

Состав

действующее вещество: тимолола малеат;

1 мл каплеглазных содержит тимолола малеат 6,84 мг, что соответствует 5,0 мг тимолола;

вспомогательные вещества: натрия дигидрофосфат, дигидрат; натрия фосфат додекагидрат; бензалкония хлорид, натрия гидроксид вода для инъекций.

Лекарственная форма

Капли глазные.

Основные физико-химические свойства: прозрачный, бесцветный раствор.

Фармакотерапевтическая группа

Противоугловодные и миотические средства. Блокаторы бета-адренорецепторов. Код АТХ S01E D01.

Фармакодинамика

Действующим веществом каплеглазных Офтан® Тимолол является L-изомер тимолола малеата. Тимолола малеат является неселективным бета-блокатором, который применяют для снижения кровяного и внутриглазного давления, а также при лечении стенокардии. L-тимолол имеет высокую аффинность к b-1 и b-2 рецепторам. Эффект снижения внутриглазного давления Офтан® Тимолол базируется на уменьшении образования внутриглазной жидкости. В глаза лекарственное средство вводят местно. Тимолол не имеет значительного влияния на отток внутриглазной жидкости. Неизвестно, влияет препарат на кровеносные сосуды передней части глаза, но со снижением внутриглазного давления сообщалось об улучшении кровообращения в сетчатке. Как и многие другие бета-блокаторы, тимолол имеет длительный пострецепторный эффект; адренорецепторы не могут опосредовать эффект агониста, ведь тимолол уже диссоциирован.

Тимолол не имеет собственной симпатомиметической активности и значительной мембраностабилизирующей активности. Офтан® Тимолол не влияет на размер зрачка или аккомодацию. Офтан® Тимолол подтвердил успешное применение при лечении открытоугольной глаукомы и глазной гипертензии. Препарат можно успешно применять при многих видах вторичной глаукомы. Офтан® Тимолол хорошо переносится и не вызывает зависимости от препарата.

Вероятно, из-за небольшую дозу синдром отмены, который следует наблюдать при лечении системным бета-блокаторами, не наблюдалось при прекращении лечения Офтан® Тимолол.

Пациенты детского возраста

Есть только очень ограниченные данные по применению тимолола (0,25%, 0,5%, одна капля два раза в сутки) педиатрическим пациентам в течение периода лечения до 12 недель. В клиническом исследовании, проведенном с участием 105 детей в возрасте от 12 дней до 5 лет, в определенной степени было продемонстрировано, что тимолол при показаниях первичной врожденной или первичной ювенильной глаукомы эффективен при кратковременном лечении.

Фармакокинетика

Тимолол является липидорастворимым веществом и, таким образом, хорошо всасывается в глаза. Препарат также может попадать в системный кровоток через конъюнктиву и слизистую оболочку носа, а также желудочно-кишечный тракт. Внутриглазное давление снижается вследствие местного действия. Максимальный эффект в глазу достигается через 3-4 часа после закапывания, и эффект может длиться 24 часа.

В эти тимолол связывается с поверхностью клеток во многих тканях, особенно с пигментными клетками эндотелия радужной оболочки и цилиарного отростками. Выводится из глаза с оттоком внутриглазной жидкости. Ожидаемый период полувыведения из тканей глаза составляет около 8 часов.

Тимолол метаболизируется в печени до неактивных метаболитов, которые выводятся главным образом почками. После приема дозы пресистемный метаболизм в печени значений, около 50%. Связывание с белками плазмы является умеренным (60%). Объем распределения в среднем превышает 2 л/кг, а вещество проходит через гематоэнцефалический барьер. Период полувыведения составляет около 4 часов.

Пациенты детского возраста

Как уже подтвердили данные на взрослых, 80% каждой капли препарата проходят через носослезный канал, где быстро всасываются в системный кровоток через слизистую оболочку носа, конъюнктиву, носослезного протока, ротоглотку и желудочно-кишечный тракт.

У детей концентрация препарата в крови выше, чем у взрослых. У новорожденных метаболизм недостаточно развит, что может привести к увеличению периода полувыведения лекарственного средства. Есть ограниченные данные о том, что уровень тимолола в плазме крови у детей,

получавших препарат в концентрации 0,25%, значительно превышает уровень у взрослых после применения препарата в концентрации 0,5%. У детей раннего возраста ожидается увеличение риска побочных реакций, таких как бронхоспазм и брадикардия.

Показания

Лечение открытоугольной глаукомы, повышенного внутриглазного давления, глаукомы после оперативного вмешательства по поводу катаракты, в отдельных случаях - вторичной глаукомы. Лечение закрытоугольной глаукомы при сопутствующего применения миотиков.

Лекарственное средство следует применять только по назначению офтальмолога или как продолжение лечения, начатого таким специалистом.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к активному веществу или к любому из вспомогательных веществ. Синусовая брадикардия, синдром слабости синусового узла, синоатриальная блокада сердца, антриовентрикулярная блокада второй и третьей степени, не контролируемая кардиостимулятором, выраженная сердечная недостаточность, кардиогенный шок.

Реактивные заболевания дыхательных путей, включая бронхиальную астму или бронхиальной астмой в анамнезе, тяжелое хроническое обструктивное заболевание легких.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Никаких исследований специфического взаимодействия лекарственного средства Офтан® Тимолол с другими лекарственными средствами не проводили.

Офтан® Тимолол, капли глазные, можно применять с другими антиглаукомных препаратами.

Снижение артериального давления и/или выраженная брадикардия могут потенцироваться при совместном применении офтальмологического раствора бета-блокатора с пероральными антагонистами кальция (блокаторы кальциевых каналов), бета-адреноблокаторами, антиаритмическими средствами (в том числе амиодарон), гликозидами наперстянки, парасимпатомиметики или гуанетидином. Кроме того, по состоянию пациентов, которые одновременно получают системный альфа-блокирующий агент, резерпин, антиаритмические

препараты I группы (например хинидин) или клонидин, следует наблюдать относительно возможного обострения побочных реакций. Во время комбинированного лечения ингибиторами CYP2D6 (например хинидином, флуоксетином, пароксетином) и тимололом сообщалось о потенциальной системную бета-блокаду (например снижение частоты сердечных сокращений, угнетение). Одновременное лечение барбитуратами, обезболивающими средствами или алкалоидами спорыньи может усилить побочные реакции со стороны центральной нервной системы. Иногда сообщалось о мидриаз, что возникает в результате одновременного применения офтальмологических бета-блокаторов и адреналина (эпинефрина).

Особенности применения

Перед началом лечения необходимо оценить состояние здоровья пациента (см. Раздел «Противопоказания»).

Поскольку реакция бета-блокаторы может меняться, рекомендуется измерить внутриглазное давление пациента через 2-4 недели после начала лечения. После этого пациенту следует регулярно проводить офтальмологическое обследование, поскольку в некоторых случаях реакция на тимолола малеат может изменяться при длительном применении.

Как и другие офтальмологические препараты, применяемые местно, тимолол системно абсорбируется. Через бета-адренергический компонент, тимолол, могут возникать такие же сердечно-сосудистые, легочные и другие побочные реакции, как и при применении системных бета-адреноблокаторов. Частота возникновения системных побочных реакций после местного офтальмологического применения ниже, чем при системном применении.

Другие бета-блокаторы

Влияние на внутриглазное давление или известные влияния системных бета-блокаторов могут усиливаться, когда тимолол применяется пациентами, которые уже получают пероральный бета-блокатор. Следует тщательно наблюдать за реакцией таких пациентов. Не рекомендуется использование двух местных бета-адреноблокаторов (см. Раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»).

Со стороны сердца

У пациентов с сердечно-сосудистыми заболеваниями (например, ишемическая болезнь сердца, стенокардия Принцметала и сердечная недостаточность) и гипотензии лечение бета-блокаторами нужно серьезно оценить и следует

рассмотреть лечения другими действующими веществами. Пациенты с сердечно-сосудистыми заболеваниями должны находиться под наблюдением на предмет ухудшения их состояния и любых побочных реакций.

Из-за их негативное влияние на время проведения импульса, бета-блокаторы следует назначать с осторожностью только тем пациентам, которые имеют блокаду сердца первой степени.

Со стороны сосудов

Пациентов с тяжелым периферическим нарушением/нарушениями кровообращения (то есть тяжелые формы болезни Рейно или синдром Рейно) необходимо лечить с осторожностью.

Со стороны дыхательной системы

Сообщалось о побочных реакциях со стороны дыхательной системы, включая смерть, через бронхоспазм у пациентов с астмой после применения некоторых офтальмологических бета-блокаторов. Препарат Офтан® Тимолол следует использовать с осторожностью пациентам с легким/умеренным хроническим обструктивным заболеванием легких (ХОБЛ) и только, если потенциальная польза превышает потенциальный риск.

Анафилактические реакции

Во время приема бета-блокаторов, пациенты с атопией в анамнезе или в анамнезе тяжелой анафилактической реакции на целый ряд различных аллергенов могут реагировать на повторные признаки аллергенов и не реагировать на обычную дозу адреналина, который используется для лечения анафилактических реакций.

Хирургические вмешательства с анестезией

Офтальмологические бета-блокаторы могут блокировать системное действие бета-агонистов, например, адреналина. Анестезиологу следует сообщить, если пациент получал тимолол.

Гипогликемия/сахарный диабет

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

Гипертиреоз (гиперфункция щитовидной железы)

Бета-блокаторы могут маскировать симптомы гипертиреоза.

Миастения гравис

У пациентов с миастенией гравис описывалось ухудшение общего состояния при использовании глазных капель тимолола.

Заболевания роговицы

Офтальмологические бета-блокаторы могут вызывать сухость глаз. Пациентов с заболеваниями роговицы следует лечить с осторожностью.

Отслойка хориона (сосудистая оболочка глаза)

Сообщалось о отслойка хориона при назначении лечения офтальмологическими супрессивными лекарственными средствами (например, тимолол, ацетазоламид) после фильтрующих процедур.

Использование контактных линз

Капли глазные Офтан® Тимолол содержат бензалкония хлорид как консервант, который может оседать на мягких контактных линзах и может менять цвет контактных линз. Перед закапыванием капель линзы необходимо снять и снова надеть их не ранее чем через 15 минут после применения препарата.

Бензалкония хлорид может также вызывать раздражение глаз, особенно в случае сухости глаз или поражения роговицы. Если после применения этого препарата вы чувствуете атипичную чувствительность глаз, жжение или боль в глазах, обратитесь к врачу.

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

При правильном режиме дозирования препарат Офтан® Тимолол не вызывает ослабление или нарушение зрения, а следовательно, и не оказывает негативного влияния на способность управлять автотранспортом или другими механизмами. Однако может снизить артериальное давление, может вызвать у некоторых пациентов обморок или головокружение.

В начале лечения об этом следует сообщить пациенту.

Применение в период беременности или кормления грудью

Беременность

Тимолол проходит через плаценту. Есть существующих достаточных данных по использованию тимолола у беременных женщин. Офтан® Тимолол не следует

использовать во время беременности, если это не явной необходимости. Системная абсорбция может быть снижена (см. Раздел «Способ применения и дозы»).

Эпидемиологические исследования не выявили никаких мальформативных эффектов, но продемонстрировали риск задержки внутриутробного развития при пероральном приеме бета-блокаторов. Кроме того, у новорожденных наблюдались признаки и симптомы бета-блокаторной действия (например, брадикардия, гипотензия, затрудненное дыхание и гипогликемия) при применении бета-блокаторов до начала родов. Если препарат Офтан® Тимолол применялся до начала родов, новорожденного следует тщательно контролировать в течение первых дней жизни.

Кормление грудью

Бета-блокаторы выводятся с грудным молоком. Однако терапевтическая доза тимолола в глазных каплях недостаточна для выявления его в грудном молоке и причинение симптомов бета-блокады у новорожденных. Системная абсорбция может быть снижена (см. Раздел «Способ применения и дозы»).

Способ применения и дозы

Дозы для взрослых

Одна капля 1-2 раза в сутки.

Дозировка составляет одну каплю в пораженный глаз 1-2 раза в сутки (утром и вечером).

Способ применения

Эффект снижения давления может обычно усиливаться при комбинации препарата Офтан® Тимолол с другими противоглаукомными препаратами (аналогами простагландинов, миотиками, адренергическими агонистами/адреномиметиками или ингибиторами карбоангидразы). При переходе с другой Противоглаукомные препарата на препарат Офтан® Тимолол необходимо сразу же прекратить прием предыдущего препарата и начать лечение препаратом Офтан® Тимолол, как описано выше.

При носослезная окклюзии или закрытии век в течение 2 минут снижается системная абсорбция лекарственного средства. В результате этого уменьшается вероятность возникновения системных побочных эффектов и увеличивается местная активность.

Дозы для детей

Необходимо тщательно оценить соотношение польза/риск применения тимолола детям, прежде чем назначать препарат. Нужно провести тщательное обследование и оценить анамнез перед началом применения тимолола детям для определения наличия системных нарушений.

Отсутствуют специальные рекомендации по дозировке, поскольку имеющиеся клинические данные ограничены (см. Раздел «Фармакологические»).

Однако, если польза преобладает над рисками, то рекомендуется использовать самую низкую дозу. Если внутриглазное давление недостаточно контролируется, то можно рассмотреть повышение дозы до 2 капель в пораженный глаз. При применении два раза в сутки следует выдерживать интервал 12 часов между приложениями.

Кроме того, пациентов, особенно новорожденными, следует тщательно наблюдать после первого применения дозы в течение 1-2 часов в кабинете врача и тщательно контролировать местные и системные побочные реакции к проведению хирургического вмешательства.

При применении в педиатрии концентрация 0,1% действующего вещества может быть достаточной.

Способ применения

Для ограничения развития побочных реакций следует использовать дозировку по 1 капле.

Системная абсорбция при местном применении бета-блокаторов после закапывания может быть уменьшена путем носослезного окклюзии и закрытия век в течение как можно более длительного периода (например, на 3-5 минут) (см. Разделы «Особенности применения» и «Фармакокинетика»).

Продолжительность лечения

Для временного лечения детей.

Дети

Из-за ограниченных данных тимолол может быть рекомендован только в случае первичной врожденной и первичной ювенильной глаукомы в течение переходного периода до принятия решения о хирургическом вмешательстве или назначения других вариантов лечения.

Передозировка

Передозировок следует избегать. Общее количество тимолола, который всасывается при приеме одной пероральной таблетки, равно количеству, полученной в результате применения 30 капель лекарственного средства Офтан® Тимолол, 5 мг/мл капель глазных, но поскольку препарат быстро всасывается через слизистую оболочку глаза и нос даже несколько капель могут вызвать аритмию, преходящее замедление частоты пульса, снижение артериального давления и бронхоспазм.

Лечение при передозировке симптоматическое, применяют адренергические агонисты (например изопреналин, добутамин и, возможно, допамин).

Побочные реакции

Капли глазные Офтан® Тимолол обычно хорошо переносятся. Как и другие офтальмологические лекарственные препараты, применяемые местно, тимолол абсорбируется в системный кровоток. Это может вызвать подобные нежелательные воздействия, наблюдаются при использовании системных бета-блокаторов.

Частота возникновения системных побочных реакций после местного офтальмологического применения ниже, чем при системном применении.

К перечисленным побочным реакциям относятся реакции, наблюдаемые с классом офтальмологических бета-блокаторов.

Со стороны органа зрения

Редкие (от $\geq 1/1000$ до $<1/100$): снижение чувствительности роговицы, поверхностный пятнистый кератит.

Одиночные (от $\geq 1/10000$ до $<1/1000$): синдром сухого глаза, блефароконъюнктивит, нарушение зрения, диплопия (двоение в глазах), птоз (опущение века).

Редкие ($<1/10000$): кальцификация роговицы (в связи с использованием глазных капель, содержащих фосфаты, у некоторых пациентов со значительно пораженной роговой оболочке глаза).

Со стороны сердца

Редкие (от $\geq 1/1000$ до $<1/100$): брадикардия.

Одиночные (от $\geq 1/10000$ до $<1/1000$): сердечная недостаточность, аритмии.

Со стороны сосудов

Одиночные (от $\geq 1/10000$ до $<1/1000$): гипотензия, снижение периферической и церебральной перфузии крови.

Со стороны нервной системы

Часто ($\geq 1/100$ до $<1/10$): головная боль.

Одиночные (от $\geq 1/10000$ до $<1/1000$): головокружение.

Со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения

Редкие (от $\geq 1/1000$ до $<1/100$): одышка.

Одиночные (от $\geq 1/10000$ до $<1/1000$): бронхоспазм (особенно у пациентов с бронхоспастическими заболеваниями, такими как астма или сердечная недостаточность), заложенность носа.

Нарушения психики

Редкие (от $\geq 1/1000$ до $<1/100$): депрессия.

Одиночные (от $\geq 1/10000$ до $<1/1000$): беспокойство, ночные кошмары, спутанность (затмение) сознания.

Со стороны кожи и подкожной клетчатки:

Одиночные (от $\geq 1/10000$ до $<1/1000$): реакции гиперчувствительности: сыпь, крапивница, алопеция.

Общие нарушения и в месте введения

Редкие (от $\geq 1/1000$ до $<1/100$): утомляемость.

Одиночные (от $\geq 1/10000$ до $<1/1000$): астения (общая слабость).

Кроме указанного выше, описывалось, что бета-блокаторы, во время системного использования, которые закапывались в глаза, вызывают такие побочные реакции, которые могут возникать при применении капель глазных Офтан® Тимолол:

Со стороны иммунной системы

Системные аллергические реакции, включая ангионевротический отек, зуд, анафилактические реакции.

Со стороны обмена веществ и питания

Гипогликемия.

Нарушения психики

Бессонница, потеря памяти, галлюцинации.

Со стороны нервной системы

Потеря сознания, инсульт, ишемия головного мозга, увеличение признаков и симптомов миастении гравис, парестезии.

Со стороны органа зрения

Признаки и симптомы раздражения глаз (например, жжение, острую боль, зуд, слезотечение, покраснение), кератит, нечеткость зрения, отслойка хориона после фильтрующей операции (см. Раздел «Особенности применения»), эрозия роговицы.

Со стороны сердца

Боль в груди, учащенное сердцебиение, отек, застойная сердечная недостаточность, АВ блокада, остановка сердца.

Со стороны сосудов

Феномен Рейно.

Со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения

Кашель.

Со стороны желудочно-кишечного тракта

Дисгевзия (расстройство вкуса), тошнота, диспепсия (нарушение пищеварения), диарея, сухость во рту, боль в животе, рвота.

Со стороны кожи и подкожных тканей

Псориазоподобные высыпания или обострение псориаза.

Со стороны костно-мышечной и соединительной ткани

Миалгия (боль в мышцах).

Со стороны половых органов и молочной железы

Половая дисфункция, пониженное либидо.

Сообщение о подозреваемых побочных реакции

Сообщение о подозреваемых побочных реакции после регистрации лекарственного препарата важно. Это позволяет непрерывно контролировать соотношение польза / риск применения лекарственного средства. Врачей просят сообщать о любых подозреваемые побочные реакции.

Срок годности

3 года. Использовать в течение 28 дней после вскрытия флакона.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25 °С в оригинальной упаковке для защиты от света. Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 5 мл во флаконе с капельницей. По 1 флакону с капельницей в картонной коробке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

Сантен АО/Santen Oy.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Нииттихаанкату, 20 33720 Тампере, Финляндия /

Niittyhaankatu 20 33720 Tampere, Finland.

Источник инструкции

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