

Состав

действующее вещество: 1 мл капле содержит гидрохлорида бетаксолола (в пересчете на 100% сухое вещество) 2,8 мг, что эквивалентно 2,5 мг бетаксолола;

вспомогательные вещества: натрия полистиролсульфонат, карбомер (974P), N-лауроилсаркозин, кислота борная, маннит (Е 421), динатрия эдетат, бензалкония хлорид, раствор натрия гидроксида и/или кислота хлористоводородная разбавленная, вода для.

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-адренергических рецепторов, который не оказывает значительного мембраностабилизирующего (местного анестезирующего) и выраженного симпатомиметического действия.

Повышенное внутриглазное давление является основным фактором риска развития глаукоматозной скотомы. Чем выше уровень внутриглазного давления, тем больше вероятность повреждения глазного нерва и потери поля зрения. После инстилляций в глаз бетаксолол способен снижать как повышенное, так и нормальное внутриглазное давление, независимо от того, сопровождается ли это глаукомой; механизм его гипотензивного действия связан с уменьшением продукции внутриглазной жидкости, как показывает тонография и флюорофотометрия. Бетаксолол начинает действовать через 30 минут, а максимальный эффект достигается через 2 часа после местного применения. Однократная доза обеспечивает понижение внутриглазного давления в течение 12 часов.

Вазорелаксационное действие бетаксолола на периферические сосуды было продемонстрировано в исследовании *in vivo* на собаках. Также

вазорелаксационное действие бетаксолола и его способность блокировать кальциевые каналы были продемонстрированы в нескольких исследованиях *in vivo*, в которых использовались модели глазных и неглазных сосудов крыс, морских свинок, кроликов, собак, свиней и коров. Действие бетаксолола как нейропротектора было продемонстрировано в экспериментах как *in vivo*, так и *in vitro* на сетчатке кроликов, кортикальных культурах крыс и культурах сетчатки цыплят.

Данные, полученные во время контролируемых клинических исследований с участием пациентов с хронической открытоугольной глаукомой и глазной гипертензией, указывают на то, что лечение с применением бетаксолола обеспечивает более длительное положительное влияние на поле зрения, чем при применении тимолола, неселективного бета-блокатора. Также 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 действие или совсем не влияет на сужение зрачка и имеет минимальное влияние на легочную и сердечно-сосудистую функцию. Бетаксолол для офтальмологического применения не оказывал существенного влияния на функцию легких, установленных при измерении объема максимального выдоха в секунду, максимального жизненного объема легких и их соотношения. Никаких признаков сердечно-сосудистой бета-адренергической блокады во время исследования не наблюдалось.

При пероральном применении бета-адренергические блокаторы уменьшают сердечный выброс у здоровых добровольцев и пациентов с заболеваниями сердца. У пациентов с тяжелыми нарушениями функции миокарда антагонисты бета-адренергических рецепторов могут ингибировать симпатический стимулирующий эффект, необходимый для поддержания адекватной сердечной функции.

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

Полярная природа бетаксолола может приводить к ощущению дискомфорта в глазах. В препарате Бетофтан молекулы бетаксолола связаны ионной связью с амберлитовой смолой. После инстилляции молекулы бетаксолола переносятся ионами натрия в слезную пленку. Этот процесс перемещения происходит в течение нескольких минут и усиливает офтальмологический комфорт при применении препарата Бетофтан.

Доклинические данные по безопасности

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

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

Исследования действия бетаксолола на репродуктивную функцию, а также тератологические, перинатальные и постнатальные исследования, проводившиеся на крысах и кроликах с пероральным применением бетаксолола гидрохлорида, продемонстрировали доказательства связи постимплантационного выкидыша у крыс и кроликов с применением препарата в дозе 128 мг/кг соответственно.

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

Фармакокинетика

Бетаксолол обладает высокой липофильностью, что приводит к высокой степени проницаемости в роговицу и высоким концентрациям препарата в тканях глаза. Содержание бетаксолола в плазме крови после местного применения низкое. Во время клинических фармакокинетических исследований концентрации в плазме крови были ниже предела количественного определения 2 нг/мл. Бетаксолол характеризуется хорошей абсорбцией при пероральном применении, низкими потерями при первом прохождении и относительно длительным периодом полувыведения составляет около 16-22 часов. Выводится бетаксолол обычно почками, меньше - с калом. Основными метаболитами являются две формы карбоксильной кислоты и бетаксолол в неизмененном виде, которые выводятся с мочой (около 16% принятой дозы).

Бетаксолол начинает действовать обычно через 30 минут, а максимальный эффект достигается через 2 часа после местного применения. Однократная доза обеспечивает понижение внутриглазного давления в течение 12 часов.

Показания

Для снижения внутриглазного давления у больных хронической открытоугольной глаукомой или глазной гипертензией (как монотерапия, так и в

комбинации с другими лекарственными средствами).

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к активной субстанции или любому из компонентов препарата.
- Синусовая брадикардия, синдром дисфункции синусового узла, дисфункция синус-предсердного узла, атриовентрикулярная блокада II или III степени, неконтролируемая водителем ритма. Выражена сердечная недостаточность или кардиогенный шок.
- Реактивное заболевание дыхательных путей, включая бронхиальную астму тяжелой степени или бронхиальную астму тяжелой степени в анамнезе, хронические обструктивные заболевания легких тяжелой степени.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Специальных исследований по взаимодействию бетаксолола с другими лекарственными средствами не проводилось.

- 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, парасимпатомиметиками, гуанетидином.
- Бета-блокаторы могут уменьшать чувствительность к адреналину, применяемому для лечения анафилактических реакций. Следует назначать с осторожностью пациентам с атопией или анафилаксией в анамнезе.
- В редких случаях сообщалось о мидриазае, возникавшем при сопутствующем применении офтальмологических бета-блокаторов и адреналина (эпинефрина).
- В случае одновременного применения несколько лекарственных средств для местного применения в глаз 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, параллельно применяющим адренергические психотропные средства, из-за риска усиления их действия.

Особенности применения

Только для офтальмологического применения.

Частота возникновения побочных реакций при местном применении в глаз ниже, чем при системном применении. Об уменьшении системной абсорбции см. См. раздел «Способ применения и дозы».

Заболевания роговицы

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

Другие бета-блокаторы

При применении бетаксолола пациентам, уже получающим системное бета-блокирующее средство, влияние на внутриглазное давление может усиливаться. Известны эффекты системной бета-блокады. При применении бета-блокирующих средств пациентам этой 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»).

Для снижения внутриглазного давления у пациентов с закрытоугольной глаукомой Бетофтан необходимо применять только в комбинации с миотическими средствами.

Хориоидная отслойка

Сообщалось о хориоидной отслойке при применении терапии супрессантами на водной основе (например, тимолол, ацетазоламид) после процедур фильтрации.

Хирургическая анестезия

Бета-блокирующие анестезирующие препараты могут блокировать действие системных бета-агонистов, например адреналина. Если пациент принимает бетаксолол, следует уведомить об этом анестезиолога.

Осуществляя носослезную окклюзию или удерживая веки закрытыми в течение 2 минут, можно снизить системную абсорбцию препарата. Это может снизить системное действие и увеличить местное действие лекарственных средств.

Общие

- Как и другие офтальмологические препараты для местного использования, бетаксолол абсорбируется системно. Из-за наличия бета-адренергического компонента при применении бетаксолола могут возникнуть такие же побочные реакции со стороны сердечно-сосудистой, дыхательной систем и

другие виды побочных реакций, как и при применении системных блокаторов бета-адренергических рецепторов.

Со стороны сердечной системы

- У пациентов с сердечно-сосудистыми заболеваниями (например, коронарное заболевание сердца, стенокардия Принцметала и сердечная недостаточность) и артериальной гипотензией следует критически оценивать необходимость терапии с применением блокаторов бета и рассмотреть возможность применения других действующих веществ. Необходимо наблюдать состояние пациентов с сердечно-сосудистыми заболеваниями. Из-за неблагоприятного воздействия бета-блокаторов на время проводимости их с осторожностью можно назначать только пациентам с блокадой сердца I степени.

Со стороны сосудистой системы

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

Со стороны дыхательных путей

- Поступали сообщения о реакциях со стороны дыхательной системы, в том числе о летальных случаях вследствие бронхоспазма, у пациентов с астмой после применения некоторых бета-блокаторов. Следует с осторожностью назначать этот препарат пациентам с бронхиальной астмой легкой/умеренной степени, в том числе в анамнезе, или хроническими обструктивными заболеваниями легких (ХОБЛ) легкой/умеренной степени.

Гипогликемия/диабет

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

Гипертиреоз

- Бета-адреноблокаторы могут маскировать признаки гипертиреоза.

Мышечная слабость

- Бета-адреноблокаторы могут усиливать слабость мышц, что 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 более сильную реакцию при повторном применении препарата с этими же аллергенами, а также могут не реагировать на обычные дозы адреналина, которые применяются для лечения .

Контактные линзы

- Бетофтан содержит бензалкония хлорид, который может вызвать раздражение глаз и обесцвечивать мягкие контактные линзы. Следует избегать контакта с мягкими контактными линзами. Пациентов следует предупредить о том, что необходимо снять контактные линзы перед применением глазных капель Бетофтан и подождать 15 минут, прежде чем вставлять контактные линзы.

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

Бетофтан® не влияет или оказывает незначительное влияние на способность управлять автотранспортом или работать с другими механизмами. Временное затуманивание зрения или другие нарушения зрения могут негативно влиять на способность управлять транспортными средствами или работать с другими механизмами. Если затуманивание зрения возникает во время закапывания, пациенту необходимо подождать, пока зрение прояснится, прежде чем управлять автотранспортом или другими механизмами.

Применение в период беременности или кормления грудью

Репродуктивная функция

Данные о влиянии лекарственного средства на репродуктивную функцию человека отсутствуют.

Беременность

Нет достаточных данных по применению бетаксолола беременным женщинам. Об уменьшении системной абсорбции см. См. раздел «Способ применения и дозы».

В эпидемиологических исследованиях не было выявлено негативного влияния на формирование плода, но при пероральном применении блокаторов бета был выявлен риск задержки внутриутробного развития. Кроме того, при применении бета-блокаторов к родам у новорожденных наблюдались симптомы бета-блокады (например, брадикардия, артериальная гипотензия, респираторный дистресс и гипогликемия).

Бетаксолон не следует применять в период беременности, кроме случаев острой необходимости. Однако, если Бетофтан применялся к родам, в первые дни после рождения необходимо осуществлять тщательный мониторинг состояния новорожденного.

Период кормления грудью

Бета-блокаторы проникают в грудное молоко, что может вызвать серьезные побочные эффекты у новорожденных, находящихся на грудном вскармливании. Однако при применении терапевтических доз бетаксола в виде глазных капель вряд ли в грудное молоко попадет количество препарата, которое может вызвать клинические симптомы бета-блокады новорожденного. Об уменьшении системной абсорбции см. См. раздел «Способ применения и дозы».

Способ применения и дозы

Для офтальмологического применения.

Применение взрослым, включая пациентов пожилого возраста

Рекомендуемая доза составляет 1 каплю Бетофтана, которую закапывают в конъюнктивальный мешок пораженного глаза (глаз) 2 раза в сутки. Некоторым пациентам для стабилизации гипотензивного действия лекарственное средство Бетофтан нужно применять несколько недель. Рекомендуется тщательное наблюдение за больными глаукомой.

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

После инстилляций рекомендуется плотное закрытие век или носослезная окклюзия. Это снижает системную абсорбцию лекарственных средств, введенных в глаза, и уменьшает вероятность возникновения системных побочных реакций.

При сопутствующей терапии другими местными офтальмологическими препаратами следует соблюдать интервал 10-15 минут между их применением.

Применение детям

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

Применение при нарушениях функции печени и почек

Бетофтан не исследовался у этой категории пациентов.

Способ применения

Перед применением препарата следует хорошо встряхнуть флакон.

Чтобы предотвратить загрязнение кончика капельницы и суспензии, необходимо соблюдать осторожность и не касаться век, близлежащих участков или других поверхностей кончиком флакона-капельницы.

Дети

Эффективность и безопасность глазных капель Бетофтан при применении пациентам в возрасте до 18 лет не установлены.

Передозировка

В случае случайного проглатывания препарата симптомы передозировки могут включать брадикардию, артериальную гипотензию, сердечную недостаточность и бронхоспазм.

В случае передозировки препаратом Бетофтан лечение должно быть симптоматическим и поддерживающим.

Побочные реакции

Краткий обзор данных по безопасности

Частым побочным эффектом, наблюдавшимся в течение клинических исследований препарата Бетофтан, было ощущение дискомфорта в глазу, что встречалось у 12% пациентов.

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

Система органов	Побочные реакции согласно классификатору MedDRA (версия 13.0)
Со стороны сердца	Нечасто: брадикардия, тахикардия
Со стороны нервной системы	Часто: головная боль Одиночные: синкопе
Со стороны органов зрения	Очень часто: чувство дискомфорта в глазу Часто: затуманивание зрения, усиленное слезотечение, ощущение постороннего тела в глазах Нечасто: точечный кератит, кератит, конъюнктивит, блефарит, снижение остроты зрения, нарушение зрения, светобоязнь, боль в глазах, сухость глаз, астигматизм, блефароспазм, необычное ощущение в глазах, зуд глаз, выделение из глаз, образование чешуек, воспаление глаз, раздражение глаз, конъюнктивальные нарушения, конъюнктивальный отек, глазная гиперемия Единичные: катаракта, офтальмологические нарушения
Со стороны дыхательных путей, торакальные и медиастинальные нарушения	Нечасто: астма, диспноэ, нарушение со стороны дыхательных путей, ринит. Единичные: кашель, ринорея
Со стороны желудочно-кишечного тракта	Нечасто: тошнота Единичные: дисгевзия
Со стороны кожи и подкожных тканей.	Единичные: дерматит, сыпь
Со стороны сосудов	Единичные: артериальная гипотензия
Психические расстройства	Единичные: беспокойство
Со стороны репродуктивной функции и молочных желез	Единичные: уменьшение либидо

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

Система органов	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
Со стороны сердца	аритмия
Со стороны кожи и подкожных тканей	облысение
Нарушение общего характера и состояние ввода	астения

Описание приведенных побочных реакций

Как и при применении других офтальмологических лекарственных средств местного действия бетаксолол абсорбируется в системное кровообращение. Это может привести к подобным нежелательным 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 бета-блокаторов для офтальмологического применения.

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

Со стороны иммунной системы: системные аллергические реакции, включающие ангионабряк, крапивницу, локализованную и генерализованную сыпь, зуд, анафилактическую реакцию, токсический эпидермальный некролиз.

Со стороны метаболизма и усвоения питательных веществ: гипогликемия.

Психические расстройства: депрессия, ночные ужасы, утрата памяти, галлюцинации, психоз, спутанность сознания.

Со стороны нервной системы: синкопе, нарушение мозгового кровообращения, ишемия головного мозга, усиление признаков и симптомов миастении gravis, парестезия.

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, дип. .

Кардиологические нарушения: боль в груди, учащенное сердцебиение, отек, застойная сердечная недостаточность, атриовентрикулярная блокада, останов 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 бронхоспастическим заболеванием).

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

Со стороны кожи и подкожных тканей: псориазообразная сыпь или обострение псориаза.

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

Со стороны репродуктивной системы и молочной железы: половая дисфункция, импотенция.

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

Дополнительно было обнаружено повышение уровня антинуклеарных антител; клиническая релевантность не установлена.

Срок годности

2 года.

Срок годности после вскрытия флакона 28 сут.

Не применять препарат по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 5 мл во флаконе; по 1 флакону в пачке из картона.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

АО «Фармак».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Украина, 04080, г. Киев, ул. Кирилловская, 74.

Источник инструкции

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