uporabljala antagoniste adrenergičnih receptorjev beta do poroda. Zdravila BETOPTIC S ne smete uporabljati med nosečnostjo, če ni nujno potrebno. Vendar če mati uporablja zdravilo BETOPTIC S do poroda, je treba novorojenčka skrbno spremljati v prvih nekaj dneh življenja.

Dojenje

Antagonisti adrenergičnih receptorjev beta se izločajo v materino mleko in lahko povzročijo resne neželene učinke pri dojenih otrocih zdravljenih mater. Vendar pa pri terapevtskih odmerkih betaksolola v kapljicah za oko ni verjetno, da bodo v materino mleko prišle zadostne količine zdravila, ki bi povzročile klinične simptome zaviranja adrenergičnih receptorjev beta pri dojenčku. Glede zmanjšanja sistemske absorpcije zdravila glejte poglavje 4.2.

4.7 Vpliv na sposobnost vožnje in upravljanja strojev

Zdravilo BETOPTIC S nima vpliva ali ima zanemarljiv vpliv na sposobnost vožnje in upravljanja strojev. Vendar, kot pri vseh drugih kapljicah za oko, lahko začasno zamegljen vid ali druge motnje vida vplivajo na sposobnost bolnika za vožnjo ali delo s stroji. Če ima po vkapanju zdravila bolnik zamegljen vid, mora počakati, da se mu vid zbistri, preden sme voziti ali upravljati stroje.

4.8 Neželeni učinki

Povzetek varnostnega profila zdravila

V kliničnih preskušanjih s kapljicami za oko, ki so vsebovale betaksolol, je bil najpogostejši neželeni učinek neprijeten občutek v očesu, ki se je pojavil pri 12,0 % bolnikov.

Tabelarni pregled neželenih učinkov

Naslednji neželeni učinki so razvrščeni v skladu z naslednjim dogovorom: zelo pogosti ($\geq 1/10$), pogosti ($\geq 1/100$ do $< 1/10$), občasni ($\geq 1/1.000$ do $< 1/100$), redki ($\geq 1/10.000$ do $< 1/1.000$), zelo redki ($< 1/10.000$) ali pogostnost neznana (pogostnosti ni mogoče oceniti iz razpoložljivih podatkov). V okviru vsake skupine pogostnosti so neželeni učinki razvrščeni po padajoči resnosti. Neželene učinke so opazili v kliničnih preskušanjih z zdravilom BETOPTIC S in pri uporabi zdravila.

Razvrstitev po organskih sistemih	Izraz po klasifikaciji MedDRA
Bolezni imunskega sistema	<i>Neznana</i> : preobčutljivost
Psihiatrične motnje	<i>Redki</i> : tesnoba <i>Neznana</i> : nespečnost, depresija
Bolezni živčevja	<i>Pogosti</i> : glavobol <i>Redki</i> : sinkopa <i>Neznana</i> : omotica
Očesne bolezni	<i>Zelo pogosti</i> : neprijeten občutek v očesu <i>Pogosti</i> : zamegljen vid, povečano solzenje <i>Občasni</i> : točkasti keratitis, keratitis, konjunktivitis, blefaritis, poslabšanje vida, fotofobija, očesna bolečina, suho oko, astenopija, blefarospazem, očesni pruritus, izcedek iz očesa, kraste na robu vek, vnetje očesa, draženje očesa, bolezen veznice, edem veznice, očesna hiperemija <i>Redki</i> : katarakta, motnje refrakcije <i>Neznana</i> : eritem očesne veke
Srčne bolezni	<i>Občasni</i> : bradikardija, tahikardija <i>Neznana</i> : aritmija
Žilne bolezni	<i>Redki</i> : hipotenzija
Bolezni dihal, prsnega koša in mediastinalnega prostora	<i>Občasni</i> : astma, dispneja, rinitis <i>Redki</i> : kašelj, izcedek iz nosu
Bolezni prebavil	<i>Občasni</i> : navzea <i>Redki</i> : disgevizija
Bolezni kože in podkožja	<i>Redki</i> : dermatitis, osip <i>Neznana</i> : periorbitalni edem, alopecija, glositis
Motnje reprodukcije in dojk	<i>Redki</i> : zmanjšan libido
Splošne težave in spremembe na mestu	<i>Neznana</i> : astenija

Razvrstitev po organskih sistemih	Izraz po klasifikaciji MedDRA
aplikacije	

Opis izbranih neželenih učinkov

Kakor druga topikalno uporabljena očesna zdravila, se tudi betaksolol absorbira v sistemski krvni obtok in lahko povzroči podobne neželene učinke, kot so jih opazili pri sistemski uporabi antagonistov adrenergičnih receptorjev beta. Incidenca sistemskih neželenih učinkov po topikalni očesni uporabi je manjša kot pri sistemski uporabi. Našteti neželeni učinki zajemajo tudi tiste, ki so jih opazili pri uporabi zdravil iz razreda očesnih antagonistov adrenergičnih receptorjev beta. Dodatne neželene učinke so opazili pri očesnih antagonistih adrenergičnih receptorjev beta in se lahko pojavijo tudi pri kapljicah za oko, ki vsebujejo betaksolol.

Razvrstitev po organskih sistemih	Izraz po klasifikaciji MedDRA
Bolezni imunskega sistema	sistemske alergijske reakcije, vključno z angioedemom, urtikarijo, lokaliziranim in generaliziranim izpuščajem, pruritusom, anafilaktično reakcijo
Presnovne in prehranske motnje	hipoglikemija, tiroksikoza
Psihiatrične motnje	nočne more, izguba spomina, halucinacije, psihoze, zmedenost
Bolezni živčevja	cerebrovaskularni inzult, ishemija možgan, okrepljeni znaki in simptomi miastenije gravis, parestezija
Očesne bolezni	zamegljen vid in odstop žilnice po filtracijskem posegu (glejte poglavje 4.4), zmanjšana občutljivost roženice, erozija roženice, ptoza, diplopija
Srčne bolezni	bolečine v prsih, palpitacije, edem, kongestivno srčno popuščanje, atrioventrikularni blok, srčni zastoj, srčno popuščanje
Žilne bolezni	Raynaudov fenomen, hladne in cianotične dlani in stopala, povečanje obstoječe intermitentne klavdikacije
Bolezni dihal, prsnega koša in mediastinalnega prostora	bronhospazem (predvsem pri bolnikih z obstoječo bronhospastično boleznijo)
Bolezni prebavil	dispepsija, diareja, suha usta, bolečine v trebuhu, bruhanje
Bolezni kože in podkožja	psoriazi podoben izpuščaj ali poslabšanje psoriaze
Bolezni mišično-skeletnega sistema in vezivnega tkiva	mialgija
Motnje reprodukcije in dojk	spolne motnje, impotenca

Poročanje o domnevnih neželenih učinkih

Poročanje o domnevnih neželenih učinkih zdravila po izdaji dovoljenja za promet je pomembno. Omogoča namreč stalno spremljanje razmerja med koristmi in tveganji zdravila. Od zdravstvenih delavcev se zahteva, da poročajo o katerem koli domnevnem neželenem učinku zdravila na nacionalni center za poročanje:

Javna agencija Republike Slovenije za zdravila in medicinske pripomočke

Sektor za farmakovigilanco

Nacionalni center za farmakovigilanco

Slovenčeva ulica 22

SI-1000 Ljubljana

Tel: +386 (0)8 2000 500

Faks: +386 (0)8 2000 510

e-pošta: h-farmakovigilanca@jazmp.si

spletna stran: www.jazmp.si

4.9 Preveliko odmerjanje

Prevelik topikalni odmerek zdravila BETOPTIC S lahko sperete iz očesa (oči) z mlačno vodo ali fiziološko raztopino (0,9% raztopina natrijevega klorida).

V primeru nenamerne zaužitja so simptomi prevelikega odmerjanja sistemskega antagonista adrenergičnih receptorjev beta lahko bradikardija, hipotenzija, srčno popuščanje in bronhospazem. Če pride do prevelikega odmerjanja zdravila BETOPTIC S kapljice za oko, naj bo zdravljenje simptomatsko in podporno.

5. FARMAKOLOŠKE LASTNOSTI

5.1 Farmakodinamične lastnosti

Farmakoterapevtska skupina: zdravila za zdravljenje glavkoma in zdravila za zožitev zenice; antagonisti adrenergičnih receptorjev beta

Oznaka ATC: S01ED02

Betaksolol je kardioselektiven antagonist adrenergičnih receptorjev beta-1, nima bistvenega delovanja na stabilizacijo membrane (t.j. lokalnega anestetičnega delovanja) in nima intrinzičnega simpatikomimetičnega delovanja.

Zvišan očesni tlak je poglavitni dejavnik tveganja pri zmanjšanju vidnega polja zaradi glavkoma. Višji ko je očesni tlak, večja je verjetnost za poškodbo vidnega živca in zmanjšanje vidnega polja. Pri vkapanju v oko betaksolol zniža tako zvišan kot normalen očesni tlak, če ga spremlja glavkom ali ne. Videti je, da sestoji mehanizem njegovega hipotenzivnega delovanja na oko iz zmanjšanega nastajanja prekatne vodke, kar sta pokazali tudi tonografija in fluorofotometrija prekatne vodke. Nastop delovanja betaksolola lahko običajno opazimo v 30 minutah, največji učinek pa 2 uri po topikalni uporabi. Posamezen odmerek zagotavlja 12-urno znižanje očesnega tlaka.

Zdravilo BETOPTIC S kapljice za oko, suspenzija (betaksolol 2,5 mg/ml) zagotavlja zniževanje očesnega tlaka, ki je enakovredno znižanju, ugotovljenemu pri zdravilu BETOPTIC kapljice za oko, raztopina (betaksolol 5 mg/ml).

Periferno vazorelaksantno delovanje betaksolola so pokazali v študiji *in vivo* pri psih, medtem ko so vazorelaksantno delovanje in zaviranje kalcijevih kanalov pri betaksololu pokazali v večih študijah *in vitro*, pri katerih so uporabljali tako neočesno kot očesno ožilje podgan, buder, kuncev, psov, prašičev in govedi. Delovanje betaksolola kot nevroprotektivnega sredstva so pokazali *in vivo* in *in vitro* eksperimenti na mrežnicah kuncev, kulturah podganjega korteksa in kulturah piščančjih mrežnic.

Podatki, dobljeni med kontroliranimi kliničnimi študijami pri bolnikih s kroničnim glavkomom z odprtim zakotjem in očesno hipertenzijo kažejo, da ima zdravljenje z betaksololom večje dolgoročne koristi za vidno polje v primerjavi z zdravljenjem s timololom, neselektivnim antagonistom adrenergičnih receptorjev beta. Poleg tega med terapijo z betaksololom niso opazili nikakršnega negativnega učinka na oskrbo vidnega živca s krvjo. Betaksolol prej ohranja ali izboljša krvni pretok oz. perfuzijo v očesu.

Topikalno uporabljen betaksolol v obliki kapljic za oko ima le majhen učinek ali nobenega učinka na konstrikcijo zenice in minimalen učinek na pljučne in srčnožilne parametre.

Očesno zdravilo betaksolol nima bistvenega učinka na delovanje pljuč, kar so merili z največjim ekspiratornim volumnom na sekundo, največjo vitalno kapaciteto in z razmerjem med njima. Niso opazili nobenih znakov zavore adrenergičnih receptorjev beta v srčnožilnem sistemu med naporom.

Peroralno uporabljeni antagonisti adrenergičnih receptorjev beta zmanjšajo minutni volumen srca pri zdravih preiskovancih in pri bolnikih s srčnimi boleznimi. Pri bolnikih s hudo zmanjšano miokardno funkcijo lahko antagonisti adrenergičnih receptorjev beta zavirajo simpatični stimulacijski učinek, ki je potreben za ohranjanje ustreznega delovanja srca.

Izsledki kliničnih študij kažejo, da je bilo zdravilo BETOPTIC S kapljice za oko, suspenzija, bistveno bolj prijetno od zdravila BETOPTIC kapljice za oko, raztopina.

Polarnost betaksolola lahko povzroči navidezen neprijeten občutek v očesu. Pri zdravilu BETOPTIC S so molekule betaksolola ionsko vezane na amberlitno smolo. Po vkapanju zdravila natrijevi ioni iz solznega filma izrinejo molekule betaksolola. Ta proces izrivanja traja več minut in okrepi prijeten občutek v očesu, ki so ga opazili pri uporabi zdravila BETOPTIC S.

5.2 Farmakokinetične lastnosti

Absorpcija

Betaksolol je močno lipofilen, kar povzroči njegovo dobro prehajanje v roženico in omogoči doseganje visokih koncentracij zdravila v notranjosti očesa. Začetek delovanja betaksolola lahko običajno opazimo v 30 minutah, največji učinek pa 2 uri po topikalni uporabi. Enkratni odmerek zagotavlja 12-urno znižanje očesnega tlaka. Plazemska absorpcija betaksolola po topikalni očesni uporabi je majhna. V kliničnih farmakokinetičnih študijah so bile plazemske koncentracije pod mejo določljivosti 2 ng/ml. Za betaksolol je značilna dobra absorpcija pri peroralni uporabi z majhno izgubo pri prvem prehodu skozi jetra.

Porazdelitev

Specifičnih študij porazdelitve betaksolola po okularni uporabi niso izvedli.

Biotransformacija

Glavne presnovne poti vodijo v dve karboksikislinski obliki in v nespremenjen betaksolol v seču (približno 16% danega odmerka).

Izločanje

Betaksolol ima sorazmerno dolgo biološko razpolovno dobo, ki je približno 16 do 22 ur. Betaksolol se izloča predvsem skozi ledvica in ne z blatom.

5.3 Predklinični podatki o varnosti

Teratogenost

Od zdravila odvisna postimplantacijska izguba je bila dokazana pri kuncih in podganah pri peroralnih odmerkih betaksolola nad 12 mg/kg oziroma nad 128 mg/kg. Vendar pa teratogenih učinkov betaksolola niso opazili.

Kancerogenost

Vseživljenjske študije z uporabo betaksolola pri miših v peroralnih odmerkih 6, 20 ali 60 mg/kg na dan in pri podganah v odmerkih 3, 12 ali 48 mg/kg na dan niso pokazale nikakršnih kancerogenih učinkov.

Mutagenost

V seriji *in vitro* in *in vivo* testov na bakterijskih in sesalskih celicah se niso pokazali nikakršni mutageni učinki betaksolola.

6. FARMACEVTSKI PODATKI

6.1 Seznam pomožnih snovi

polistirendivinilbenzen sulfonska kislina
karbomer
borova kislina (E284)
manitol (E421)
dinatrijev edetat
benzalkonijev klorid
N-lavroilsarkozin
natrijev hidroksid (E524) (za uravnavanje pH)
klorovodikova kislina (E507) (za uravnavanje pH)
prečiščena voda

6.2 Inkompatibilnosti

Navedba smiselno ni potrebna.

6.3 Rok uporabnosti

2 leti

Zavržite 4 tedne po prvem odprtju.

6.4 Posebna navodila za shranjevanje

Kapalni vsebnik shranjujte tesno zaprt.

Kapalni vsebnik shranjujte v zunanji ovojnini za zagotovitev zaščite pred svetlobo.

6.5 Vrsta ovojnine in vsebina

Kapalni vsebnik iz polietilena nizke gostote (DROP-TAINER) s polipropilensko navojno zaporko.

Škatla s kapalnim vsebnikom s 5 ml suspenzije.

6.6 Posebni varnostni ukrepi za odstranjevanje in ravnanje z zdravilom

Ni posebnih zahtev.

7. IMETNIK DOVOLJENJA ZA PROMET Z ZDRAVILOM

Novartis Pharma GmbH
Roonstrasse 25
D-90429 Nürnberg
Nemčija

8. ŠTEVILKA (ŠTEVILKE) DOVOLJENJA (DOVOLJENJ) ZA PROMET Z ZDRAVILOM

H/93/00272/001

**9. DATUM PRIDOBITVE/PODALJŠANJA DOVOLJENJA ZA PROMET Z
ZDRAVILOM**

Datum prve odobritve: 7. 5. 1993

Datum zadnjega podaljšanja: 26. 1. 2011

10. DATUM ZADNJE REVIZIJE BESEDILA

9. 4. 2018