“愛爾康”貝特舒眼用懸浮液

BETOPTIC S Sterile Ophthalmic Suspension

衛署藥輸字第 018776 號

本藥須由醫師處方使用

1. 適應症：

適用於慢性開放性隅角青光眼患者。

2. 用法用量：

每天兩次，一次 1-2 滴。如本藥尚不足以控制患者眼內壓時，可併用 pilocarpine、epinephrine 或服用 carbonic anhydrase inhibitors 製品。

3. 劑型及劑量

每瓶含有 5 ml、10 ml 或 15 ml 0.25% 無菌眼用懸浮液。

4. 禁忌

- 患有竇性心跳減慢症。
- 一級以上房室傳導阻滯。
- 心臟性休克。
- 明顯心臟衰竭之病人。
- 對本藥任一成份過敏者。

5. 警語與注意事項

5.1 一般

與許多局部投予的眼用藥品一樣，本藥可能會被全身性地吸收。而全身性投予 β - 腎上腺素受體抑制劑所產生之不良反應可能會發生在局部投予，例如，局部使用 β - 腎上腺素受體抑制劑導致嚴重的呼吸及心臟反應，包括氣喘病人因支氣管痙攣導致死亡及心臟衰竭致死的案例。

5.2 心臟衰竭

臨床上雖然 Betoptic S O.25% 眼用懸浮液對心跳速率及血壓影響甚微，但使用於曾患有心臟衰竭或心傳導阻斷之病人須謹慎觀察，一但發現有心臟衰竭的徵兆，應立即停藥。

5.3 糖尿病

對糖尿病病人使用 β - 腎上腺素受體抑制劑要多加注意，尤其是低血糖病人或正在接受胰島素或口服降血糖藥物病人，特別是罹患不安定性糖尿病病人 (Labile Diabetes)，因為 β - 腎上腺素性受體抑制劑可能會遮蔽急性低血糖的徵兆。

5.4 甲狀腺毒症

β - 腎上腺素受體抑制劑會遮蔽甲狀腺亢進的臨床徵兆（如：心悸亢進）。有甲狀腺毒症趨向之病人在服用 β - 腎上腺素受體抑制劑時不可突然停用，以免引發甲狀腺風暴。

5.5 肌肉無力（Muscle Weakness）

β - 腎上腺素受體抑制劑會加重肌肉無力的現象如肌無力症狀（如：複視、上眼瞼下垂及全身無力）。

5.6 手術麻醉

在重大手術前停用 β - 腎上腺素受體抑制劑的必要性或可取性仍有爭議。β - 腎上腺素受體抑制劑會降低心臟對 β - 腎上腺素導致的交感反射刺激之反應能力，這可能會增加手術過程中全身麻醉的風險，一些接受 β - 腎上腺素受體抑制劑的病人在麻醉期間經歷了長時間、嚴重的低血壓，亦有重新啟動和維持心跳的困難的案例。在接受例行性手術的病人中，考慮逐漸停用 β - 腎上腺素受體抑制劑。必要時，在手術過程中可以使用足夠劑量的腎上腺素促效劑來逆轉 β - 腎上腺素受體抑制劑的作用。

5.7 支氣管痙攣和阻塞性肺病

治療過度限制性肺功能障礙之青光眼病人，應特別謹慎。曾有報告顯示在 betaxolol 治療期間有氣喘發作及肺功能窘迫的現象發生。雖然針對這類病人再次使用 betaxolol 未出現肺功能異常的情形，亦不能排除對 β - 腎上腺受體抑制劑敏感的病人可能會有對肺功能方面的不良反應。

5.8 特異體質過敏症 / 過敏性反應

當使用 β - 腎上腺受體抑制劑時，有特異體質過敏病史或對各種過敏原有嚴重過敏性反應病史的病人，重覆以偶然、診斷性的或治療性的以這些過敏原激發，可能會更容易過敏。以正常劑量的 epinephrine 來治療這類病人的過敏性反應時，可能會沒有效果。

5.9 隅角閉鎖型青光眼

對於隅角閉鎖型青光眼的病人，立即處理的目標是打開隅角，這可能需要藉由縮瞳孔作用達成。betaxolol 僅有微少或不具縮瞳作用，故不應單獨使用於治療隅角閉鎖型青光眼。

5.10 血管功能不全

由於 β - 腎上腺受體抑制劑對血壓和脈搏的潛在影響，因此對於血管功能不全的病人應謹慎使用這些抑制劑。如果在開始用本藥治療後出現腦血流量減少或雷諾氏症現象發生的徵兆或症狀，應考慮替代療法。

5.11 細菌性角膜炎

細菌性角膜炎可能發生在使用多劑量包裝容器的局部眼用產品，多數案例是發生在這些容器無意中被併發角膜疾病或眼部上皮表面破損污染時。須指導病人如何正確的將眼用產品滴入眼睛 [見病人諮詢資訊 (17)]。

5.12 脈絡膜剝離

投予抑制房水形成劑治療後，曾有在青光眼濾過性手術後出現脈絡膜剝離現象的報告。

5.13 隱形眼鏡配戴者

本藥中所含的防腐劑 benzalkonium chloride 可能會被軟式隱形眼鏡吸收，故使用本藥前需先摘除隱形眼鏡，給藥後須等待 15 分鐘以上再重新戴上 [見病人諮詢資訊 (17)]。

6. 不良反應：

6.1 臨床試驗經驗

因為臨床試驗是在各種不同的條件下進行的，所以在藥物臨床試驗中觀察到的不良反應發生率不能直接與另一種藥物的臨床試驗中的發生率進行比較，並且可能無法反映到實際使用中觀察到的發生率。

臨床試驗中，使用本藥最常見的不良反應為暫時性的眼部不適。少數病人有出現下列的其他不良反應：

眼睛：視力模糊、點狀角膜炎、異物感、畏光、流淚、癢癢、眼睛乾燥、紅斑、發炎、分泌物增加、眼痛、視力降低和睫毛鱗屑。

全身性不良反應報告包括：

心血管：心跳減慢、心臟傳導阻斷及充血性衰竭。

肺：可能因呼吸困難、支氣管痙攣、氣管分泌物濃稠、氣喘或呼吸衰竭而產生肺壓迫感。

中樞神經系統：失眠、眩暈、頭暈、頭痛、抑鬱、嗜眠、重症肌無力的病徵和症狀加重。

其他：蕁麻疹、中毒性之表皮壞死、掉髮、舌炎。味覺及嗅覺感異常。

在兒童病人中進行為期 3 個月的雙盲、活性對照組的多中心研究，使用本藥的不良反應特徵與成人病人相似。

6.2 與 betaxolol 相關的其他潛在不良反應

使用其他含有 betaxolol 製劑有發生的其他醫療事件包括過敏反應、角膜敏感性減少、角膜點狀染色 (可能以樹枝狀呈現)、水腫和瞳孔大小不一。

7. 藥物交互作用

7.1 口服 β - 腎上腺素受體抑制劑

若同時口服其他 β - 腎上腺素受體抑制劑和使用本藥，可能產生藥物加成反應，例如在眼內壓或在其他 β - 腎上腺素阻斷劑的全身性作用方面。

7.2 Catecholamine 排空劑

建議對正在服用 Catecholamine 排空劑（如：Reserpine）之病人給予 β - 腎上腺素受體抑制劑時應密切觀察，因有造成加成反應之可能性以及產生低血壓和 / 或心跳減慢因而可能導致眩暈、暈厥或體位性低血壓。

7.3 併用腎上腺素精神藥物

Betaxolol 為一種 β - 腎上腺素受體抑制劑，因此併用腎上腺素精神藥物的病人應特別注意。

7.4 鈣離子拮抗劑、抗心律不整藥物和毛地黃

β - 腎上腺素受體抑制劑併用鈣離子拮抗劑、抗心律不整（包含 amiodarone）藥物和毛地黃可能會有加成反應導致低血壓和 / 或心跳減慢。

8. 特殊族群使用

8.1 懷孕

致畸作用

懷孕用藥級數 C：在口服投予 betaxolol HCl 於老鼠及兔子的繁殖、致畸胎和產前及產後的各種實驗中，有證據顯示在各別局部投予兔子及老鼠 12 mg/kg 及 128 mg/kg 時，betaxolol HCl 並無顯示致畸胎情形發生，因此在小於中毒劑量時的繁殖情形並無其它不良反應。在懷孕婦女並沒有適當及控制良好之研究報告，因此除非有必要，否則本藥不建議使用於孕婦。

8.3 哺乳婦女

尚未證實 betaxolol HCl 是否會經乳汁排泄。因為很多藥物服用後都會經由乳汁排泄，所以哺乳之婦女在使用本藥時要多加留意。

8.4 兒童病人

本藥使用在兒童方面的安全性和降眼壓的效果已經由為期 3 個月、多中心、雙盲且活性對照組的臨床試驗得到證實。

8.5 老人病人

使用在年長及年輕病人的試驗，其安全性或有效性並沒有整體的差異。

10. 藥物過量

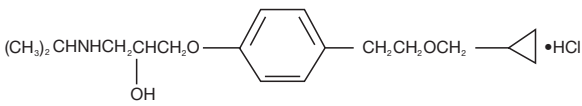
未有人類藥物過量的資料報告。對小白鼠及老鼠之口服 LD_{50} 各是 350-920 mg/kg 及 860-1050 mg/kg。而 β - 腎上腺素受體抑制劑的全身性藥物過量反應可預期有心跳徐緩、低血壓、支氣管痙攣及急性心臟衰竭。

局部使用本藥過量可用溫水沖洗眼睛。如果發生用藥過量，應進行症狀和支持性治療。

11. 簡介

BETOPTIC S 眼用懸浮液 0.25%，所含 betaxolol hydrochloride 是一種具心臟選擇性的 β - 腎上腺素受體抑制劑。Betaxolol hydrochloride 為白色結晶粉末，分子量 343.89。

化學結構如下：



分子式：$C_{18}H_{29}NO_3$•HCl

化學名：(±)-1-[p-[2-(cyclopropylmethoxy)ethyl]phenoxy]-3-(isopropylamino)-2-propanol hydrochloride.

主成份：每 ml 含 betaxolol HCl 2.8 mg (相當於 betaxolol 2.5mg)；

防腐劑：benzalkonium chloride 0.01%；

賦形劑：edetate disodium (dihydrate)、carbomer 934P、polystyrene sulfonic acid、mannitol、hydrochloric acid 和 / 或 sodium hydroxide (調整 pH)、purified water。

本產品之 pH 值約 7.6；滲透壓約為 290 mOsmol/kg。

12. 臨床藥理學：

12.1 作用機制

Betaxolol HCl 是屬於一種具心臟選擇性的 β - 腎上腺素受體抑制劑，不具顯著的穩定細胞膜 (局部麻醉) 作用，且不具體內擬交感神經作用。正常人及心臟病病人口服 β - 腎上腺素受體抑制劑會使心臟血液輸出量減低，但對心肌功能極度障礙病人，β - 腎上腺素性受體抑制劑可能會抑制維持心臟功能的交感神經興奮作用。

無論對高眼壓或青光眼病人，Betoptic S 0.25% 眼用懸浮液皆會使昇高的眼內壓下降。眼用 betaxolol 對心臟血管及肺臟的作用極小。

眼內壓增高為導致青光眼視力喪失的主要風險因子。眼內壓上昇愈高，視神經損害及視野喪失機率愈大。Betaxolol 有降低升高和正常眼壓的作用，藉由眼壓測定及房水螢光術測定可知 betaxolol 作用機制係由降低房水生成而達到降眼壓的作用。

12.2 藥物藥效學

Betaxolol 的降眼壓作用於 30 分鐘內開始，通常在給藥 2 小時後可達最大降壓效果，每一次點藥後可使降壓效果持續 12 小時之久。在一些病人中，對本藥的降眼壓效果可能需要幾週才能穩定，與使用任何新藥一樣，須仔細監測病人情況。

在一項以九位氣管疾病病人的交叉試驗中，測量第一秒強迫吐氣量 (FEV_1)、肺活量 (FVC) 及第一秒吐氣量 / 肺活量 (FEV_1/FVC)，顯示 betaxolol 1% 眼用溶液 (每一隻眼各點一滴) 與安慰劑對肺功能的影響並無明顯差異。在試驗末投予 isoproterenol (β - 接受體興奮劑)，結果顯示 betaxolol 不會抑制其作用。

在一項以 24 位健康受試者以 betaxolol 及安慰劑對血壓及心跳速率影響的雙盲交叉實驗中，使用 betaxolol 並沒有觀察到運動期間心血管 β - 腎上腺素阻滯的證據。

13. 非臨床毒理學

13.1 致癌性、致突變性、生育損害性

Betaxolol HCl 在小白鼠以三種口服劑量 6、20 或 60 mg/kg/day 及大鼠 3、12 或 48 mg/kg/day 的長期試驗中顯示 betaxolol HCl 並無致癌反應，而更高劑量之試驗則未進行。

在對細菌及哺乳動物細胞所做的各種體內和體外分析實驗中顯示 betaxolol HCl 並無導致突變反應。

14. 臨床試驗

在有對照、雙盲的試驗中顯示 Betoptic S 0.25% 眼用懸浮液與 Betoptic 0.5% 眼藥水二者的降壓效果及持續時間相等。而且 Betoptic S 眼用懸浮液比 Betoptic 眼藥水提供更大的舒適感。

16. 供應形式 / 儲存與操作

包裝：100 毫升以下無菌塑膠瓶裝。

正放儲存於 25°C 以下。使用前請充分振搖本藥。

17. 病人諮詢資訊

避免產品污染

指示病人避免將藥瓶滴管尖端接觸到眼睛或周圍結構；同時指示病人，如果處理不當，藥品可能引起眼部感染等常見細菌污染。戴隱形眼鏡時，請勿使用。使用受污染的溶液可能導致嚴重的眼睛損傷和隨後的視力喪失。

併發眼睛疾病

建議病人如果他們經歷眼部手術或發生眼部併發症（如創傷或感染），應立即尋求醫生指示能否繼續使用多次使用容器包裝的眼用藥物。

併用其他局部眼用藥物治療

建議需要同時使用局部眼用藥物的病人，要在使用其他藥物後至少 10 分鐘以上，才可使用本藥。

視覺暫時模糊

在使用本藥後，視覺可能暫時變得模糊，在操作機器或駕駛汽車時應該小心。

配戴隱形眼鏡者

本藥中所含的防腐劑 benzalkonium chloride 可能會被軟式隱形眼鏡吸收，故使用本藥前需先摘除隱形眼鏡，給藥後等待 15 分鐘再重新戴上。

Alcon®

a Novartis company

製造廠： Alcon Research Ltd.
廠　址：6201 South Freeway, Fort Worth, Texas 76134, USA
藥　商：台灣諾華股份有限公司
地　址：台北市中正區仁愛路二段 99 號 11 樓

References:

CCSI TDOC-0008214 v.7.0/CCDS TDOC-0018402 v.1.0
US PI revised on 3/2017
Local version: TWI-041018