Ганфорт



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Биматопрост
- Тимолол

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[мнн] [мнн] Википедия[мнн] [мнн] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru

Форма выпуска:

Капли глазные	**1 мл**	**1 фл.**
биматопрост	300 мкг	900 мкг
тимолол	5 мг	15 мг

3 мл - флакон-капельницы полиэтиленовые (1) - пачки картонные.
3 мл - флакон-капельницы полиэтиленовые (3) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Ганфорт - комбинированный лекарственный препарат, входящие в его состав биматопрост и тимолол снижают внутриглазное давление (ВГД) за счет сочетанного взаимодействия, приводя к значительно более выраженному гипотензивному эффекту по сравнению с эффектом каждого из компонентов в отдельности.

Биматопрост относится к синтетическим простамидам, по химической структуре сходен с простагландином F2a (PGF2a). Биматопрост не оказывает влияния ни на один из известных типов рецепторов простагландина. Гипотензивное действие биматопроста осуществляется за счет усиления оттока внутриглазной жидкости через трабекулу и по увеосклеральному пути глаза.

Тимолол - неселективный бета-адреноблокатор, не обладает внутренней симпатомиметической и мембраностабилизирующей активностью.

Тимолол снижает ВГД за счет уменьшения образования внутриглазной жидкости. Точный механизм действия не установлен, возможно, он связан с угнетением синтеза циклического аденозинмонофосфата (ц-АМФ) и вызывается эндогенной стимуляцией бета-адренергических рецепторов.

Фармакокинетика

Ганфорт

Системная абсорбция препарата минимальна, не отличается как при комбинированном лечении, так и при инсталляции каждого из компонентов препарата в отдельности.

В двух исследованиях продолжительностью 12 месяцев не отмечено системной кумуляции ни одного из действующих веществ.

Биматопрост

В исследованиях in vitro показано, что биматопрост проникает в радужную оболочку глаза и склеру. При инсталляции 0,03% раствора биматопроста по 1 капле в оба глаза один раз в сутки в течение 2 недель C_{max} биматопроста в плазме крови достигается в течение 10 минут после применения, и в течение 1,5 ч его концентрация в плазме крови снижается до нижнего предела определения (0,025 нг/мл). Средние значения C_{max} и площади под кривой «концентрация-время» ($AUC_{0-24\ ч}$) биматопроста были близки на 7 и 14 день применения, и составляли 0,08 нг/мл и 0,09 нг×ч/мл соответственно, указывая на то, что равновесная концентрация биматопроста достигается в течение первой недели применения.

Биматопрост умеренно распределяется в тканях, и системный объем распределения при достижении равновесной концентрации препарата составляет 0,67 л/кг. Биматопрост находится преимущественно в плазме крови. Связь биматопроста с белками плазмы крови составляет приблизительно 88%. Биматопрост подвергается окислению, N-деэтилированию и глюкуронированию с образованием различных метаболитов.

Биматопрост выводится преимущественно почками. Около 67% препарата, введенного внутривенно здоровым добровольцам, выводилось с мочой, а 25% - через желудочно-кишечный тракт (ЖКТ). $T_{1/2}$ биматопроста, определенный после его внутривенного введения, составил приблизительно 45 минут; а общий клиренс - 1,5 л/ч/кг.

У пожилых больных:

При применении биматопроста 2 раза в день среднее значение $AUC_{0-24\ ч}$ у пожилых больных составляет 0.0634 нг×ч/мл, что существенно превышает значение данного показателя у здоровых молодых лиц - 0.0218 нг×ч/мл.

Тем не менее, клинической значимости данное отличие не имеет, поскольку системная экспозиция биматопроста при его местном применении у пожилых больных и здоровых молодых лиц остается очень низкой. Кумуляции биматопроста в системной циркуляции не наблюдается, профиль безопасности не отличается у пожилых больных и лиц молодого возраста.

Тимолол

У больных, которым проводилось хирургическое лечение катаракты, после инстилляции глазных капель в виде 0,5% раствора, C_{max} тимолола во внутриглазной жидкости через 1 ч составила 898 нг/мл. Некоторое количество препарата попадает в системный кровоток, и подвергается метаболизму в печени. $T_{1/2}$ тимолола составляет около 4-6 ч. Часть тимолола, подвергшегося метаболизму в печени, выводится через желудочно-кишечный тракт, а другая его часть и метаболиты выводятся почками. Тимолол в незначительной степени связывается с белками плазмы крови.

Показания к применению:

— снижение внутриглазного давления (ВГД) у больных с открытоугольной глаукомой и внутриглазной гипертензией при недостаточной эффективности местного применения препаратов группы бета-адреноблокаторов и аналогов простагландина.

Относится к болезням:

- Гипертензия
- Глаукома

Противопоказания:

— повышенная чувствительность к компонентам препарата;

— синдром повышенной реактивности дыхательных путей, включая бронхиальную астму в стадии обострения и перенесенные эпизоды в анамнезе, тяжелая хроническая обструктивная болезнь легких (ХОБЛ);

— синусовая брадикардия, атриовентрикулярная блокада II и III степени, клинически выраженная сердечная недостаточность, кардиогенный шок;

— возраст до 18 лет;

— беременность, период кормления грудью.

С осторожностью: нарушения функции печени и почек (препарат недостаточно изучен у данной категории пациентов). У больных с факторами риска возникновения отека макулы (например, при афакии, псевдофакии, разрыве хрусталика).

У пациентов с сахарным диабетом (нестабильного течения) и нарушением толерантности к глюкозе, поскольку входящий в состав препарата Ганфорт бета-адреноблокатор тимолол может маскировать признаки гипогликемии. У больных с воспалительными изменениями глаз, неоваскулярной, воспалительной, закрытоугольной глаукомой, врожденной глаукомой или узкоугольной глаукомой (нет данных по изучению эффективности и безопасности).

Способ применения и дозы:

Рекомендуемые дозы у взрослых (включая больных пожилого возраста): 1 капля закапывается в конъюнктивальный мешок пораженного глаза 1 раз в сутки утром.

Если введение препарата пропущено однократно, препарат вводится на следующий день. Не рекомендуется превышать дозу - 1 введение 1 раз в сутки. Если используют более 2 препаратов, необходимо делать 5-ти минутный перерыв между каждой инсталляцией.

Побочное действие:

Частота побочных эффектов, выявленных в ходе исследований, оценивалась следующим образом: очень часто (>1/10), часто (>1/100, <1/10); нечасто (>1/1000, <1/100).

В клинических исследованиях препарата Ганфорт выявлены следующие побочные эффекты:

Со стороны центральной нервной системы: нечасто - головная боль;

Со стороны органа зрения: очень часто - гиперемия конъюнктивы, рост ресниц; часто — поверхностный кератит, эрозия роговицы, ощущение жжения, зуд, жгучая боль в глазах, ощущение инородного тела, сухость слизистой оболочки глаз, покраснение век, боль в глазах, фотофобия, выделения из глаз, нарушение зрения, зуд кожи век; нечасто - иридоциклит, раздражение слизистой оболочки глаз, отек конъюнктивы, блефарит, эпифора, отечность век, болезненность век, снижение остроты зрения, астенопия, трихиаз; частота неизвестна: кистоидный макулярный отек.

Со стороны дыхательной системы: нечасто - ринит;

Со стороны кожи и подкожно-жировой клетчатки: часто — пигментация кожи век; нечасто - гирсутизм.

Другие побочные эффекты, которые наблюдались при применении одного из компонентов препарата и потенциально возможные в период лечения препаратом Ганфорт:

Биматопрост

Со стороны сердечно-сосудистой системы: повышение артериального давления.

Общие нарушения и изменения в месте введения: астения, периферические отеки.

Со стороны органа зрения: аллергический конъюнктивит, катаракта, потемнение ресниц, усиление пигментации радужной оболочки, блефароспазм, ретракция век, кровоизлияние в сетчатку глаза, увеит.

Лабораторные показатели: изменения активности ферментов печени.

Тимолол

Психические нарушения: бессонница, кошмарные сновидения, снижение либидо.

Со стороны центральной нервной системы: миастения gravis, парестезия, ишемия головного мозга.

Со стороны органа зрения: снижение чувствительности роговицы, диплопия, птоз, отслойка сетчатки (после оперативного лечения), изменение рефракции (вследствие отмены терапии миотическими средствами в отдельных случаях), кератит.

Со стороны органа слуха и вестибулярного аппарата: шум в ушах.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: блокада сердца, остановка сердца, нарушения ритма сердца, потеря сознания, брадикардия, сердечная недостаточность, застойная сердечная недостаточность; снижение артериального давления, боль в грудной клетке, нарушение мозгового кровообращения, перемежающая хромота, синдром Рейно, похолодание конечностей, сердцебиение.

Со стороны дыхательной системы: бронхоспазм (в основном у лиц с эпизодами бронхоспазма в анамнезе), одышка, кашель.

Со стороны желудочно-кишечного тракта: тошнота, диарея, диспепсия, сухость слизистой оболочки полости рта.

Со стороны кожи и подкожно-жировой клетчатки: алопеция, псориазоподобные высыпания, обострение псориаза.

Со стороны опорно-двигательного аппарата и соединительной ткани: системная красная волчанка.

Со стороны мочевыделительной системы: болезнь Пейрони.

Другие: отеки, боль в грудной клетке, утомляемость.

Передозировка:

О случаях передозировки препарата Ганфорт не сообщалось; при введении в виде глазных капель передозировка маловероятна.

Биматопрост

При непреднамеренном приеме препарата Ганфорт внутрь может быть полезна следующая информация: не отмечено симптомов токсического воздействия биматопроста в дозах до 100 мг/кг/сут. в ходе 2-недельного перорального введения в эксперименте на крысах и мышах. Применяемая в исследовании доза, выраженная в мг/м, превышает в 70 раз возможную дозу биматопроста при случайном приеме внутрь содержимого флакона препарата Ганфорт ребенком с массой тела 10 кг.

Тимолол

При передозировке тимолола могут наблюдаться следующие симптомы: брадикардия, снижение артериального давления, бронхоспазм, головная боль, головокружение, одышка, остановка сердца. В исследованиях показано, что тимолол полностью не выводится при гемодиализе. Если передозировка происходит, необходимо проведение симптоматической терапии.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказано при беременности и лактации.

Особые указания и меры предосторожности:

Так же, как и другие офтальмологические лекарственные препараты, Ганфорт может проникать в системный кровоток.

Симптомы сердечной недостаточности должны быть компенсированы до начала применения препарата Ганфорт. Необходим регулярный контроль состояния больных с тяжелой сердечной недостаточностью, определение частоты сердечных сокращений. При применении тимолола имелись сообщения о побочных эффектах со стороны сердечно-сосудистой системы и органов дыхания, включая смертельные исходы вследствие бронхоспазма у больных бронхиальной астмой, а также реже — от сердечной недостаточности.

Бста-адреноблокаторы могут маскировать симптомы гипогликемии, гипертиреоза и вызывать ухудшение течения стенокардии Принцметала, тяжелых периферических и центральных сосудистых нарушений, а также артериальной гипотензии.
У больных с атопическими проявлениями в анамнезе и тяжелыми анафилактическими реакциями на различные аллергены дозы эпинефрина (адреналина), которые обычно используются для купирования анафилактических реакций, на фоне применения бета-адреноблокаторов могут быть неэффективны. У больных с заболеванием печени легкого течения или исходно повышенной активностью ферментов печени аланинаминотрансферазы (АЛТ), аспартатаминотрансферазы (АСТ) и/или общего билирубина, биматопрост не оказывал влияния на функцию печени в течение периода изучения 4 ч продолжительностью более 24 месяцев.

До начала лечения пациентов необходимо информировать о возможном росте ресниц, усилении пигментации кожи век и пигментации радужной оболочки глаз, поскольку эти побочные эффекты установлены в ходе исследований

биматопроста и препарата Ганфорт. Некоторые изменения могут оказаться постоянными, и могут сопровождаться возникновением различий между глазами, если инсталляции препарата проводили только в один глаз. После отмены препарата Ганфорт пигментация радужной оболочки может остаться постоянной. Через 12 месяцев лечения препаратом Ганфорт частота пигментации радужной оболочки отмечена у 0,2% больных. А через 12 месяцев лечения только биматопростом в виде глазных капель 1,5%, дальнейшего увеличения частоты данного эффекта не наблюдалось в течение терапии продолжительностью 3 года. Усиление пигментации радужной оболочки глаза обусловлено усилением продукции меланоцитов, а не просто увеличением их количества.

Вспомогательное вещество бензалкония хлорид, входящий в состав препарата Ганфорт, может вызвать раздражение слизистой оболочки глаз и изменение цвета мягких контактных линз. Контактные линзы необходимо снять до введения препарата, одеть их можно через 15 минут после инстилляции. Бензалкония хлорид может вызвать острый кератит и/или токсическую язву роговицы. В связи с этим необходимо наблюдение за состоянием пациента при частом или продолжительном лечении препаратом Ганфорт у лиц с синдромом «сухого» глаза и при изменениях роговицы.

После вскрытия флакона нельзя исключить возможность микробной контаминации его содержимого, что может привести к воспалительным поражениям глаз. Срок годности препарата после первого вскрытия флакона составляет 28 суток. После истечения указанного времени флакон следует выбросить, даже если раствор полностью не использован.

Рекомендуется записывать на картонной пачке лекарственного препарата дату вскрытия флакона.

Влияние на способность управления транспортными средствами и механизмами

Возможно преходящее ухудшение зрения после введения препарата, поэтому больной должен подождать до полного восстановления зрения, прежде чем приступить к вождению автомобиля или управлению механизмами.

При нарушениях функции почек

С осторожностью при нарушениях функции почек.

При нарушениях функции печени

С осторожностью при нарушениях функции печени.

Применение в детском возрасте

Противопоказан детям до 18 лет.

Условия хранения:

При температуре не выше 25°С. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Ganfort