

Состав

действующее вещество: дорзоламид в форме дорзоламида гидрохлорида и тимолол в форме тимолола малеата;

1 мл дорзоламидом 20 мг в форме дорзоламидом гидрохлорида 22,26 мг и тимолола 5 мг в форме тимолола малеата 6,83 мг;

вспомогательные вещества: маннит (Е 421), натрия, гидроксипропилцеллюлоза, бензалкония хлорид, натрия гидроксид, вода для инъекций.

Лекарственная форма

Капли глазные, раствор.

Основные физико-химические свойства: слегка опалесцирующая, почти бесцветный, едва вязкий раствор. Цветность: не превышать эталон В9.

Опалесценция: не превышать эталонную суспензию И.

Фармакотерапевтическая группа

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

Код АТХ S01E D51.

Фармакодинамика

В состав препарата входят два действующих вещества: дорзоламида гидрохлорид и тимолола малеат. Каждый из этих компонентов снижает повышенное внутриглазное давление путем снижения секреции внутриглазной жидкости, но при различным механизмом действия.

Дорзоламида гидрохлорид является мощным ингибитором карбоангидразы II типа. Ингибирования карбоангидразы миллиарного тела приводит к снижению секреции внутриглазной жидкости за счет замедления образования бикарбонатных ионов, что, со своей стороны, приводит к снижению транспорта натрия и жидкости.

Тимолола малеат является неселективным блокатором бета-адренорецепторов. Точный механизм действия тимолола, что проявляется в уменьшении внутриглазного давления, до сих пор не известен. Флуориметричный и тонографические исследования свидетельствуют о том, что эффект тимолола

обусловлен уменьшением секреции гуморальной жидкости. Кроме того, тимолол может усиливать отток влаги.

Сочетанное действие двух компонентов приводит к более выраженному снижению внутриглазного давления, чем монотерапия этими препаратами.

После местного применения Розак снижает повышенное внутриглазное давление независимо от того, он связан с глаукомой. Повышенное внутриглазное давление играет значительную роль в патогенезе повреждения зрительного нерва и потере полей зрения при глаукоме. Розак снижает внутриглазное давление без развития характерных для миотических средств побочных эффектов, таких как ночная слепота, спазм аккомодации, сужение зрачка.

Фармакокинетика

Дорзоламида гидрохлорид

При местном применении дорзоламид проникает в системный кровоток. При длительном применении дорзоламид накапливается в эритроцитах в результате связывания с карбоангидразы II типа, поддерживая очень малые концентрации свободного препарата в плазме. Вследствие метаболизма дорзоламид образует единый N-дезетильный метаболит, который менее выражено блокирует карбоангидразы II типа по сравнению с его первоначальной форме: инкубирует карбоангидразы I типа менее активный изоенизм. Метаболит также накапливается в эритроцитах, где связывается, главным образом, с карбоангидразы I типа. Примерно 33% дорзоламида связывается с белками плазмы крови. Дорзоламид выводится с мочой в неизменном виде и в виде метаболита. После отмены препарата дорзоламид выводится нелинейно из эритроцитов, характеризуется начальным быстрым снижением концентрации и последующей фазой медленного вывода с периодом полувыведения около 4 месяца.

Тимолола малеат

После местного глазного применения тимолол абсорбируется системно. Системная экспозиция тимолола определялась после местного применения офтальмологического 0,5% раствора 2 раза в сутки. Максимальная концентрация в плазме крови после применения утренней дозы составляла 0,46 нг / мл, а после применения вечерней дозы - 0,35 нг / мл.

Показания

Показан для лечения повышенного внутриглазного давления у пациентов с открытоугольной глаукомой или псевдоэкссфолиативным глаукомой, когда местное применение только бета-блокаторов недостаточно.

Противопоказания

Препарат Розак противопоказан пациентам с:

- реактивными заболеваниями дыхательных путей, в том числе бронхиальной астмой или бронхиальной астмой в анамнезе, или тяжелым хроническим обструктивным заболеванием легких;
- синусовой брадикардией, синдромом слабости синусового узла, синоатриальная блокадой, AV-блокадой II или III степени, не контролируемая кардиостимулятором, выраженной сердечной недостаточностью, кардиогенным шоком;
- тяжелым нарушением функции почек (клиренс креатинина (CrCl) <30 мл / мин) или гиперхлоремическим ацидозом;
- повышенной чувствительностью к одной или к двум действующим веществам или к любому из компонентов препарата, а также в период беременности и кормления грудью.

Указанные выше заболевания основаны на информации по отдельным активным компонентам и не являются специфичными для комбинации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Специальные исследования взаимодействия препарата Розак и других лекарственных средств не проводились.

В клинических исследованиях этот препарат применяли одновременно с такими лекарственными средствами системного действия без признаков (без подтверждения) нежелательных взаимодействий препаратов: ингибиторы АПФ, блокаторы кальциевых каналов, мочегонные средства (диуретики), нестероидные противовоспалительные препараты, включая ацетилсалициловую кислоту и гормоны (например, эстроген, инсулин, тироксин).

Существует риск возникновения дополнительных эффектов, что является причиной артериальной гипотензии и / или выраженной брадикардии, когда офтальмологический раствор бета-блокаторов применяют одновременно с блокаторами кальциевых каналов для перорального применения, препаратами, снижающими выработку катехоламинов, или бета-адреноблокаторами, антиаритмическими препаратами (включая амиодарон), гликозидами

наперстянки, парасимпатомиметики, гуанетидином, наркотическими средствами и ингибиторами МАО (МАО).

Сообщалось о потенцировании системной бета-блокады (например, снижение частоты сердечных сокращений, депрессия) при комбинированном лечении ингибиторами СYP2D6

(Например, хинидин, флуоксетин, пароксетин) и тимолол

Хотя Розак качестве монотерапии оказывает незначительное влияние или не влияет на размер зрачка глаза, иногда сообщалось о мидриаз в результате одновременного применения офтальмологических бета-блокаторов и адреналина (эпинефрина).

Бета-блокаторы могут усиливать гипогликемический эффект противодиабетических препаратов.

Бета-адреноблокаторы для перорального применения могут провоцировать развитие рикошетной артериальной гипертензии при отмене клонидина.

Особенности применения

Реакция со стороны сердечно-сосудистой и дыхательной системы

Как и другие офтальмологические препараты местного действия, тимолол абсорбируется системно. Поскольку тимолол является бета-блокатор, возможно развитие побочных реакций со стороны сердечно-сосудистой и дыхательной системы, возникающие при системном применении таких препаратов. Частота возникновения системных побочных реакций после местного применения офтальмологических препаратов ниже, чем при системном применении. По снижению системной абсорбции см. раздел «Способ применения и дозы».

Со стороны сердца

Пациентам с сердечно-сосудистыми заболеваниями (например, ишемическая болезнь сердца, вазоспастична стенокардия / стенокардия Принцметала и сердечная недостаточность) и артериальной гипотензии лечение бета-блокаторами следует серьезно оценить и рассмотреть лечения другими действующими веществами. Необходимо наблюдать за состоянием пациентов с сердечно-сосудистыми заболеваниями относительно появления признаков ухудшения этих заболеваний и побочных реакций.

За негативного влияния на время проведения импульса бета-блокаторы следует назначать с осторожностью пациентам с блокадой сердца I степени.

Со стороны сосудистой системы

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

Со стороны дыхательной системы

Сообщалось о развитии побочных реакций со стороны дыхательной системы, в т.ч. летальных, вследствие бронхоспазма у пациентов с астмой после применения некоторых офтальмологических бета-блокаторов.

Розак следует применять с осторожностью пациентам с легким / умеренным хроническим обструктивным заболеванием легких и только при условии, что ожидаемая польза превышает потенциальный риск.

Нарушение функции печени

Не исследовался применения этого лекарственного средства пациентам с нарушениями функции печени, поэтому его следует с осторожностью назначать таким пациентам.

Иммунологические реакции и реакции гиперчувствительности

Как и другие офтальмологические препараты местного действия, этот препарат может абсорбироваться системно. Дорзоламид, как сульфаниламиды, содержит сульфонамидную группу. Поэтому побочные реакции, которые наблюдаются при системном применении сульфонамидных препаратов, могут возникать при местном применении, включая такие тяжелые реакции, синдром Стивенса-Джонсона и токсический эпидермальный некролиз. При появлении признаков серьезных реакций или реакций гиперчувствительности следует прекратить применение препарата.

При применении этого лекарственного средства наблюдались местные побочные реакции со стороны органов зрения, подобные реакций, которые возникают при применении глазных капель с дорзоламида гидрохлорид. При возникновении таких реакций следует рассмотреть вопрос о прекращении применения этого лекарственного средства.

При приеме бета-блокаторов пациенты с атопией или тяжелой анафилактической реакцией на многочисленные аллергены в анамнезе могут быть более чувствительными к повторному воздействию таких аллергенов в случае анафилактических реакций и могут не поддаваться лечению обычной дозой адреналина.

Сопутствующая терапия

Влияние на внутриглазное давление или известное влияние системных бета-блокаторов может усиливаться при применении тимолола пациентами, которые уже получают системный бета-блокатор. Следует тщательно наблюдать за ответом на лечение у таких пациентов. Применение двух местных бета-адреноблокаторов не рекомендуется (см. «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»).

Применение дорзоламида и пероральных ингибиторов карбоангидразы не рекомендуется.

Прекращение лечения

Как и при применении бета-блокаторов системного действия, следует постепенно прекратить применение офтальмологического тимолола при необходимости отмены препарата пациентам с ишемической болезнью сердца (ИБС).

Эффекты бета-блокаторов

Гипогликемия / диабет

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

Бета-блокаторы могут также маскировать признаки гипертиреоза. Внезапное прекращение применения бета-блокаторов может привести к ухудшению симптоматики.

Заболевания роговицы

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

Анестезия при хирургическом вмешательстве

Офтальмологические бета-блокаторы могут блокировать системное влияние бета-агонистов, например адреналина. Анестезиолога необходимо сообщить о том, что пациент получает тимолол.

Лечение бета-блокаторами может обострять симптоматику при миастении гравис.

Эффекты ингибирования карбоангидразы

Лечение пероральными ингибиторами карбоангидразы связывают с развитием уролителиаза в результате нарушений кислотно-основного баланса, особенно у пациентов с мочекаменной болезнью в анамнезе. Хотя нарушений кислотно-основного баланса при применении этого лекарственного средства не наблюдалось, редко сообщали о развитии уролителиаза. Поскольку ингибитор карбоангидразы при местном применении абсорбируется системно, пациенты с мочекаменной болезнью в анамнезе могут иметь более высокий риск развития уролителиаза при применении препарата Розак.

Другие особенности

Лечение пациентов с острой закрытоугольной глаукомой требует применения других терапевтических средств дополнительно к препаратам, снижающим глазное давление. Не исследовался применения этого лекарственного средства пациентам с острой закрытоугольной глаукомой.

При применении дорзоламида 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 применении препарата Розак таким пациентам.

О отслойка сосудистой оболочки глаза сообщалось после проведения фильтрационных процедур с назначением лечения водными супрессантов (например, тимолол, ацетазоламид).

Как и при применении других противоглаукомных препаратов, сообщалось о снижении чувствительности к офтальмологическое тимолола малеата после длительного лечения у некоторых пациентов. Однако в клинических исследованиях, во время которых 164 пациенты находились под врачебным наблюдением в течение по крайней мере трех лет, не наблюдалось существенных различий среднего показателя внутриглазного давления после начальной стабилизации давления.

Использование контактных линз

Это лекарственное средство содержит консервант - бензалкония хлорид, который может вызвать раздражение глаз. Следует снять контактные линзы перед закапыванием препарата и подождать как минимум 15 минут перед тем, как снова надеть их. Известно, что бензалкония хлорид может обесцвечивать 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 нечеткость зрения, могут негативно повлиять на способность некоторых пациентов управлять автотранспортом и работать с механизмами.

Применение в период беременности или кормления грудью

Беременность

Препарат применяют в период беременности.

Неизвестно, выводится дорзоламид в грудное молоко. Тимолол секретируется в грудное молоко, поэтому на период лечения следует прекратить кормление грудью.

Способ применения и дозы

Если препарат Розак применяют в качестве монотерапии, закапывают по 1 капле в больной глаз (глаза) 2 раза в сутки.

Если при лечении применяют несколько местных офтальмологических препаратов, то их применение должно происходить с интервалом минимум 10 минут.

При применении препарата необходимо избегать контакта капельницы с поверхностью глаза или кожи вокруг глаз. Иначе к раствору могут попасть микроорганизмы, которые повлекут инфекцию глаза (глаз). Использование контаминированного раствора может привести к тяжелым повреждениям глаза, вплоть до потери зрения.

Порядок применения капель:

1. Перед первым применением препарата необходимо убедиться, что флакон снабжен оригинальной лентой.
2. Чтобы открыть флакон, необходимо разорвать ленту, откручивая крышку в направлении против часовой стрелки.
3. Отклонить голову назад и оттянуть нижнее веко вниз, чтобы образовался зазор между веком и глазным яблоком.

4. Перевернуть флакон и осторожно нажать, пока одна капля препарата не попадет в глаз. Легкого нажатия на стенки флакона достаточно, чтобы отмерить одну каплю. НЕ СЛЕДУЕТ увеличивать отверстие капельницы. НЕ СЛЕДУЕТ касаться конечности капельницы ОКА, ВЕК И ДРУГИХ ПОВЕРХНОСТЕЙ.
5. Если врач прописал закапывать препарат в другой глаз, следует повторить действия, указанные в п.п. 3, 4.
6. После закапывания необходимо закрутить крышечку флакона.

Дети

Не применяется.

Передозировка

Нет данных о передозировке у людей при случайном или преднамеренном проглатывании препарата Розак.

Симптомы

Имеются сообщения о непреднамеренном передозировки офтальмологического раствора тимолола малеата, в результате которого возможно развитие системных эффектов, в частности головокружения, головной боли, одышки, брадикардии, бронхоспазма и остановки сердца, подобных таким, которые наблюдаются при передозировке бета-адреноблокаторов системного применения. Чаще всего ожидаемыми симптомами при передозировке дорзоламидом является нарушение электролитного баланса, развитие ацидоза и возможное влияние на центральную нервную систему.

Существуют ограниченные данные о передозировке у людей при случайном или преднамеренном проглатывании дорзоламидом гидрохлорида. Сообщалось о сонливости после перорального приема. При местном применении сообщалось о тошноту, головокружение, головная боль, слабость, необычные сновидения и дисфагию (затрудненное глотание).

Лечение

Лечение симптоматическое и поддерживающее. Следует контролировать уровень электролитов в сыворотке крови (особенно калия) и показателей pH крови. Исследования показали, что тимолол не выводится полностью при диализе.

Побочные реакции

В клинических исследованиях препарата Розак побочные реакции, которые наблюдались, соответствовали тем, о которых сообщалось ранее при применении дорзоламидом гидро- хлорида и / или тимолола малеата.

Как и другие офтальмологические препараты, применяемые местно, тимолол абсорбируется в системный кровоток. Это может привести к нежелательное воздействие, подобное такого, что наблюдается при применении системных бета-блокаторов. Частота возникновения системных побочных реакций на препарат после местного офтальмологического применения ниже, чем при системном введении.

О нижеприведенные побочные реакции сообщалось при применении препарата Розак или одного из его компонентов в процессе клинических исследований или постмаркетингового наблюдения.

Частота: очень часто ($\geq 1/10$), часто (от $\geq 1/100$ до $<1/10$), нечасто (от $\geq 1/1\ 000$ до $<1/100$), редко (от $\geq 1/10\ 000$ до $< 1/1000$), частота неизвестна (невозможно оценить по имеющимся данным).

Со стороны иммунной системы

Розак

Тимолола малеат, капли глазные, раствор

редко

Симптомы аллергических реакций, в том числе ангионевротический отек, крапивница, очаговые и множественные высыпания, анафилактические реакции.

Частота неизвестна **

Зуд.

Со стороны обмена веществ и питания

Тимолола малеат, капли глазные, раствор

Частота неизвестно **

гипогликемия

Со стороны психики

Тимолола малеат, капли глазные, раствор

Редко

Депрессия *.

редко

Бессонница * ночные кошмары * потеря памяти.

Со стороны нервной системы

Дорзоламидом гидрохлорид, капли глазные, раствор

распространены

Головная боль*.

редко

Головокружение *, парестезии * (нарушение чувствительности кожи).

Тимолола малеат, капли глазные, раствор

распространены

Головная боль*.

Редко

Головокружение * обморок *.

редко

Парестезии *, рост признаков и симптомов миастении гравис, снижение полового влечения (либидо) *, геморрагический инсульт *, церебральная ишемия.

Со стороны органов зрения

Розак

очень распространены

Жжение и покалывание.

распространены

Конъюнктивы инъекция, нечеткость зрения, эрозия роговицы, зуд в глазу, слезотечение

Дорзоламидом гидрохлорид, капли глазные, раствор

распространены

Воспаление век *, раздражение глаз *.

Редко

Иридоциклит *.

редко

Раздражение глаз, включая покраснение *, боль в глазах *, шелушение век *
временная миопия (исчезает при прекращении лечения), отек роговицы *
снижение внутриглазного давления *, отслойка сосудистой оболочки глаза (с
последующей фильтрующей операцией) *.

Тимолола малеат, капли глазные, раствор

распространены

Симптомы раздражения глаз, в том числе блефарит *, кератит * снижение
чувствительности роговицы, сухость глаз *.

Редко

Нарушение зрения, включая изменения рефракции (в некоторых случаях - из-за
отмены миотических средств) *.

редко

Птоз, диплопия, отслойка сосудистой оболочки глаза с последующей
фильтрующей операцией * (см. Раздел «Особенности применения»).

Частота неизвестна **

Зуд, слезотечение, покраснение, нечеткость зрения, эрозия роговицы.

Со стороны органов слуха и равновесия

Тимолола малеат, капли глазные, раствор

редко

Звон в ушах *.

Со стороны сердца

Тимолола малеат, капли глазные, раствор

Редко

Брадикардия *.

редко

Боль в грудной клетке *, учащенное сердцебиение *, аритмия *, застойная сердечная недостаточность *, остановка сердца *, блокада сердца.

Частота неизвестна **

Блокада, сердечная недостаточность.

Со стороны сосудов

Тимолола малеат, капли глазные, раствор

редко

Гипотензия *, хромота, феномен Рейно *, ощущение холода в кистях и стопах *.

Со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения

Розак

редко

Синусит.

редко

Одышка, дыхательная недостаточность, ринит, редко - бронхоспазм.

Дорзоламидом гидрохлорид, капли глазные, раствор

редко

Носовое кровотечение *.

Тимолола малеат, капли глазные, раствор

Редко

Затрудненное дыхание (одышка) *.

редко

Бронхоспазм (преимущественно у пациентов с уже существующим бронхоспастическим заболеванием) *, дыхательная недостаточность, кашель *.

Со стороны желудочно-кишечного тракта

Розак

очень распространены

Дисгевзия (изменение вкусовых ощущений).

Дорзоламидом гидрохлорид, капли глазные, раствор

распространены

Тошнота *.

Редко

Тошнота * диспепсия *.

редко

Раздражение в горле, сухость во рту *.

Тимолола малеат, капли глазные, раствор

редко

Диарея *, сухость во рту *.

Частота неизвестна **

Дисгевзия (изменение вкусовых ощущений), боль в животе, рвота.

Со стороны кожи и подкожных тканей

Розак

редко

Контактный дерматит, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз.

Дорзоламидом гидрохлорид, капли глазные, раствор

редко

высыпания *

Тимолола малеат, капли глазные, раствор

редко

Алопеция *, псориазические высыпания или обострение псориаза.

неизвестно **

Высыпания на коже.

Со стороны костно-мышечной и соединительной ткани

Тимолола малеат, капли глазные, раствор

редко

Системная красная волчанка.

Частота неизвестна **

Миалгия.

Со стороны почек и мочевыводящих путей

Розак

нечасто

Уролитиаз.

Со стороны половых органов и молочной железы

Тимолола малеат, капли глазные, раствор

редко

Болезнь Пейрони *, снижение полового влечения (либидо).

Частота неизвестна **

Половая дисфункция.

Общие расстройства и нарушения в месте введения

Дорзоламидом гидрохлорид, капли глазные, раствор

часто

Астения / слабость *.

Тимолола малеат, капли глазные, раствор

нечасто

Астения / слабость *

* Эти побочные реакции также наблюдались при применении препарата Розак в ходе постмаркетингового наблюдения;

** дополнительные побочные реакции наблюдались при применении офтальмологических бета-блокаторов и могут, вероятно, возникать при применении препарата Розак.

Срок годности

2 года. Срок годности после первого вскрытия: 4 недели.

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке при температуре ниже 25°C. Хранить в недоступном для детей месте. Не использовать после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Упаковка

По 5 мл во флаконе из белого LDPE (полиэтилен низкой плотности) на 5 мл с капельницей с LDPE и белой крышечкой из HDPE (полиэтилен высокой плотности), в картонной коробке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

АО «Адамед Фарма», Польша.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

ул. Марш. Дж. Пилсудского 5, 95-200, Пабьянице, Польша.

Источник инструкции

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