

CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

Betaxolol PMCS, 20 mg, tabletki

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

Każda tabletką zawiera 20 mg betaksololu chlorowodoru.
Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Tabletka.

Prawie biała, okrągła, obustronnie wypukła tabletką o średnicy 8 mm, z linią podziału po jednej stronie.

Tabletkę można podzielić na równe dawki.

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1 Wskazania do stosowania

Leczenie nadciśnienia tętniczego.

Leczenie profilaktyczne dławicy piersiowej wysiłkowej stabilnej.

Produkt wskazany jest do leczenia dorosłych pacjentów.

4.2 Dawkowanie i sposób podawania

Dawkowanie

Dorośli

Nadciśnienie tętnicze

Zwykle stosowana dawka wynosi 20 mg raz na dobę.

Dławica piersiowa wysiłkowa stabilna

Zwykle stosowana dawka to jedna tabletką (20 mg) raz na dobę. U niektórych pacjentów (np. pacjenci z przewlekłą, obturacyjną chorobą płuc) właściwe jest rozpoczęcie leczenia od mniejszej dawki 10 mg na dobę. W niektórych przypadkach konieczne może być zwiększenie dawki dobowej do 40 mg.

Szczególne grupy pacjentów

Zaburzenie czynności nerek lub wątroby

- U pacjentów z zaburzeniem czynności nerek (klirens kreatyniny 20 ml/min lub powyżej) nie ma konieczności dostosowania dawkowania, jednakże, zaleca się obserwację kliniczną na początku leczenia, do czasu uzyskania stabilnych stężeń produktu leczniczego w osoczu (średnio 4 dni).
- U pacjentów z ciężkim zaburzeniem czynności nerek (klirens kreatyniny mniejszy niż 20 ml/min) oraz u pacjentów poddawanych hemodializie lub dializie otrzewnowej nie należy przekraczać dawki 10 mg/dobę. U pacjentów poddawanych dializoterapii dawka dobową może być podawana niezależnie od częstości i czasu dializy.
- U pacjentów z niewydolnością wątroby nie ma konieczności dostosowania dawkowania. Zaleca się uważną kontrolę kliniczną na początku leczenia.

Osoby w podeszłym wieku

U pacjentów w podeszłym wieku leczenie należy rozpoczynać ostrożnie od małych dawek oraz ściśle

kontrolować stan kliniczny pacjenta (patrz punkt 4.4).

Dzieci i młodzież

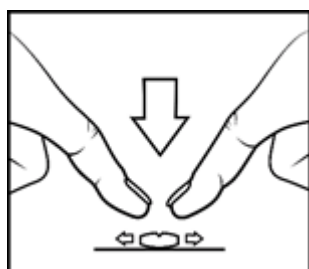
Nie ustalono dotąd bezpieczeństwa stosowania i skuteczności betaksololu u dzieci i młodzieży, z tego względu nie zaleca się jego stosowania w tych grupach wiekowych (patrz punkt 4.4).

Sposób podawania

Podanie doustne.

Spożyty równocześnie pokarm oraz jego skład nie wpływają na dostępność biologiczną betaksololu. Produkt należy przyjmować o tej samej porze każdego dnia, najlepiej rano.

Tabletki można podzielić na dwie części, tak jak to pokazano na rysunku. W tym celu należy położyć tabletkę na twardej powierzchni, linią podziału do góry a następnie przełamać na dwie równe części, przyciskając każdy z końców w dół palcami wskazującymi obu rąk (należy zastosować krótki, silny nacisk).



4.3 Przeciwwskazania

- nadwrażliwość na substancję czynną lub na którąkolwiek substancję pomocniczą, wymienioną w punkcie 6.1,
- ciężkie postaci astmy oskrzelowej lub przewlekłej, obturacyjnej choroby płuc,
- niewyrównana niewydolność serca,
- wstrząs kardiogeny,
- blok przedsionkowo-komorowy II i III stopnia, z wyjątkiem osób z wszczepionym stymulatorem,
- dławica Prinzmetala (w czystej postaci i jako monoterapia),
- zespół chorego węzła zatokowo-przedsionkowego, w tym blok zatokowo-przedsionkowy,
- ciężka bradykardia (poniżej 45-50 uderzeń na minutę),
- ciężkie postaci choroby Raynauada i zaburzeń tętnic obwodowych,
- nieleczony guz chromochłonny nadnerczy,
- niedociśnienie tętnicze,
- reakcje anafilaktyczne w wywiadzie,
- kwasica metaboliczna,
- jednoczesne stosowanie z floktafeniną lub z sultoprydem (patrz punkt 4.5).

4.4 Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

U pacjentów ze stabilną dławicą piersiową, nie należy nagle przerwać stosowania produktu, ponieważ może to spowodować ciężkie zaburzenia rytmu serca, zawał mięśnia sercowego lub nagły zgon.

Przerwanie leczenia

Nie należy nagle przerywać leczenia, szczególnie u pacjentów z chorobą niedokrwinną serca. Dawkę należy zmniejszać stopniowo, przez okres 1 do 2 tygodni. Jeżeli jest to konieczne, leczenie innym lekiem przeciwdławicowym należy rozpocząć równocześnie ze zmniejszaniem dawki betaksololu, w celu uniknięcia zaostrzenia dławicy piersiowej.

Astma i przewlekła obturacyjna choroba płuc

Leki hamujące receptory beta-adrenergiczne mogą być podawane tylko w przypadku łagodnych postaci tych chorób, a leczenie należy rozpocząć od małej dawki kardioselektywnego leku beta-adrenolitycznego. Przed rozpoczęciem leczenia lekiem beta-adrenolitycznym zaleca się przeprowadzenie badań czynności płuc.

Jeśli podczas leczenia wystąpi napad astmy, można zastosować lek pobudzający receptory beta₂, rozszerzający oskrzela.

Niewydolność serca

U pacjentów ze skompensowaną niewydolnością serca, w razie potrzeby można podawać betaksolol w stopniowo zwiększających się dawkach. Leczenie należy rozpocząć od bardzo małych dawek. Pacjenci powinni znajdować się pod stałą obserwacją lekarza.

Bradykardia

Konieczne jest zmniejszenie dawki betaksololu, jeżeli częstość akcji serca w spoczynku jest mniejsza niż 50-55 uderzeń na minutę oraz jeśli wystąpią objawy bradykardii.

Blok przedsionkowo-komorowy I stopnia

Ze względu na ujemne dromotropowe działanie leków beta-adrenolitycznych, należy zachować ostrożność podczas stosowania betaksololu u pacjentów z blokiem przedsionkowo-komorowym I stopnia.

Dławica Prinzmetala

Leki hamujące receptory beta-adrenergiczne mogą zwiększyć częstość i czas trwania napadów u pacjentów z dławicą Prinzmetala. W postaciach łagodnych i mieszanych można stosować kardioselektywne beta-adrenolityki, pod warunkiem, że jednocześnie stosuje się lek rozszerzający naczynia krwionośne.

Zaburzenia tętnic obwodowych

Stosowanie leków beta-adrenolitycznych u pacjentów z chorobami tętnic obwodowych (zespół lub choroba Raynauda, zapalenie tętnic lub przewlekłe niedokrwienie kończyn dolnych) może prowadzić do nasilenia objawów.

Guz chromochłonny nadnerczy

Podczas stosowania leków beta-adrenolitycznych w leczeniu wtórnego nadciśnienia tętniczego spowodowanego leczeniem guza chromochłonnego nadnerczy wymagane jest ściśle monitorowanie ciśnienia tętniczego krwi pacjenta.

Dzieci i młodzież

Nie ustalono dotąd bezpieczeństwa stosowania i skuteczności betaksololu u dzieci i młodzieży, z tego względu nie zaleca się jego stosowania w tych grupach wiekowych. U dzieci, działanie hipoglikemizujące leków beta-adrenolitycznych może wystąpić szybciej, co prowadzi do zwiększonego ryzyka drgawek w tej grupie wiekowej.

Osoby w podeszłym wieku

U pacjentów w podeszłym wieku leczenie należy rozpoczynać od małych dawek oraz ściśle kontrolować stan kliniczny pacjenta.

Zaburzenie czynności nerek

U pacjentów z zaburzeniem czynności nerek dawkowanie należy dostosować do stężenia kreatyniny we krwi lub do klirensu kreatyniny (patrz punkt 4.2).

Pacjenci z cukrzycą

Leki beta-adrenolityczne mogą maskować niektóre objawy hipoglikemii, szczególnie tachykardię, kołatanie serca i pocenie się (patrz punkt 4.5). Pacjentów należy poinformować o konieczności częstszego kontrolowania stężenia glukozy we krwi,

szczególnie na początku leczenia.

Łuszczyca

Należy dokładnie rozważyć korzyści z zastosowania leków beta-adrenolitycznych u pacjentów z łuszczycą lub z łuszczycą w wywiadzie rodzinnym, ponieważ donoszono o nasileniu objawów łuszczycy u pacjentów leczonych lekami beta-adrenolitycznymi.

Reakcje alergiczne

U pacjentów podatnych na występowanie ciężkich reakcji anafilaktycznych, niezależnie od przyczyny, szczególnie po podaniu środków kontrastowych, zawierających jod lub floktafeninę (patrz punkty 4.3 i 4.5) oraz u pacjentów poddawanych terapii odczulającej, leczenie lekiem beta-adrenolitycznym może prowadzić do zaostrzenia reakcji uczuleniowej i oporności na działanie adrenaliny, podawanej w zwykle stosowanych dawkach.

Znieczulenie ogólne

Leki działające beta-adrenolitycznie zmniejszają odruchowy częstoskurcz i zwiększają ryzyko wystąpienia niedociśnienia tętniczego. U pacjentów poddawanych znieczuleniu ogólnemu, blokada receptorów beta-adrenergicznych zmniejsza częstość występowania zaburzeń rytmu serca, niedokrwienia mięśnia sercowego oraz przełomu nadciśnieniowego w czasie indukcji znieczulenia. Należy poinformować anestezjologa o stosowaniu leku beta-adrenolitycznego.

Jeżeli konieczne jest przerwanie leczenia, to uznaje się, że 48 godzin jest wystarczającym okresem na uzyskanie prawidłowej wrażliwości na katecholaminy.

W niektórych przypadkach nie należy przerywać stosowania leku beta-adrenolitycznego:

- u pacjentów z chorobą niedokrwinną serca, ze względu na ryzyko związane z nagłym przerwaniem stosowania leków beta-adrenolitycznych, zaleca się kontynuowanie leczenia aż do czasu operacji;
- w nagłych wypadkach oraz jeśli przerwanie leczenia jest niemożliwe, pacjentów należy chronić przed nadmiernymi reakcjami przywspółczulnymi za pomocą odpowiedniej premedykacji atropiną. W razie konieczności można powtórzyć podanie atropiny;
- należy wziąć pod uwagę ryzyko wystąpienia reakcji anafilaktycznych.

Okulistka

Blokada beta-adrenergiczna zmniejsza ciśnienie wewnątrzgałkowe i może mieć wpływ na niewłaściwy wynik testu na wykrycie jaskry. Należy poinformować lekarza okulistę o tym, że pacjent jest leczony betaxololem. Należy monitorować pacjentów, u których zastosowano leczenie ogólne i miejscowe, w postaci kropli do oczu, lekami hamującymi receptory beta-adrenergiczne, ze względu na możliwość sumowania się efektów leczenia.

Nadczynność tarczycy

Leki beta-adrenolityczne mogą maskować objawy sercowo-naczyniowe nadczynności tarczycy.

Sportowcy

Należy zwrócić uwagę na stosowanie produktu u sportowców, ponieważ Betaxolol PMCS zawiera substancję czynną, która może powodować dodatni wynik testu antydopingowego.

Informacja dotycząca substancji pomocniczych

Betaxolol PMCS zawiera sól.

Lek zawiera mniej niż 1 mmol (23 mg) sodu na jedną tabletkę, to znaczy lek uznaje się za „wolny od sodu”.

4.5 Interakcje z innymi produktami leczniczymi i inne rodzaje interakcji

Leczenie skojarzone przeciwwskazane

Floktafenina

W przypadku wstrząsu lub niedociśnienia tętniczego wywołanego floktafeniną, leki o działaniu beta-adrenolitycznym powodują zmniejszenie reakcji kompensacyjnych.

- *Sultopryd*

Zaburzenia automatyzmu serca (nasiloną bradykardia) z powodu dodatkowego czynnika wywołującego bradykardię.

Leczenie skojarzone niezalecane

- *Amiodaron*

Jednoczesne stosowanie leków o działaniu beta-adrenolitycznym z amiodaronem może powodować zaburzenia kurczliwości, automatyzmu i przewodnictwa mięśnia sercowego (z powodu zahamowania mechanizmów wyrównawczych ze strony układu współczulnego).

- *Glikozydy naparstnicy*

Jednoczesne stosowanie betaksololu z tymi produktami leczniczymi może wydłużać przewodzenie przedsionkowo-komorowe i prowadzić do wystąpienia bradykardii.

- *Werapamil*

Nie należy stosować betaksololu podczas leczenia werapamilem lub w ciągu kilku dni po zastosowaniu werapamilu (i *vice versa*).

- *Fingolimod*

Nie należy rozpoczynać leczenia fingolimodem u pacjentów przyjmujących leki o działaniu beta-adrenolitycznym, ze względu na możliwość nasilenia bradykardii. Jeśli takie leczenie skojarzone jest konieczne, zaleca się odpowiednie monitorowanie stanu pacjenta na początku leczenia, co najmniej przez noc.

Leczenie skojarzone wymagające zachowania środków ostrożności

- *Halogenowe wziewne leki znieczulające*

Leki o działaniu beta-adrenolitycznym hamują reakcje kompensacyjne ze strony układu sercowo-naczyniowego (podczas operacji blokowanie receptorów beta-adrenergicznych może być zniesione przez podanie leku pobudzającego receptory beta-adrenergiczne). Zazwyczaj, nie należy przerywać stosowania betaksololu podczas znieczulenia ogólnego. We wszystkich przypadkach należy unikać nagłego przerwania leczenia. Należy poinformować anestezjologa o leczeniu lekami beta-adrenolitycznymi.

- *Antagoniści wapnia (beprydyl, diltiazem, mibefradyl)*

Zaburzenia automatyzmu mięśnia sercowego (nasiloną bradykardia, zatrzymanie czynności węzła zatokowo-predsionkowego), zaburzenia przewodzenia przedsionkowo-komorowego i niewydolność serca (działanie synergiczne). Leczenie skojarzone tymi lekami można stosować wyłącznie pod ścisłą kontrolą kliniczną i kontrolą EKG, szczególnie na początku leczenia.

Diltiazem: Zgłaszano zwiększone ryzyko depresji podczas jednoczesnego stosowania diltiazemu i leków beta-adrenolitycznych (patrz punkt 4.8).

- *Leki przeciwwarytmiczne (propafenon i klasa Ia: chinidyna, hydrochinidyna i dyzopiramid)*

Zaburzenia kurczliwości, automatyzmu i przewodnictwa w mięśniu sercowym (zmniejszenie wyrównawczych mechanizmów współczulnych).

- *Baklofen*

Zwiększenie działania przeciwnadciśnieniowego.

Należy regularnie kontrolować ciśnienie tętnicze krwi i, w razie potrzeby, dostosować dawkę leku przeciwnadciśnieniowego.

- *Insulina i sulfonamidy zmniejszające stężenie glukozy we krwi (patrz punkty 4.4.)*

Wszystkie leki beta-adrenolityczne mogą maskować niektóre objawy hipoglikemii takie, jak kołatanie serca i tachykardia.

Należy poinformować pacjentów o tym oraz o konieczności częstszego kontrolowania stężenia glukozy we krwi, zwłaszcza na początku leczenia.

- *Lidokaina*

Opisano interakcje lidokainy z propranololem, metoprololem i nadololem.

Zwiększenie stężenia lidokainy we krwi z możliwym nasileniem działań niepożądanych neurologicznych i kardiologicznych (zmniejszenie metabolizmu lidokainy w wątrobie).

Należy dostosować dawkowanie lidokainy. Zaleca się ścisłą kontrolę kliniczną, kontrolę EKG oraz monitorowanie stężenia lidokainy we krwi podczas stosowania leku beta-adrenolitycznego i po zakończeniu jego stosowania.

- *Środki kontrastowe zawierające jod*

W przypadku wstrząsu lub niedociśnienia tętniczego związanego z zastosowaniem środków kontrastowych, zawierających jod, leki hamujące receptory beta-adrenergiczne powodują zmniejszenie reakcji wyrównawczych ze strony układu sercowo-naczyniowego.

Jeśli jest to możliwe, należy stopniowo przerwać stosowanie leków beta-adrenolitycznych przed badaniem radiologicznym z zastosowaniem środków kontrastowych. Jeśli konieczna jest kontynuacja leczenia lekiem beta-adrenolitycznym, badanie można wykonać jedynie, gdy zapewniony jest dostęp do oddziału intensywnej opieki medycznej.

Leczenie skojarzone wymagające rozważenia

- *Niesteroidowe leki przeciwzapalne (NLPZ)*

Zmniejszenie działania obniżającego ciśnienie tętnicze krwi (NLPZ hamują prostaglandyny rozszerzające naczynia i zatrzymanie wody i sodu w organizmie przez NLPZ pochodne pirazonu).

- *Antagoniści wapnia: dihydropirydyny, takie jak nifedypina*

Niedociśnienie tętnicze i niewydolność serca u pacjentów z utajoną lub niewyrównaną niewydolnością serca (ujemne inotropowe działanie dihydropirydyn *in vitro*, różniące się stopniem nasilenia w zależności od konkretnego produktu i prawdopodobnie addytywne do ujemnego inotropowego działania leków beta-adrenolitycznych). Leczenie lekami beta-adrenolitycznymi może zmniejszyć reakcję odruchową układu współczulnego występującą w przypadku nasilonych zaburzeń hemodynamicznych.

- *Trójpierścieniowe leki przeciwdepresyjne pochodne imipraminy, neuroleptyki*

Nasilenie działania obniżającego ciśnienie tętnicze krwi oraz ryzyko wystąpienia niedociśnienia ortostatycznego (działanie addytywne).

- *Kortykosteroidy i tetrakozaktyd*

Zmniejszenie działania obniżającego ciśnienie tętnicze krwi (zatrzymanie sodu i wody).

- *Meflochina*

Ryzyko wystąpienia bradykardii (addytywne działanie powodujące bradykardię).

- *Leki sympatykomimetyczne*

Ryzyko zmniejszenia działania leków beta-adrenolitycznych.

- *Klonidyna*

Pacjentów, u których planowane jest odstawienie klonidyny, a którzy leczeni są jednocześnie lekami blokującymi receptory beta-adrenergiczne, należy ściśle monitorować w celu wykrycia wystąpienia niedociśnienia tętniczego. Należy przerwać stosowanie leków beta-adrenolitycznych na kilka dni przed stopniowym zmniejszaniem dawki klonidyny.

Może wystąpić zahamowanie zatokowe, gdy leki beta-adrenolityczne, w tym betaksolol, stosowane są jednocześnie z innymi produktami leczniczymi, o których wiadomo, że powodują zahamowanie zatokowe (patrz punkt 4.8).

4.6 Wpływ na płodność, ciążę i laktację

Ciąża

Działanie teratogenne: Badania na zwierzętach nie wykazały żadnego działania teratogennego. Dotychczas nie donoszono o działaniu teratogennym u ludzi.

Leki beta-adrenolityczne zmniejszają przepływ przez łożysko, co może powodować wewnątrzmaciczną śmierć płodu, poronienie i przedwczesny poród. Ponadto, u płodu mogą wystąpić działania niepożądane (zwłaszcza hipoglikemia i bradykardia).

Noworodki: U noworodków matek leczonych lekami beta-adrenolitycznymi działanie tych leków utrzymuje się przez kilka dni po porodzie. Istnieje zwiększone ryzyko wystąpienia powikłań sercowych i płucnych u noworodków w okresie pourodzeniowym. Jeśli wystąpi niewydolności serca, noworodka należy przewieźć do oddziału intensywnej opieki medycznej (patrz punkt 4.9); należy unikać podawania środków zwiększających objętość osocza (ryzyko wystąpienia ostrego obrzęku płuc).

Donoszono również o występowaniu bradykardii, zaburzeniach oddychania i hipoglikemii u noworodka. Zaleca się ścisły nadzór nad noworodkiem w specjalistycznym ośrodku (monitorowanie częstości akcji serca i stężenia glukozy we krwi) przez pierwsze 3 do 5 dni po porodzie.

Nie zaleca się stosowania betaksololu podczas ciąży, chyba, że możliwe korzyści z leczenia matki przeważają nad ryzykiem dla noworodka.

Karmienie piersią

Betaksolol przenika do mleka matki. Ryzyko wystąpienia hipoglikemii i bradykardii nie zostało ocenione, dlatego nie zaleca się karmienia piersią podczas leczenia betaksololem.

4.7 Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn

Nie przeprowadzono badań nad wpływem betaksololu na zdolność prowadzenia pojazdów. Podczas prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn należy wziąć pod uwagę występujące sporadycznie zawroty głowy i uczucie zmęczenia.

4.8 Działania niepożądane

Do określenia częstości występowania działań niepożądanych zastosowany będzie następujący zapis:

Bardzo często ($\geq 1/10$)

Często ($\geq 1/100$ do $< 1/10$)

Niezbyt często ($\geq 1/1\ 000$ do $< 1/100$)

Rzadko ($\geq 1/10\ 000$ do $< 1/1\ 000$)

Bardzo rzadko ($< 1/10\ 000$)

Nieznana (częstość nie może być określona na podstawie dostępnych danych)

Kliniczne:

Zaburzenia metabolizmu i odżywiania

Bardzo rzadko: hipoglikemia, hiperglikemia.

Zaburzenia psychiczne

Często: osłabienie, bezsenność.

Rzadko: depresja.

Bardzo rzadko: omamy, splątanie, koszmary senne.

Zaburzenia układu nerwowego

Często: zawroty głowy, ból głowy.

Bardzo rzadko: parestezja obwodowa.

Nieznana: letarg.

Zaburzenia oka

Bardzo rzadko: zaburzenie widzenia.

Zaburzenia serca

Często: bradykardia, możliwa ciężka bradykardia.

Rzadko: niewydolność serca, obniżenie ciśnienia tętniczego, zwolnienie przewodzenia lub nasilenie istniejącego bloku przedsionkowo-komorowego.

Nieznana: zahamowanie zatokowe u predysponowanych pacjentów (np. pacjenci w podeszłym wieku lub pacjenci z istniejącą wcześniej bradykardią, zaburzeniami czynności węzła zatokowego lub blokiem przedsionkowo-komorowym).

Zaburzenia naczyniowe

Często: ziębnięcie kończyn.

Rzadko: zespół Raynauda, nasilenie istniejącego chromania przestankowego.

Zaburzenia układu oddechowego, klatki piersiowej i śródpiersia

Rzadko: skurcz oskrzeli.

Zaburzenia żołądka i jelit

Często: ból żołądka, biegunka, nudności i wymioty.

Zaburzenia skóry i tkanki podskórnej

Rzadko: reakcje skórne, w tym wykwity łuszczycopodobne lub nasilenie istniejącej łuszczycy (patrz punkt 4.4).

Nieznana: pokrzywka, świąd, nadmierne pocenie się, łysienie.

Zaburzenia układu rozrodczego i piersi

Często: impotencja.

Badania diagnostyczne:

Rzadko: pojawienie się przeciwciał przeciwjądrowych, którym w wyjątkowych przypadkach towarzyszyły objawy kliniczne, takie jak układowy toczeń rumieniowaty, które ustępowały po zakończeniu leczenia.

Zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych

Po dopuszczeniu produktu leczniczego do obrotu istotne jest zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych. Umożliwia to nieprzerwane monitorowanie stosunku korzyści do ryzyka stosowania produktu leczniczego. Osoby należące do fachowego personelu medycznego powinny zgłaszać wszelkie podejrzewane działania niepożądane za pośrednictwem

Departamentu Monitorowania Niepożądanych Działań Produktów Leczniczych

Urzędu Rejestracji Produktów Leczniczych, Wyrobów Medycznych i Produktów Biobójczych

Al. Jerozolimskie 181 C, 02-222 Warszawa

Tel.: +48 22 49 21 301, Faks: + 48 22 49 21 309, Strona internetowa: <https://smz.ezdrowie.gov.pl>

Działania niepożądane można zgłaszać również podmiotowi odpowiedzialnemu.

4.9 Przedawkowanie

Objawy przedawkowania:

W zależności od stopnia zatrucia, obraz kliniczny charakteryzuje się głównie objawami ze strony układu sercowo-naczyniowego i ze strony ośrodkowego układu nerwowego. Przedawkowanie może prowadzić do ciężkiego niedociśnienia, bradykardii, a nawet zatrzymania akcji serca, niewydolności serca i wstrząsu kardiogenego. W przypadkach przedawkowania zgłaszano również zahamowanie zatokowe. Ponadto, mogą wystąpić zaburzenia oddychania, skurcz oskrzeli, wymioty, zaburzenia świadomości i w pojedynczych przypadkach uogólnione drgawki.

W przypadku wystąpienia zagrażającej życiu bradykardii lub znacznego obniżenia ciśnienia tętniczego krwi należy zastosować następujące leczenie:

- atropina: 1 do 2 mg dożylnie,
- glukagon: 1 mg, w razie konieczności można powtórzyć dawkę
- następnie, jeśli zachodzi konieczność, można podać 25 µg izoprenaliny w powolnym wstrzyknięciu dożylnym lub dobutaminę w dawce 2,5 do 10 µg/kg mc./min.

W przypadku dekompensacji kardiologicznej u noworodków matek leczonych lekami beta-adrenolitycznymi należy:

- podać glukagon w dawce 0,3 mg/kg mc.,
- przewieźć noworodka do oddziału intensywnej opieki medycznej,
- podać izoprenalinę i dobutaminę: długotrwałe leczenie i stosowanie dużych dawek wymaga specjalistycznego monitorowania.

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

5.1 Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: Leki beta- adrenolityczne, wybiórcze beta-adrenolityki, kod ATC: C07AB05

Betaksolol jest kardioselektywnym lekiem blokującym receptory beta-adrenergiczne o długim czasie działania, bez wewnętrznej aktywności sympatykomimetycznej i o małym działaniu stabilizującym błony komórkowe. Dawki stosowane u pacjentów nie wywierają istotnego działania kardiodepresyjnego.

Ponieważ betaksolol jest selektywnym lekiem blokującym receptory beta-adrenergiczne, tj. kardioselektywnym, betaksolol nie wpływa ani na metabolizm sacharydów, ani na rozszerzanie oskrzeli przez leki betamimetyczne. Betaksolol reguluje wahania ciśnienia krwi spowodowane wysiłkiem lub stresem.

Betaksolol nie zmniejsza wydalania sodu przez nerki.

5.2 Właściwości farmakokinetyczne

Wchłanianie

Po podaniu doustnym substancja czynna wchłania się całkowicie i szybko. Efekt pierwszego przejścia przez wątrobę jest minimalny. Biodostępność jest wysoka i wynosi około 85%. W wyniku tego, zmienność wewnątrz- i międzyosobnicza stężeń w osoczu jest niewielka. Maksymalne stężenie w osoczu po doustnym podaniu dawki 20 mg jest osiągnięte w ciągu 2-4 godzin i wynosi od 30 do 60 ng/ml.

Dystrybucja

Betaksolol wiąże się z białkami osocza w około 50%, objętość dystrybucji wynosi około 6 l/kg.

Metabolizm

85-90% podanej dawki jest metabolizowane w wątrobie. Tylko jeden metabolit (2-3% podanej dawki), powstający w wyniku hydroksylowania alifatycznego, wykazuje działanie blokujące receptory beta-adrenergiczne. Metabolit ma właściwości selektywne, siła jego działania stanowi 50% siły działania betaksololu.

Eliminacja

10 do 15% podanej dawki wydalane jest w postaci niezmienionej przez nerki. Metabolity są wydalane głównie przez nerki.

Okres półtrwania w fazie eliminacji z osocza (15-20 h) umożliwia podawanie produktu w pojedynczej dawce dobowej. Okres półtrwania w fazie eliminacji z osocza jest wydłużony u pacjentów w podeszłym wieku i pacjentów poddawanych dializoterapii (24-30 h).

Zaburzenie czynności wątroby

Nie obserwowano żadnych istotnych zmian parametrów farmakokinetycznych u pacjentów z niewydolnością wątroby.

5.3 Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

Badania niekliniczne nie wykazały działania mutagennego i rakotwórczego betaksololu. Badania na zwierzętach nie wykazały żadnego działania teratogennego betaksololu. Dane dotyczące ludzi są ograniczone. Nie ma dowodów na to, że betaksolol może mieć potencjał teratogeny.

Długotrwałe badania na kilku gatunkach zwierząt wykazały, że betaksolol jest bardzo bezpiecznym produktem leczniczym o szerokim zakresie terapeutycznym.

6. DANE FARMACEUTYCZNE

6.1 Wykaz substancji pomocniczych

Celuloza mikrokrystaliczna
Kroskarmeloza sodowa
Krzemionka koloidalna bezwodna
Magnezu stearynian

6.2 Niezgodności farmaceutyczne

Nie dotyczy.

6.3 Okres ważności

4 lata.

6.4 Specjalne środki ostrożności podczas przechowywania

Nie przechowywać w temperaturze powyżej 30°C.

6.5 Rodzaj i zawartość opakowania

Blister PVC/PVDC/Aluminium w pudełku tekturowym.
Wielkość opakowań: 10, 20, 30, 50, 60, 90 i 100 tabletek.
Nie wszystkie wielkości opakowań muszą znajdować się w obrocie.

6.6 Specjalne środki ostrożności dotyczące usuwania i przygotowania produktu leczniczego do stosowania

Bez specjalnych zaleceń.

7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

PRO.MED.CS Praha a.s., Telčská 377/1, Michle, 140 00 Praha 4, Republika Czeska

8. NUMER POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

21594

**9. DATA WYDANIA PIERWSZEGO POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU
I DATA PRZEDŁUŻENIA POZWOLENIA**

Data wydania pierwszego pozwolenia na dopuszczenie do obrotu: 22.11.2013.

Data ostatniego przedłużenia pozwolenia: 16.10.2018

**10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU
CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO**

28.05.2023