

Состав

действующее вещество: тимолол;

1 мл препарата содержит тимолола малеата в пересчете на тимолол 100% вещество 2,5 мг

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

Лекарственная форма

Капли глазные.

Основные физико-химические свойства: прозрачная бесцветная жидкость.

Фармакотерапевтическая группа

Средства, применяемые в офтальмологии. Противоглаукомные препараты и миотические средства. Блокаторы β -адренорецепторов.

Код АТХ S01E D01.

Фармакодинамика

Офтимол® - это неселективный β -блокатор (β_1 и β_2), который не имеет ВСА или мембраностабилизирующей активности, а также непосредственной угнетающего действия на миокард или местноанестезирующего активности.

Офтальмологическое применение тимолола малеата эффективно снижает нормальный и повышенное внутриглазное давление. Основываясь на результатах флюорометрии, тимолола малеат уменьшает образование внутриглазной жидкости, не влияя в значительной степени на отток жидкости. Клеточные механизмы снижения выработки внутриглазной жидкости в процессах, которые происходят в цилиарной теле глаза, пока не совсем понятны.

В отличие от лечения миотическими средствами, тимолол уменьшает внутриглазное давление, не влияя на аккомодацию или размер зрачков, или остроту зрения; следовательно, нечеткость или затуманивание зрения или ухудшение зрения при ярком свете не возникают. Кроме того, у пациентов с катарактой удается избежать нарушений зрения при суженной зрачки, вызванного помутнением хрусталика.

Фармакокинетика

Абсорбция

Действие препарата начинается через 20 минут после закапывания. Обычно снижение внутриглазного давления можно определить через 15-30 минут после закапывания. Максимальное снижение достигается в течение 1-5 часов. Снижение внутриглазного давления сохраняется в течение 24 часов после применения однократной дозы.

Распределение

Тимолол связывается с белками плазмы крови на 10-60% в зависимости от метода количественного определения.

Метаболизм

Около 80% тимолола метаболизируется в печени и превращается в неактивные метаболиты. Определено, что метаболизм тимолола главным образом связан с ферментами цитохрома P450 CYP2D6.

Вывод

Период полувыведения тимолола ($t_{1/2}$) составляет 3-4 часа и значительно не меняется у пациентов с умеренной почечной недостаточностью. Препарат в неизменном виде, а также его метаболиты выводятся с мочой.

Показания

Глазная гипертензия, хроническая открытоугольная глаукома и некоторые случаи вторичной глаукомы.

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к тимолола малеата (или к другим бета-блокаторов) или к вспомогательным веществам препарата.
- Реактивные заболевания органов дыхания, включая бронхиальную астму или бронхиальной астмой в анамнезе, тяжелые хронические обструктивные заболевания легких.
- Синусовая брадикардия, синдром слабости синусового узла, синоатриальная блокада сердца, блокада II или III степени, не контролируемая кардиостимулятором.
- Выраженная сердечная недостаточность, кардиогенный шок.
- Тяжелый аллергический ринит.

- Дистрофия роговицы.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

При одновременном применении β -блокаторов в виде глазных капель с пероральным приемом блокаторов кальциевых каналов, β -блокаторов, антиаритмических препаратов (включая амиодарон), сердечных гликозидов, алкалоидов раувольфии, парасимпатомиметики, гуанетидина проявляется аддитивный эффект в виде гипотензии и / или брадикардии.

Одновременное применение тимолола и адреналина (эпинефрина) может проявляться мидриазом.

Известно о потенцировании эффектов β -блокаторов (снижение частоты сердечных сокращений, депрессия) при комбинированном применении с ингибиторами CYP2D6 (хинидин, флуоксетин, пароксетин).

Тимолол может абсорбироваться на системном уровне и вызывать такие же взаимодействия, как и пероральные β -блокаторы:

Инсулин и пероральные противодиабетические препараты: β -блокаторы могут усилить гипогликемический эффект, а бета-адренергическая блокада может маскировать появление признаков гипогликемии (тахикардии).

Анестетики: ослабление рефлекторной тахикардии и повышенного риска развития артериальной гипотензии. Если пациенту назначено тимолол, анестезиолог должен быть проинформирован об этом.

Циметидин, гидралазин и алкоголь: могут вызвать повышение уровня тимолола в плазме крови.

Парасимпатомиметични гликозиды наперстянки: сочетание с бета-блокаторами может иметь аддитивные эффекты при продолжении времени AV-проводимости.

Оральные β -блокаторы могут усилить гипертензию, вызванную отменой клонидина.

Антагонисты кальция: характер побочных эффектов со стороны сердца зависит от вида блокаторов кальциевых каналов. Производные дигидропиридина (нифедипин) могут вызвать гипотонию, в то время как верапамил или дилтиазем могут стать причиной нарушения AV-проводимости, развития левожелудочковой недостаточности и негативно влиять на частоту сердечных сокращений.

Антиаритмические препараты I класса (например, дизопирамид, хинидин) и амиодарон: могут усиливать влияние на время AV-проводимости и иметь отрицательный инотропный эффект.

Надлежащего наблюдения требуют пациенты, которым назначают вместе с β -блокаторами препараты, высвобождают катехоламинов (например, резерпин) из-за возможного усиления эффектов в виде гипотензии и / или выраженной брадикардии, которые проявляются головокружением, обмороками или постуральной гипотензии.

Комбинированное пероральное применение антагонистов кальция и β -блокаторов допустимо при удовлетворительной функции сердца, однако такую комбинацию нужно избегать пациентам с пониженной сердечной функцией.

С осторожностью принимать блокаторы кальциевых каналов внутривенно пациентам, принимающим β -блокаторы.

Если местно применять более одного офтальмологический лекарственный препарат, необходимо соблюдать интервал не менее 5 минут между их закапыванием. Глазные мази следует применять в последнюю очередь.

Особенности применения

Как и другие офтальмологические средства, тимолола малеат может абсорбироваться в системный кровоток, в связи с чем могут наблюдаться негативные эффекты со стороны дыхательной, сердечно-сосудистой и других систем. Частота нежелательных реакций при офтальмологическом приеме значительно ниже, чем при системном введении.

Кардиальные нарушения. У пациентов с сердечно-сосудистой патологией (например, ишемическая болезнь сердца, стенокардия Принцметала, сердечная недостаточность) сопутствующую гипотензивную терапию β -блокаторами следует критически оценить и рассмотреть возможность использования других лекарственных средств. Пациенты с сердечно-сосудистой патологией должны отслеживать признаки ухудшения заболевания или побочные реакции при применении лекарственного средства.

В связи с негативным влиянием на проведение импульса, β -блокаторы следует с осторожностью назначать пациентам с AV (AB) блокадой I степени.

Необходим адекватный контроль сердечной недостаточности при применении тимолола таким пациентам. Пациентов с тяжелыми заболеваниями сердца должен наблюдать врач, особенно следить за прогрессом сердечной недостаточности и контролировать пульс.

Сосудистые нарушения. Пациентам с тяжелыми нарушениями / заболеваниями периферических сосудов (например, синдром Рейно или болезнь Рейно) следует с осторожностью принимать препарат.

Респираторные нарушения. Были сообщения о респираторные реакции, включая летальный исход, в связи с бронхоспазмом у пациентов с астмой после офтальмологического использования некоторых β -блокаторов. Офтимол® можно назначать с осторожностью пациентам с хроническим обструктивным заболеванием легких (ХОБЛ) легкой и средней степени тяжести, если польза от применения превышает потенциальный риск.

Гипогликемия / диабет. β -блокаторы с осторожностью назначают пациентам со случаями спонтанной гипогликемии или лабильным диабетом, поскольку эти симптомы могут маскировать симптомы острой гипогликемии.

Заболевания щитовидной железы. β -блокаторы могут маскировать симптомы гипертиреозидизм.

Заболевания роговицы. β -блокаторы могут вызвать сухость глаз. Пациентам с заболеваниями роговицы следует с осторожностью принимать данный препарат.

Для пациентов с закрытоугольной глаукомой первоочередная цель лечения заключается в повторном открытии угла. Это требует сужение зрачка миотическими средством. Поскольку тимолол не оказывает влияния на зрачок или оказывает незначительное влияние, когда он используется для снижения повышенного внутриглазного давления при закрытоугольной глаукоме, его следует применять вместе с миотическими средством, а не по отдельности.

Как и при любом другом лечении глаукомы, рекомендуется регулярный контроль внутриглазного давления и состояния роговицы.

Применение других β -блокаторов. Влияние на внутриглазное давление или известные системные эффекты могут усиливаться при применении Офтимолу® с другими β -блокаторами, например, если пациент принимает эти препараты системно в виде глазных капель. При использовании таких комбинаций необходимо тщательно наблюдать за пациентом. Не рекомендуется принимать два β -блокаторы одновременно.

Анафилактические реакции. Во время приема β -блокаторов пациенты с атопией или тяжелой анафилактической реакцией в анамнезе на различные аллергены могут сильнее реагировать на повторное введение таких аллергенов и не реагировать на обычные дозы адреналина, используемых при лечении анафилактических реакций.

Отслоение сетчатки. Были сообщения о отслойка сетчатки при применении с препаратами, угнетающими секрецию внутриглазной жидкости (например, тимолол и ацетазоламид) после хирургического лечения глаукомы.

Отслойка сосудистой оболочки. Сообщалось о отслойка сосудистой оболочки при применении терапии, подавляет выработку внутриглазной жидкости (например, тимолол, ацетазоламид) после трабекулотомия.

Общая анестезия. β -блокаторы для офтальмологического приема могут блокировать эффекты системных β -агонистов, например адреналина. Анестезиолог должен быть проинформирован о том, что пациент принимает тимолола малеат.

У некоторых пациентов во время анестезии после лечения системными бета-блокаторами наблюдалась выраженная длительная гипотензия. Перед плановой операцией лечение следует прекратить. Как и при применении системных бета-блокаторов, если необходимо прекратить терапию офтальмологическим тимололом у больных ишемической болезнью, следует делать это постепенно.

Слабость мышц. Сообщалось, что β -адреноблокаторы усиливают слабость мышц, связано с определенными симптомами миастении (например, диплопия, птоз и общая слабость).

Контактные линзы. Офтимол® содержит бензалкония хлорид, который может откладываться на мягких контактных линзах и обесцвечивать их, поэтому перед закапыванием лекарственного средства мягкие контактные линзы необходимо снять и надеть не ранее чем через 15 минут.

Предостережение относительно вспомогательных веществ. Это лекарственное средство содержит бензалкония хлорид, который может вызвать раздражение глаз, особенно у пациентов, страдающих синдромом сухого глаза или нарушения роговицы (прозрачной передней части глаза).

Предупреждение для спортсменов. Пациентов следует предупредить, что это лекарственное средство содержит тимолол, который может привести к положительные результаты допинг-теста.

Следует избегать одновременного применения ингибиторов MAO.

Некоторые пациенты сообщали об уменьшении реакции на этот препарат после длительной терапии.

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

Это лекарственное средство не влияет или незначительно влияет на способность управлять транспортным средством или использовать различные механизмы.

Временное помутнение зрения или другие зрительные расстройства, включая рефракционные изменения, диплопию, протоз, частые случаи легкой и временной нечеткости зрения и редко - головокружение или повышенная утомляемость могут повлиять на способность управлять транспортным средством или использовать различные механизмы. Если возникают данные побочные явления, пациент должен подождать, пока зрение не станет ясным, прежде чем управлять автомобилем или работать с механизмами.

Применение в период беременности или кормления грудью

Беременность

Из-за отсутствия достаточного опыта применения в период беременности тимолол можно применять только в том случае, когда ожидаемый терапевтический эффект для матери значительно превышает потенциальный риск для плода / ребенка.

Эпидемиологические исследования не выявили тератогенного влияния, но продемонстрировали задержку внутриутробного развития плода при применении β -блокаторов. Также были обнаружены эффекты β -блокаторов (брадикардия, гипотония, дыхательная недостаточность и гипогликемия) у новорожденных, матери которых принимали β -блокаторы до родов. Новорожденные, матери которых до родов принимали тимолол, должны находиться под тщательным наблюдением в течение первых дней жизни. Рекомендации по снижению системной абсорбции приведены в разделе «Способ применения и дозы».

Кормление грудью

Тимолола малеат был обнаружен в молоке человека после приема и офтальмологического введения. β -блокаторы проникают в грудное молоко и могут повлечь серьезные побочные эффекты у младенца, находящегося на грудном вскармливании.

После тщательной оценки соотношения польза / риск следует отменить кормления грудью или прекратить применение препарата Офтимол®, учитывая пользу от кормления грудью для ребенка и пользу от терапии для женщины.

Способ применения и дозы

Внимание! До начала применения колпачок флакона плотно НЕ закручивать! Перед первым применением его максимально затянуть. При этом шип, который находится на внутренней стороне колпачка, прокалывает отверстие. Непосредственно перед применением следует подержать флакон с препаратом в ладони, чтобы подогреть его до температуры тела. Колпачок отвинтить, снять и, слегка надавливая на корпус флакона, раствор закапать в глаза. После закапывания колпачок плотно закрутить и хранить препарат согласно рекомендациям, приведенным в инструкции. Глазные капли следует применять при максимальном соблюдении правил гигиены. Не касаться краем капельницы любой поверхности.

В случае замены другого β -блокатора для офтальмологического применения на тимолол следует прекратить применение другого средства и начать применять 1 каплю тимолола в пораженный глаз дважды в сутки со следующего дня. Если клинический ответ на лечение недостаточен, следует увеличить дозу до 1 капли лекарственного средства Офтимол® 5 мг / мл два раза в сутки (утром и вечером).

При переходе с одного антиглаукомных препарата, который не является β -блокаторами, на тимолол, в первый день следует продолжить предварительное лечение и добавить по 1 капле лекарственного средства Офтимол® в пораженный глаз два раза в сутки. На следующий день следует прекратить прием антиглаукомных препаратов, который использовался ранее, и продолжить применение тимолола. Если клинический ответ на лечение недостаточен, следует увеличить дозу до 1 капли лекарственного средства Офтимол® 5 мг / мл два раза в сутки (утром и вечером).

Если пациент одновременно применяет несколько антиглаукомных препаратов, подход к изменению схемы лечения должен быть индивидуальным. Рекомендуется ее пошаговая коррекция с интервалом не менее одной недели и каждый раз относительно только одного из препаратов.

Дозы

Взрослым по 1 капле 0,25% раствора тимолола (применять препарат тимолола в соответствующей концентрации) в пораженный глаз (глаза) дважды в сутки. Если результат неудовлетворительный, следует применять 0,5% раствор. Если внутриглазное давление не контролируется должным образом, можно начать сопутствующую терапию с применением миотических препаратов, эпинефрина, системных ингибиторов карбоангидразы. Если во время лечения наблюдается должное снижение внутриглазного давления, необходимо продолжать поддерживающее лечение, закапывая 1 каплю препарата в сутки.

Способ применения

Капли следует закапывать, оттянув нижнее веко вниз.

Флакон необходимо держать закрытым, когда пациент не пользуется препаратом.

Системная абсорбция снижается после носо-слезной окклюзии или закрывания век в течение 2-х минут. В итоге это может привести к уменьшению системных побочных эффектов и увеличения местной активности.

Дети

Безопасность и эффективность применения препарата Офтимол® детям не установлены.

Передозировка

Имеются сообщения о непреднамеренном передозировки тимолола, в результате которого наблюдались эффекты, подобные тем, которые наблюдаются при системном использовании β -блокаторов.

Наиболее распространенными симптомами передозировки являются головокружение, головная боль, гипотензия, одышка, брадикардия, бронхоспазм, сердечная недостаточность, остановка сердца.

Лечение: при приеме препарата внутрь, в случае когда прошло не более 1:00 с момента передозировки, провести промывание желудка или как альтернатива - прием активированного угля (50 г взрослому и 1 г / кг для детей).

При появлении брадикардии использовать атропин внутривенно 0,25 мг - 2 мг. Если брадикардия продолжается, использовать изопrenalин. При отсутствии эффекта - установление кардиостимулятора.

При гипотонии вводить допамин, добутамин или норадреналин. При неэффективности вводить глюкагон.

При развитии бронхоспазма: изопrenalин, дополнительная терапия аминофилином.

Острая сердечная недостаточность: согласно алгоритму оказания неотложной помощи (кислород, диуретики, сердечные гликозиды). В случае неэффективности - введение аминофиллина, глюкагона.

Блокада сердца: изопrenalин, установления водителя ритма.

Гемодиализ малоэффективен.

Побочные реакции

Глазные капли Офтимола®, как правило, хорошо переносятся пациентами.

Как и другие лекарственные средства, применяемые в офтальмологии, тимолола малеат всасывается в системный кровоток. Это может вызвать нежелательные эффекты, такие как и при системном использовании препарата. Частота возникновения побочных эффектов при офтальмологическом использовании тимолола малеата ниже, чем при системном введении препарата. Указанные побочные реакции включают реакции, наблюдаемые при офтальмологическом приеме препарата, их классифицированы следующим образом: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$ до $<1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$ до $<1/100$), редко ($\geq 1/10000$ до $<1/1000$), очень редко ($<1/10000$), неизвестно (нельзя оценить по имеющимся данным).

Со стороны иммунной системы

Редко отек лица.

Неизвестно: повышенная чувствительность, ангионевротический отек, системная красная волчанка, крапивница.

Со стороны питания и метаболизма

Неизвестно: гипогликемия.

Со стороны психики

Редко депрессия.

Неизвестно: бессонница, ночные кошмары, амнезия, галлюцинации.

Со стороны нервной системы

Нечасто: головная боль.

Редко ишемия головного мозга, головокружение, мигрень.

Неизвестно: инсульт, обмороки, парестезии.

Со стороны органов зрения

Часто затуманивание зрения, симптомы раздражения глаз (жжение, резь, зуд, покраснение), дискомфорт в глазах, боль в глазах, гиперемия глаза.

Нечасто: точечный кератит, ирит, блефарит, конъюнктивит, кератит, снижение остроты зрения, повышенное слезотечение, светобоязнь, выделения из глаз,

образование чешуек по краям век, воспаление передней камеры глаза, отек век, эрозии роговицы, сухость глаз, конъюнктивальная гиперемия.

Редко увеит, зуд век, экзема век, эритема век, отек конъюнктивы, пигментация роговицы, астигматизм, диплопия, заболевания роговицы.

Неизвестно: птоз, отслойка сетчатки после хирургического лечения глаукомы.

Со стороны сердца

Нечасто: брадикардия.

Редко: инфаркт миокарда.

Неизвестно: остановка сердца, АВ-блокада (полная, неполная или ухудшение протекания), застойная сердечная недостаточность (ухудшение протекания), аритмия, учащенное сердцебиение.

Со стороны сосудов

Нечасто гипотензия.

Редко: повышение артериального давления, периферические отеки, похолодание конечностей.

Неизвестно: перемежающаяся хромота, феномен Рейно.

Со стороны дыхательной системы

Нечасто астма, бронхит, одышка.

Редко хроническое обструктивное заболевание легких, бронхоспазм, преимущественно у пациентов с бронхиальной астмой, кашель, стридорозное дыхание, заложенность носа.

Неизвестно: дыхательная недостаточность.

Со стороны желудочно-кишечного тракта

Нечасто диспепсия.

Редко: неприятные ощущения в области живота, сухость слизистой оболочки рта (ксеростомия), диспепсия.

Неизвестно: тошнота, диарея, рвота.

Со стороны кожи

Редко покраснения.

Неизвестно: псориазоформные сыпь или обострение псориаза, выпадение волос, кожная сыпь.

Со стороны мышц и соединительной ткани

Неизвестно: артропатия.

Со стороны половой системы

Неизвестно: половая дисфункция (импотенция), болезнь Пейрони.

Общие нарушения и нарушения, возникающие в месте введения

Нечасто: повышенная утомляемость.

Неизвестно: астения, дискомфорт в области грудной клетки.

Описание отдельных побочных реакций

Очень редко сообщалось о случаях кальцификации роговицы в связи с использованием глазных капель, содержащих фосфаты, у некоторых пациентов со значительно пораженными роговицы.

Как и при применении других местных офтальмологических препаратов, тимолол абсорбируется в системный кровоток. Это может привести к таким же нежелательным явлениям, наблюдаемым при применении системных β -блокаторов. Частота возникновения системных побочных реакций после местного офтальмологического применения ниже, чем после системного применения. К перечисленным побочным реакциям относятся реакции, наблюдаемые в пределах класса офтальмологических бета-блокаторов. Дополнительные побочные реакции наблюдаются при применении офтальмологических бета-блокаторов и могут, вероятно, возникать при применении лекарственного средства

Офтимол®:

Со стороны крови и лимфатической системы: неспецифическая тромбоцитопеническая пурпура.

Со стороны иммунной системы: системные аллергические реакции, локальный и генерализованная сыпь, анафилактические реакции, зуд.

Со стороны психики: сонливость.

Со стороны нервной системы: усиление симптомов миастении.

Со стороны органа зрения: покалывание глаз, нечеткость зрения. Нарушение зрения, включая нарушения рефракции (в связи с отменой миотических средств), снижение чувствительности роговицы, отслойка сетчатки после хирургического лечения глаукомы.

Со стороны сердца: боль в грудной клетке, отеки, сердечная недостаточность.

Со стороны дыхательной системы: хрипы.

Со стороны желудочно-кишечного тракта: боли в животе.

Со стороны кожи: потливость, эксфолиативный дерматит.

Со стороны мышц и соединительной ткани: миалгия, артралгия.

Со стороны органов слуха: шум и звон в ушах (тинитус).

Со стороны половой системы: снижение либидо, затрудненное мочеиспускание.

Общие нарушения и нарушения, возникающие в месте введения: боль в конечностях, снижение толерантности к физической нагрузке.

Срок годности

3 года. После вскрытия флакона препарат годен 28 суток.

Не использовать после истечения 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 10 мл во флаконе, вложенном в пачку.

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](#).