

## **Состав**

*действующее вещество:* dorzolamide;

1 мл 20 мг дорзоламидом в виде дорзоламидом гидрохлорида;

*вспомогательные вещества:* маннит (Е 421) гидроксипропилцеллюлоза; натрия, дигидрат; натрия гидроксид бензалкония хлорид, раствор 50%; вода для инъекций.

## **Лекарственная форма**

Капли глазные, раствор.

*Основные физико-химические свойства:* прозрачная, бесцветная, несколько вязкая жидкость.

## **Фармакотерапевтическая группа**

Противоуглаукомные средства для местного применения. Ингибиторы карбоангидразы. Дорзоламид. Код АТХ S01E C03.

## **Фармакодинамика**

Дорзоламид - ингибитор карбоангидразы для местного применения в виде глазных капель. Карбоангидраза - фермент, имеющийся во многих тканях организма (в том числе в тканях глаза), который участвует в процессе гидратации диоксида углерода и дегидратации угольной кислоты. У человека этот фермент представлен различными изоферментами, самым активным из которых является карбоангидразой II, в первую очередь обнаружена в эритроцитах, а затем и в клетках других тканей. Ингибирование карбоангидразы цилиарного тела глаза приводит к снижению секреции внутриглазной жидкости (преимущественно за счет уменьшения образования ионов бикарбоната с последующим снижением транспорта ионов натрия и жидкости).

После местного применения препарат снижает внутриглазное давление независимо от того, связано с его повышение с глаукомой.

Дорзоламид снижает внутриглазное давление без развития характерных для миотических средств побочных эффектов, таких как ночная слепота, спазм аккомодации, сужение зрачка.

## **Фармакокинетика**

При местном применении в виде 2% офтальмологического раствора дорзоламид снижает повышенное внутриглазное давление, которое является главным фактором риска в патогенезе повреждения зрительного нерва и глаукоматозного ухудшение зрительных функций (выпадение полей зрения).

При пероральном применении эффект дорзоламидом наступает через 60-90 минут и продолжается в течение 8-12 часов. Дорзоламид переходит в системный кровоток. В случае постоянного перорального применения дорзоламид накапливается в эритроцитах с помощью селективного связывания с карбоангидразы II типа. В плазме сохраняются очень низкие концентрации данного лекарственного средства в свободном виде.

Дорзоламид метаболизируется в N-дезеил-дорзоламид, который менее выражено ингибирует карбоангидразы II, но в то же время ингибирует и менее активный изофермент - карбоангидразы I. Данный метаболит накапливается в красных тельцах, где в основном связывается с карбоангидразы I.

Дорзоламид умеренно связывается с белками плазмы (около 33%). Выводится с мочой как в неизменном виде (80%), так и в виде метаболитов (20%). Высвобождение из эритроцитов следует из нелинейной кинетики, что приводит к первичному быстрого снижения концентрации, за которым следует этап очень медленного вывода со средним периодом полувыведения 4 месяца. В состоянии равновесия почечный клиренс составляет примерно 1,3 мг в сутки при дозе в 4 мг при почечного клиренса 90 мл / мин.

При пероральном применении дорзоламидом для моделирования максимального системного эффекта при его длительного местного применения равномерная концентрация достигается через 13 недель. В состоянии равновесия в плазме крови не было обнаружено лекарственного средства в свободной форме или в виде метаболитов. Степень ингибирования карбоангидразы в эритроцитах был ниже необходимого для получения фармакологического эффекта на дыхательную систему или функцию почек.

У пожилых пациентов с почечной недостаточностью (клиренс креатинина 30-60 мл / мин) были обнаружены более высокие концентрации метаболита в эритроцитах, но ни одной значительной различия по ингибирования карбоангидразы и ни одного значительного клинического побочного эффекта не наблюдали.

В отличие от перорального применения, офтальмологическое применение позволяет получить локальный эффект при более низких дозах.

При интраконъюнктивальном применении энзимная деятельность карбоангидразы ингибируется в эндотелиальных клетках роговицы, цилиарной теле, линзовидных эпителиальных клетках и роговице в течение 1-8 часов после применения. В роговице и линзовидных эпителиальных клетках энзимная деятельность ингибируется даже через 10 часов после закапывания.

Дорзоламид быстро распространяется в тканях глаза. Заметные концентрации дорзоламидом появляются в кровотоке в течение 15 минут после закапывания (в роговице, слезной жидкости, радужной оболочке глаза, цилиарной теле) и достигают максимального уровня примерно через 1 час после применения.

## **Показания**

Лечение повышенного глазного давления у больных с:

- глазной гипертензией;
- открытоугольной глаукомой;
- псевдоэксфолиативным глаукомой;
- как дополнительная терапия при лечении бета-блокаторами или в качестве монотерапии, когда лечение бета-блокаторами не было успешным или бета-блокаторы противопоказаны.

## **Противопоказания**

Повышенная чувствительность к дорзоламидом или к любому из компонентов препарата.

Тяжелая почечная недостаточность (клиренс креатинина менее 30 мл / мин).

Гиперхлоремический ацидоз.

## **Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий**

Специальных исследований взаимодействия дорзоламидом с другими средствами не проводилось.

В клинических исследованиях дорзоламид применяли одновременно с тимололом и бетаксололом в форме глазных капель, с препаратами системного действия ингибиторами АПФ (АПФ), блокаторы кальциевых каналов, диуретики и нестероидными противовоспалительными средствами (НПВС), в том числе ацетилсалициловой кислотой, а также с гормональными средствами (например, эстрогенами, инсулином, тироксином), не сопровождалось развитием

лекарственных взаимодействий.

Взаимодействие дорзоламидом с миотиками и адреномиметиками при лечении глаукомы изучена недостаточно.

### **Особенности применения**

Особенности применения препарата Дорзоптик пациентам со значительным нарушением функции печени не определены (следует применять с осторожностью).

При лечении пациентов с острой закрытоугольной глаукомой необходимо кроме применения препаратов, снижающих внутриглазное давление, принимать также других терапевтических мероприятий. Применение дорзоламидом пациентам с острой закрытоугольной глаукомой не исследовался.

Дорзоламид содержит сульфонамидный группу и, хотя применяется местно, подвергается системной абсорбции. В связи с этим при его применении в виде глазных капель могут возникнуть побочные реакции, характерные для сульфаниламидов, в том числе синдром Стивенса-Джонсона и токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла). В случае возникновения серьезных побочных реакций или при появлении признаков гиперчувствительности применение препарата следует прекратить.

Применение пероральных форм ингибиторов карбоангидразы связывают с появлением камней в мочевых путях вследствие водно-электролитных нарушений, в частности у пациентов с почечнокаменной болезнью в анамнезе. Хотя в случае применения дорзоламидом не отмечено появление водно-электролитных нарушений, однако были зафиксированы редкие случаи уретеролитиаза. Поскольку дорзоламид - это ингибитор карбоангидразы местного действия, который попадает в общий кровообращения, пациенты с почечнокаменной болезнью в анамнезе относятся к группе повышенного риска развития уретеролитиаза в связи с применением дорзоламидом.

У пациентов, принимающих пероральные ингибиторы карбоангидразы и дорзоламид, существует потенциальный риск аддитивной системного действия этих препаратов. Не рекомендуется одновременное применение дорзоламидом и пероральных ингибиторов карбоангидразы.

При появлении аллергических реакций (например, конъюнктивит и реакции со стороны век) применение препарата следует прекратить и обратиться к врачу.

При применении дорзоламидом сообщалось о отек роговицы и необратимую декомпенсации роговицы у пациентов с уже существующими хроническими

недостатками роговицы и / или внутриглазным оперативным вмешательством в анамнезе. Существует высокая вероятность возникновения отека роговицы у пациентов с малым количеством эндотелиальных клеток. Следует принять меры предосторожности при назначении дорзоламидом таким пациентам.

Во время приема средств, тормозящих выработку водянистой жидкости после фильтрационных мероприятий, наблюдались случаи отслоения сосудистой оболочки.

Препарат Дорзоптик содержит консервант (бензалкония хлорид), который может вызвать раздражение. Необходимо избегать контакта с мягкими контактными линзами (снять контактные линзы перед применением препарата и снова их установить через 15 минут после применения препарата). Обесцвечивает мягкие контактные линзы.

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

Никакие исследования влияния препарата на способность управлять транспортным средством или работать с механизмами не проводились. Возможные побочные реакции, такие как головокружение и нечеткость зрения, поэтому в период лечения следует избегать потенциально опасных видов деятельности, связанных с необходимостью концентрации внимания и повышенной скорости психомоторных реакций, особенно в начале лечения.

### **Применение в период беременности или кормления грудью**

Клинические испытания безопасности применения дорзоламидом в период беременности не проводились, поэтому применять препарат в этот период не рекомендуется.

Неизвестно, выделяется дорзоламид в грудное молоко, поэтому его не следует применять в период кормления грудью.

### **Способ применения и дозы**

При монотерапии назначают по 1 капле в пораженный глаз 3 раза в сутки.

В комбинации с бета-адреноблокаторами для местного применения назначают по 1 капле в пораженный глаз 2 раза в сутки.

Если при лечении применяется несколько местных офтальмологических средств, введение препаратов нужно осуществлять с интервалом в 10 минут. Если

переходят по лечению другими офтальмологическими препаратами на применение Дорзоптика, этот препарат отменяется после обычного ежедневного дозирования и на следующий день начинают лечения Дорзоптик.

Больного следует предупредить, что нужно вымыть руки перед применением и не касаться пипеткой глаза и окружающих поверхностей.

Больных также необходимо проинформировать, что при неправильном обращении с глазными каплями эти растворы могут быть контаминированные бактериями, которые вызывают инфекцию глаз. При применении контаминированного раствора возможны тяжелые повреждения с последующей потерей зрения.

#### Инструкция по применению:

1. Перед применением препарата следует тщательно вымыть руки.
2. Открутить колпачок, который находится на бутылочке.
3. Необходимо наклонить голову назад и оттянуть нижнее веко, для того чтобы сформировать пространство между веком и глазным яблоком.
4. Следует перевернуть бутылочку вверх дном, слегка нажать указательным и большим пальцем на стенки и выдавить 1 каплю в конъюнктивальный мешок. Не следует касаться наконечником капельницы поверхности глаза или окружающих тканей. Если капля не попала в конъюнктивальный мешок, необходимо закапать еще одну каплю.
5. Если врач назначил применения лекарственного средства в конъюнктивальный мешок другого глаза, необходимо повторить пункт 3-4.
6. Наконечник дозатора спроектирован таким образом, чтобы точно дозировать 1 каплю, поэтому не следует увеличивать отверстие в дозатор.
7. После закапывания необходимо закрутить крышечку флакона, однако не следует слишком плотно закручивать.

#### **Дети**

Не применяют.

#### **Передозировка**

Существуют ограниченные данные о передозировке у людей при случайном или преднамеренном проглатывании дорзоламидом гидрохлорида.

## *Симптомы*

Сообщалось о сонливости после перорального приема. При местном применении зафиксировано тошноту, головокружение, головная боль, слабость, необычные сновидения и дисфагию (затрудненное глотание).

## *Лечение*

Лечение симптоматическое и поддерживающее. Не исключено нарушение электролитного баланса, развитие ацидоза, возможны нарушения со стороны центральной нервной системы. Следует контролировать уровень электролитов в сыворотке крови (особенно калия) и показателей pH крови.

## **Побочные реакции**

*Со стороны нервной системы:* головная боль, головокружение, парестезии.

*Со стороны сердечно-сосудистой системы:* palpitation.

*Со стороны органа зрения:* пощипывание и жжение, поверхностный крапчатый кератит, слезотечение, конъюнктивит, воспаление век, зуд глаз, раздражение век, помутнение зрения, блефарит, иридоциклит, раздражение и покраснение, боль, шелушение век, временная близорукость (которая исчезает после прекращения лечения), отек роговой оболочки, гипотония глаза, увеит после фильтрационной операции.

*Частота неизвестна:* ощущение инородного тела в глазах.

*Со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения:* носовое кровотечение, синусит, ринит.

*Частота неизвестна:* одышка.

*Со стороны пищеварительной системы:* тошнота, горький привкус во рту, раздражение горла, сухость во рту.

*Со стороны кожи и подкожных тканей:* контактный дерматит, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз.

*Со стороны почек и мочевыделительной системы:* уролитиаз.

*Общие нарушения и реакции в месте применения:* астения / усталость, симптомы повышенной чувствительности: локально-Пальпебральная реакция, системно-ангионевротический отек, крапивница, зуд, сыпь, анафилаксия, редко - бронхоспазм.

*Результаты лабораторных тестов:* применение дорзоламидом не было связано с клинически значимыми нарушениями уровня электролитов.

### **Срок годности**

2 года. Не применять после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Срок годности после вскрытия - 4 недели.

### **Условия хранения**

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 ° С.

Хранить в недоступном для детей месте.

### **Упаковка**

5 мл препарата в полиэтиленовом флаконе-капельнице емкостью 5 мл с крышкой с гарантийным кольцом. По 1 флакону в картонной коробке.

### **Категория отпуска**

По рецепту.

### **Производитель**

Варшавский фармацевтический завод Польфа АО.

### **Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности**

ул. Каролькова 22/24, 01-207 Варшава, Польша.

### **Источник инструкции**

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