

Состав

действующее вещество: дорзоламид в форме дорзоламида гидрохлорида;

1 мл раствора содержит дорзоламида - 20 мг в форме дорзоламида гидрохлорида - 22,26 мг;

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

Лекарственная форма

Капли глазные, раствор.

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

Опалесценция: не превышает эталонную суспензию И.

Фармакотерапевтическая группа

Ингибиторы карбоангидразы. Код АТХ S01E C03.

Фармакодинамика

Эффективность дорзоламида, который применяли пациентам с глаукомой или глазной гипертонией в монотерапии раза в сутки (первичный внутриглазное давление ≥ 23 мм рт.ст.) или два раза в сутки в качестве дополнительного препарат в лечении бета-адренолитики в форме глазных капель (первичный внутриглазное давление ≥ 22 мм рт.ст.), была подтверждена в клинических исследованиях. При применении как в монотерапии, так и дополнительно препарат снижал внутриглазное давление в течение всего дня и этот эффект сохранялся в течение длительного применения. Эффективность препарата после длительного применения в качестве монотерапии была похожа на эффективность бетаксолола и лишь незначительно меньше, чем эффективность тимолола. При применении дорзоламидом качестве дополнительного препарата в бета-адренолитическое терапии в форме глазных капель отмечалось дополнительное снижение внутриглазного давления, как при применении пилокарпина 2% 4 раза в сутки.

Фармакокинетика

Абсорбция

Местное применение дорзоламидом гидрохлорида создает условия для непосредственного воздействия препарата на глаз после применения небольшой дозы обеспечивает гораздо меньшую общую экспозицию препарата. Поэтому снижение внутриглазного давления не сопровождается нарушениями кислотно-щелочного баланса и нарушениями уровня электролитов, характерные для пероральных ингибиторов карбоангидразы.

После местного применения дорзоламид попадает в общий кровоток. После длительного применения дорзоламид аккумулируется в эритроцитах в связи с селективным сочетанием с изоферментом карбоангидразы II, а концентрация свободного препарата в плазме крови остается очень низкой. Единственный метаболит препарата - это N-диетило-дорзоламид, который тормозит карбоангидразы II медленнее, чем дорзоламид, но тормозит также изофермент с меньшей активностью (карбоангидразы I). Этот метаболит аккумулируется также в эритроцитах, в которых он сочетается прежде всего с карбоангидразы I.

Выведение.

Дорзоламид сочетается с белками плазмы (около 33%). Дорзоламид и его метаболит выводятся прежде всего с мочой в неизмененном виде. После окончания приема препарата происходит нелинейное снижение концентрации дорзоламидом в эритроцитах. Сначала происходит быстрое снижение концентрации препарата, после чего наступает фаза более медленного выведения с периодом полувыведения около 4 месяцев.

После перорального применения дорзоламида с целью симуляции максимальной системной экспозиции, которая возможна после длительного местного применения дорзоламида, состояния равновесия достигнуто в течение 13 недель. В состоянии равновесия в плазме крови не обнаружено присутствия свободного препарата или его метаболита. Похожие фармакологические результаты наблюдались после длительного местного применения дорзоламида.

Фармакокинетика у различных групп пациентов

У некоторых пациентов пожилого возраста с нарушениями функции почек (приблизительный клиренс креатинина 30-60 мл/мин) наблюдалась высокая концентрация метаболита дорзоламида в эритроцитах. Не выявлено существенной разницы в отношении торможения активности карбоангидразы и клинически значимых общих побочных действий, которые можно с этим связывать.

Показания

Лечение повышенного внутриглазного давления у пациентов с:

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

Противопоказания

- Гиперчувствительность к активному веществу препарата или к вспомогательному веществу.
- Тяжелое нарушение функции почек ($\text{CrCl} < 30$ мл/мин.).
- Гиперхлоремический ацидоз.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Не проводили фундаментальных исследований взаимодействия дорзоламида с другими препаратами. В клинических исследованиях не подтверждено взаимодействия при одновременном применении дорзоламида с тимололом и бетаксололом в форме глазных капель, препаратами общего действия: ингибиторами АПФ, БМКК, диуретиками и нестероидными противовоспалительными препаратами (НПВП), в том числе ацетилсалициловой кислотой, а также с гормональными средствами (например, эстрогенами, инсулином, тироксином).

Возможно взаимодействие между дорзоламидом и препаратами, которые сужают зрачок, а также агонистами адренорецептора при лечении глаукомы не изучена.

Особенности применения

Не исследовалась применения дорзоламида пациентам с печеночной недостаточностью, поэтому рекомендуется осторожность при лечении таких пациентов.

При лечении пациентов с острой закрытоугольной глаукомой существует необходимость кроме препаратов, снижающих внутриглазное давление,

применить и другие терапевтические мероприятия. Не исследовалась применения дорзоламида пациентам с этим диагнозом.

Дорзоламид является сульфаниламидом, который кроме местного действия подвергается также системной абсорбции в общий кровообращения. Поэтому те же побочные явления, появляющиеся после общего применения сульфаниламидов, могут появиться также после местного применения. В случае диагностирования тяжелых побочных явлений или симптомов гиперчувствительности следует прекратить прием препарата.

Лечение с применением 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, но были зафиксированы редкие случаи уретеролитиаза. Поскольку дорзоламид - это ингибитор карбоангидразы местного действия, который всасывается в общий кровообращения, пациенты с почечнокаменной болезнью в анамнезе относятся к группе повышенного риска развития уретеролитиаза в связи с применением дорзоламида.

В клинических исследованиях при длительном применении дорзоламидом наблюдались местные проявления побочного действия, прежде всего конъюнктивит и раздражение век. Некоторые из этих реакций протекали как аллергические реакции, которые проходили после окончания приема препарата. В этих ситуациях следует рассмотреть необходимость прекращения лечения дорзоламидом.

Возможно усиление общего действия при применении ингибиторов карбоангидразы пациентами, которые одновременно принимают ингибитор карбоангидразы внутрь и дорзоламид. Одновременное применение дорзоламида и пероральный прием ингибиторов карбоангидразы не исследовалась и не рекомендуется.

У пациентов с ранее диагностированными хроническими дефектами роговицы и (или) с внутримышечными операциями в анамнезе при применении дорзоламида наблюдались отеки роговицы и необратимая декомпенсация роговицы. Таким пациентам дорзоламид местно следует применять с осторожностью.

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

Розалин содержит консервант - бензалкония хлорид, который может привести к раздражению глаз. Контактные линзы следует снять перед применением препарата и надеть не ранее, чем через 15 минут после закапывания. Бензалкония хлорид может привести к потере мягкими контактными линзами цвета.

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

У некоторых пациентов, принимающих дорзоламид, возможно побочное действие в виде головокружения, нарушений зрения, которые могут влиять на способность управлять автомобилем или работать с механизмами.

Применение в период беременности или кормления грудью

Беременность.

Не проводили соответствующих контролируемых исследований применения препарата беременным женщинам. Не следует применять дорзоламид в период беременности.

Период кормления грудью: неизвестно, проникает ли дорзоламид в грудное молоко. Дорзоламид не следует применять в период кормления грудью.

Способ применения и дозы

Если препарат Розалин применять в монотерапии, следует закапывать по 1 капле в больной глаз (или оба глаза) 3 раза в сутки.

В вспомогательной терапии вместе с бета-адренолитическими препаратами для местного применения в конъюнктивальный мешок больного глаза (глаз) закапывать 1 каплю препарата Розалин 2 раза в сутки.

При желании заменить препаратом Розалин другой местный противоглаукомный препарат, следует прекратить лечение этим средством и начать применение препарата Розалин следующий день.

Если при лечении пациент применяет несколько местных офтальмологических препаратов, то их следует применять с интервалом как минимум 10 минут.

При применении препарата необходимо избегать контакта капельницы с поверхностью глаза или кожи вокруг глаз, иначе глазные капли могут контамироваться микроорганизмами, которые могут повлечь инфекцию глаза

(глаз). Использование контаминированного раствора может привести к тяжелому поражению глаза, что может привести к потере зрения.

Дети

Данные по применению глазных капель детям ограничены, поэтому не следует применять детям.

Передозировка

Данные про последствия передозировки у людей ограничены. Наблюдалась появление таких симптомов: после приема препарата внутрь - сонливость после местного применения: тошнота, головокружение, головная боль, чувство усталости, нетипичные сны и дисфагия. При передозировке необходимо применять симптоматическую и поддерживающую терапию. Возможно появление электролитных нарушений, развитие астении и симптомов со стороны ЦНС. Необходимо проверить концентрацию электролитов (в частности калия) в сыворотке крови и определить уровень pH крови.

Побочные реакции

Чаще всего с применением дорзоламида связывают такие побочные действия: горечь во рту, жжение и покалывание в глазах, нечеткость зрительного восприятия, зуд в глазах, слезотечение, головная боль, конъюнктивит, блефарит, тошнота, раздражение век и ощущение слабости и усталости. Чаще всего (примерно в 3% пациентов) причиной прекращения лечения Розалин были побочные действия со стороны глаз, прежде всего диагностирования конъюнктивита после приема препарата и реакции со стороны век. Редко отмечалось воспаление радужной оболочки и цилиарного тела и кожные высыпания. В одном случае диагностирована мочекаменная болезнь.

При применении препарата, содержащего дорзоламид, отмечались побочные действия с такой частотой: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$ до $<1/10$), не слишком часто ($\geq 1/1\ 000$ до $<1/100$), редко ($\geq 1/10\ 000$ до $<1/1000$), очень редко ($<1/10\ 000$), частота неизвестна (частоту нельзя определить на основании доступных данных).

Нарушение нервной системы:

часто: головная боль;

редко: парестезии, головокружение.

Со стороны органа зрения: очень часто: жжение и покалывание;

часто: поверхностный точечный кератит, слезотечение, конъюнктивит, блефарит, зуд в глазах, раздражение глаз, нечеткость зрительного восприятия;

не слишком часто: воспаление радужной оболочки и цилиарного тела;

редко: раздражение, в том числе покраснение, боль, слипание век, преходящая близорукость (проходящей после прекращения лечения), отек роговицы, пониженное напряжение глазного яблока, отслойка сосудистой оболочки после фильтрационных мероприятий;

неизвестно: ощущение инородного тела в глазу.

Нарушение работы сердца:

неизвестно: сердцебиение.

Со стороны дыхательной системы: редко носовое кровотечение;

неизвестно: одышка.

Со стороны пищеварительного тракта: часто тошнота, горький привкус во рту;

редко: раздражение горла, сухость во рту.

Со стороны кожи и подкожной ткани: редко контактный дерматит, синдром Стивенса Джонсона, токсический эпидермальный некролиз.

Со стороны почек и мочевых путей: редко мочекаменная болезнь.

Общие нарушения и состояние участка введения: часто астения/повышенная утомляемость;

редко: гиперчувствительность, субъективные и объективные проявления местных реакций, в том числе реакций в пределах век и проявления общих аллергических реакций, в том числе ангионевротический отек, бронхоспазм, крапивница, зуд, сыпь, одышка.

Влияние на результаты лабораторных исследований.

Не зафиксировано существенных электролитных нарушений, связанных с применением дорзоламида.

Срок годности

2 года.

Срок годности после первого использования - 4 недели.

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке при температуре ниже 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 5 мл во флаконе в картонной коробке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

АО «Адамед Фарма».

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](#).