

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1
Към РУ <u>11-1314</u> , <u>20.12.04</u>
Одобрено: <u>8/23.11.07</u>

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

ОФТАН ТИМОЛОЛ 2.5 мг/мл очни капки , разтвор /OFTAN TIMOLOL 2.5mg/ml eye-drops, solution

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Тимолол малеат 3.42 мг/мл еквивалент на тимолол 2.5 мг/мл

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Очни капки, разтвор.

Бистър, безцветен разтвор.

4. КЛИНИЧНИ ОСОБЕНОСТИ

4.1. Терапевтични показания

Откритоъгълна глаукома, намаляване на повишено вътреочно налягане, глаукома след операция за катаракта и вторична глаукома при някои пациенти. Препаратът може да бъде използван при лечението на закритоъгълна глаукома само заедно с миотици.

За употреба само по предписание на офталмолог или като продължение на терапия започната от такъв специалист.

4.2. Приложение и дозировка

Офтан Тимолол 2.5 мг/мл: една капка 1-2 пъти дневно в засегнатото око. Препоръчва се да се започне лечението с концентрация 2.5 мг/мл (една капка 1-2 пъти дневно).

Ако тази доза не е достатъчна, вместо нея може да се използва концентрация 5 мг/мл (една капка 1-2 пъти дневно).

Ефектът на понижаване на налягането може да се увеличи чрез комбиниране на Офтан Тимолол с друг вид антиглаукомно лекарство (миотици, адренергични агонисти или инхибитори на карбоанхидразата). Когато се преминава от друг антиглаукомен продукт към Офтан Тимолол, предишния продукт може да бъде спрян изведнъж и да се започне с Офтан Тимолол, както е описано по-горе.

4.3. Противопоказания

Некомпенсирана или остра сърдечна недостатъчност, някои сърдечни ритъмни нарушения, най-често - втора или трета степен AV блок и брадикардия.

Бронхиална астма, изразена склонност към бронхоспазм или хронична обструктивна белодробна болест.

Свръхчувствителност към тимолол малеат или бензалкониев хлорид.

4.4. Специални предупреждения и специални предпазни мерки при употреба

Преди започване на лечението, трябва да се прецени общия здравен статус на пациента (виж противопоказания). Тъй като отговора на бета-блокери може да се промени, препоръчително е вътреочното налягане на пациента да бъде измерено 2-4 седмици след началото на лечението. Също така, очния статус на пациента трябва да се преоценява



редовно, защото в някои случаи отговорът към тимолол малеат се променя при продължителна употреба.

Тимололът, както и другите бета-блокери, може да маскира симптомите на възможна хипогликемия свързана с лечението на захарен диабет. При пациенти с миастения гравис е описано влошаване на общото състояние при използване на очните капки тимолол.

Очните капки Офтан Тимолол съдържат бензалкониев хлорид като консервант, който може да преципитира в меките контактни лещи. Контактните лещи трябва да се свалят преди поставянето на препаратата. Трябва да се изчака поне 15 минути след прилагане на очните капки преди да се поставят отново контактните лещи.

Препаратата трябва да се прилага при новородени и малки деца само под контрола на педиатър-офтальмолог.

4.5. Лекарствени и други взаимодействия

Очните капки Офтан Тимолол могат да се използват заедно с други антиглаукомни лекарства. Пациентите, които паралелно получават системни алфа- или бета-блокери, калциеви антагонисти, резерпин, антиаритмични средства от група I (напр. квинидин) или клодинин, трябва да се изследват за възможно засилване на нежеланите ефекти. Съпътстващо лечение с барбитурати, аналгетици или ерго- алкалоиди може да засили нежеланите ефекти по отношение на централната нервна система.

Инхибитори от вида CYP2D6 като гвинидин и циметидин може да увеличат концентрацията на тимолол в плазмата.

4.6. Бременност и кърмене

Продуктът не се препоръчва за употреба по време на бременност и кърмене. Тимололът преминава през плацентата и се излъчва в кърмата. Продуктът трябва да се използва по време на бременност и кърмене само ако потенциалната полза за майката оправдава потенциалния риск за плода или кърмачето.

4.7. Повлияване на възможностите за шофиране и работа с машини

При правилно дозиране, Офтан Тимололът не предизвиква слабост или зрителни нарушения и поради това не повлиява способностите за управление на моторни превозни средства. Той, обаче, може да понижи кръвното налягане, което при някои пациенти води до отпадналост и замаяване. Пациентът трябва да бъде предупреден за това при започване на лечението.

4.8. Нежелани лекарствени реакции

Очните капките Офтан Тимолол се понасят добре. Описани са случаи на замъглено виждане. При продължителна употреба се съобщава за дисфункция на слъзната жлеза, точковиден кератит и леко намаляване на корнеалната чувствителност. Пациенти са получавали конюнктивити и блефарити. Обикновено тези симптоми изчезват при преустановяване на лечението. Следните симптоми са теоретично възможни при лечението с тимолол: зрителни нарушения, двойно виждане и птоза.

Системни нежелани ефекти: обостряне на сърдечна недостатъчност, промени в кръвното налягане и брадикардия, диспнея и бронхоспазми. Описани са също гастроинтестинални симптоми и въздействия върху централната нервна система, но ясна причинна връзка не е



установена. Съобщават се отделни случаи на главоболие, сухота в устата, гадене, замайване и хипертония, синкоп, алопеция и болест на Пейрони. Пациенти, свръчувствителни към тимолол малеат, могат да развият обрив или уртикария. Следните системни нежелани ефекти са теоретично възможни по време на лечението с тимолол: влошаване на периферното кръвообращение, астения и ефекти върху централната нервна система като депресия и объркване.

4.9. Предозиране

Дозата е една капка в засегнатото око 1-2 пъти дневно (сутрин и вечер). Предозирането трябва да се избягва. Цялото количество тимолол абсорбирано от една орално приета таблетка тимолол (10 mg) се равнява на количеството от около 60 очни капки Офтан Тимолол (2.5 mg/мл), но поради бързата абсорбция на медикамента през очната и носна лигавица, няколко капки могат да предизвикат аритмии, преходно намаляване на пулсовата честота, намаляване на кръвното налягане и бронхоспазм. Симптомите на предозиране се лекуват симптоматично с адренергични агонисти: напр. изопреналин, добутамин и евентуално допамин.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамични свойства

Лекарствената съставка на очните капки Офтан Тимолол е L-изомер на тимолола като малеатна сол. Тимолол малеатът е неселективен бета-адренергичен антагонист, който се използва за намаляване на кръвното и вътреочното налягане, и в лечението на ангина пекторис. L-тимололът има много силен афинитет към b-1 и b-2 рецепторите. Ефектът на намаляване на вътреочното налягане на Офтан Тимолола се дължи на намаляване на образуването на вътреочна течност. Локално приложен в окото продуктът достига до таргетните тъкани, по-точно – цилиарното тяло, където се образува вътреочната течност. Тимололът няма значимо въздействие върху оттока на вътреочната течност. Не е известно дали има въздействие върху кръвоносните съдове в предния очен сегмент, но с намаляване на вътреочното налягане е описано и подобряване на циркулацията в ретината. Подобно на много други бета-блокери, тимололът има продължителен пострецепторен ефект; адренергичните рецептори не могат да провеждат въздействието на агонисти и след освобождаването им от тимолола. Тимолол малеатът няма собствена симпатомиметична активност и значима мембрано стабилизираща активност. Офтан Тимололът не повлиява размера на зеницата и акомодацията. Офтан Тимололът е с доказана ефективност в лечението на откритоъгълната глаукома и окуларната хипертензия. Той може да бъде използван успешно при много форми на вторична глаукома. Офтан Тимололът се понася добре. Той не предизвиква лекарствена зависимост.

Вероятно поради малката доза, синдрома на отнемане, наблюдаван при системно прилаганите бета-блокери, не се наблюдава при спиране на лечението с Офтан Тимолол.

АТС код: S01ED01

5.2. Фармакокинетични свойства

Тимололът е мастно разтворима субстанция и затова е с добра резорбция в окото. През конюнктивата и назалната лигавица, както и през стомашно чревния тракт, медикаментът преминава в системното кръвообращение. Намаляването на вътреочното налягане се дължи



на локалното действие. Максималният ефект в окото се получава на 3-4 час след приложението му, а действието продължава до 24 часа.

В окото тимололът се свързва с повърхността на клетките в много тъкани и най-вече с пигментните клетки на ендотела на ириса и цилиарния израстък. Той се елиминира от окото чрез оттока на вътреочната течност. Установеното време на полуелиминиране от очните тъкани е 8 часа.

Тимололът се метаболизира в черния дроб до неактивни метаболити, които се излъчват основно през бъбреците. След орален прием метаболизмът при първото преминаване през черния дроб е значителен, до 50%. Свързването със серумните протеини е умерено (60%). Обемът на разпределение е средно над 2 л/кг и субстанцията преминава кръвно-мозъчната бариера. Известното време на полуелиминиране от плазмата е около 4 часа.

5.3. Предклинични данни за безопасност

В токсикологични проучвания ЛД-50 при еднократно перорално дозиране при мишки е около 1.4 г/кг, което е повече от 16 000 пъти по-голяма от дневната доза, която човек получава при лечение с очните капки Офтан Тимолол. Високи концентрации (15 мг/мл) тимолол са поставяни локално в продължение на 3-12 месеца при зайци и кучета. Единствените наблюдавани симптоми при тези проучвания са били засилено съзхоотделяне, мигане и конюнктивална хемоза, които намаляват скоро след приложението. Проучвания, проведени върху зайци, показват, че тимололът може да забави процесите на оздравяване при корнеални лезии. Тимололът е слабо канцерогенен при много големи дози (над 100 мг/кг/ден). Рискът от феохромоцитомата и аденокарцином на млечната жлеза у плъхове се увеличава статистически значимо при доза 300–400 мг/кг/ден. При хора препоръчаната максимална дневна перорална доза е около 1мг/кг. Една очна капка Офтан Тимолол 0.25% съдържа около 0.1 мг тимолол. Не са установени мутагенни или тератогенни свойства на тимолола дори при големи дози. Все пак той може да забави развитието на плода.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ОСОБЕНОСТИ

6.1. Екципиенти

Benzalkonium chloride 0.1 mg, sodium dihydrogen phosphate dihydrate, disodium phosphate dodecahydrate, sodium hydroxide (to pH 6.5-7.0), water for injections.

6.2. Несъвместимости

Не са известни.

6.3. Срок на годност

3 години. Срокът на годност на отворения флакон е 1 месец.

6.4. Специални изисквания за съхранение

При стайна температура (15-25°C).

6.5. Лекарствена форма и опаковка

Полиетиленови флакони с гутатор (5 мл.)

6.6 Инструкции за използване и употреба

Подробни инструкции за използване са дадени в листовката.



7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Santen Oy
Niittyhaankatu 20
33720 Tampere
FINLAND

8. РЕГИСТРАЦИОНЕН НОМЕР

469

9. ДАТА НА РАЗРЕШЕНИЕ ЗА УПОТРЕБА/ ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

30 юли 1985

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗАЦИЯ НА ТЕКСТА

4 ноември, 1999

