Состав

действующее вещество: дорзоламид;

1 мл препарата содержит дорзоламидом гидрохлорида 22,3 мг, что эквивалентно 20 мг дорзоламиду;

вспомогательные вещества: бензалкония хлорид, манит (Е 421), натрия цитрат, натрия гидроксид, гидроксиэтилцеллюлоза, вода очищенная.

Лекарственная форма

Капли глазные, раствор.

Основные физико-химические свойства: прозрачная и бесцветная или почти бесцветная жидкость.

Фармакотерапевтическая группа

Средства для применения в офтальмологии. Противоглаукомные препараты и миотические средства. Ингибиторы карбоангидразы. Дорзоламид.

Код АТХ S01E C03.

Фармакодинамика

Карбоангидраза (СА) - фермент, который содержится во многих тканях, в том числе в тканях глаза. У людей СА существует в нескольких фермента, из которых наиболее активен СА II. СА II преимущественно содержится в эритроцитах, но встречается и в других тканях. Ингибирования СА в цилиарных отростках в эти уменьшает выделение слез, прежде всего замедлением создания бикарбонатных ионов, с последующим уменьшением концентрации натрия и жидкости. В результате этого снижается глазное давление.

Дорзоламид является сильным ингибитором СА II у человека. После применения снижает глазное давление, независимо от того связан он с глаукомой или нет. Повышенное глазное давление - главный фактор риска в патогенезе повреждения глазного нерва и в потере поля зрения при глаукоме. Глазное давление снижается без обычных побочных действий миотических средств подобно ночной слепоты, спазма аккомодации и сужение зрачка. Дорзоламид не влияет на пульс или артериальное давление или такой эффект минимальный.

Местное применение бета-блокаторов также снижает глазное давление уменьшением выделения слез, а также другими механизмами действия. Исследования показали, что применение дорзоламидом вместе с местным бета-блокаторами дополнительно снижает глазное давление. Это явление подтверждает ранее известный факт о дополнительном эффект бета-блокаторов и ингибиторов карбоангидразы.

Фармакокинетика

В отличие от ингибиторов карбоангидразы, принимаемых внутрь, местное применение дорзоламидом позволяет активному веществу действовать непосредственно на глаз, даже при применении в небольших дозах, также уменьшает его системное действие. Таким образом можно снизить интраокулярных давление без нарушения кислотно-щелочного равновесия и электролитного баланса, сопровождающие применение ингибиторов карбоангидразы.

Дорзоламид поступает в периферический кровоток даже при местном применении. Для оценки величины системной ингибирования карбоангидразы при местном применении препарата определяли концентрацию активного вещества и метаболитов в плазме и эритроцитах, а также ингибирование активности карбоангидразы в эритроцитах. Дорзоламид накапливается в эритроцитах при длительном применении в результате селективного связывания с CA II, тогда как в плазме в свободной форме сохраняется в очень низких концентрациях. С активного вещества образуется один N-дизетильний метаболит, меньше тормозит активность CA II, чем активное вещество, однако тормозит также активность менее активного фермента (CA I). Метаболит также накапливается в эритроцитах, где связывается сначала с CA I. Дорзоламид связывается с белками плазмы (около 33%). Выделяется сначала с мочой, причем в неизмененном виде. Метаболит также выделяется с мочой. После отмены препарата дорзоламид выводится нелинейно из эритроцитов, с начальным быстрым снижением концентрации и последующей фазой медленного вывода с периодом полувыведения около 4 месяца.

Подобные фармакокинетические результаты получены также при длительном местном применении дорзоламидом. У некоторых больных пожилого возраста с ослабленной функцией почек с клиренсом креатинина (CrCl) 30-60 мл/мин, наблюдаются повышенные концентрации метаболитов в эритроцитах, но нет разницы в степени ингибирования карбоангидразы и клинически значимых системных побочных явлений.

Показания

Дорзол® применяют для лечения повышенного глазного давления у больных с:

- глазной гипертензией;
- открытоугольной глаукомой;
- псевдоэксфолиативным глаукомой;

в качестве дополнительной терапии при лечении бета-блокаторами или в качестве монотерапии, когда лечение бета-блокаторами не было успешным или бета-блокаторы противопоказаны.

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к активным веществам или к любому вспомогательному веществу;
- тяжелые нарушения функции почек (CrCl ˂ 30 мл/мин)
- гиперхлоремический ацидоз.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Возможность взаимодействия капель Дорзол® с другими лекарствами не исследовалась.

При одновременном применении дорзоламидом с нижеприведенными лекарствами не было обнаружено нежелательных взаимодействий: глазные капли тимолол и бетаксолол, лекарства с системным эффектом - ингибиторы АПФ (АПФ), блокаторы кальциевых каналов, мочегонные средства, нестероидные противовоспалительные препараты, в том числе ацетилсалициловая кислота и гормоны (например эстроген, инсулин и тироксин).

Взаимодействие дорзоламидом, миотиками и агониста и адренорецепторов время лечения глаукомы не изучено полностью.

Дорзоламид потенцирует эффект других антиглаукомных препаратов. ацетазоламид при
приеме внутрь повышает риск развития системных побочных эффектов дорзоламидом.
Эффект таких ингибиторов ацетилхолинэстеразы, как физиостигмин, галантамин, неостигмин или пиридостигмин (которые часто применяются при миастении), может быть снижен дорзоламидом.

При совместном применении с диуретиками возможна значительная потеря калия.

Назначение одновременно с фенитоином может ухудшить течение остеопороза.

Салициловая кислота, применяемая вместе с дорзоламидом, может привести к развитию ацидоза. Кроме того, консервант, содержащийся в каплях дорзоламидом (бензалкония хлорид), может взаимодействовать с мягкими контактными линзами.

Особенности применения

Больным с острой закрытоугольной глаукомы типа также необходимо применение других лекарств вместе с теми, которые снижают глазное давление. Применение капель Дорзол® у больных с острой закрытоугольной глаукомы типа не исследовали.

Как и все офтальмологические лекарства, которые применяются местно, препарат также может всасываться системно. Дорзоламид, как и сульфаниламиды, содержит сульфонамидный группу. Поэтому при местном применении возможны побочные эффекты, которые наблюдаются также при системном применении сульфонамидных препаратов, включая такие тяжелые реакции, синдром Стивенса-Джонсона и токсический эпидермальный некролиз. В случае появления признаков острых реакций или повышенной чувствительности прием лекарств следует прекратить.

В случае появления признаков аллергической реакции (конъюнктивит, реакции на веках) нужно рассмотреть возможность отмены капель Дорзол®.

Лечение пероральными ингибиторами карбоангидразы связано с уролитиаза как результатом нарушения кислотно-щелочного равновесия, особенно у больных, у которых уже были почечные камни. Хотя при применении капель Дорзол® не отмечалось нарушений кислотно-щелочного равновесия, есть редкие сообщения о появлении уролитиаза. Дорзоламид является ингибитором карбоангидразы для местного применения, может системно всасываться, и у больных с почечными камнями в анамнезе существует повышенный риск появления уролитиаза.

У больных, принимающих пероральный ингибитор карбоангидразы и дорзоламид, существует повышенный риск дополнительного системного эффекта, поэтому одновременное применение не рекомендуется.

Есть случаи появления отека роговой оболочки и необратимой декомпенсации роговой оболочки у больных, которые ранее имели хронический дефект роговой оболочки и/или перенесших хирургическое вмешательство на глазу. Таким больным дорзоламид следует применять с осторожностью.

У больных, принимающих лекарства для предотвращения слезотечения, может наблюдаться увеит с одновременной гипотонией глаза после фильтрационной операции.

Нарушение функции печени.

Применение Дорзола® у больных с нарушенной функцией печени не исследовали, поэтому таким больным его следует применять с осторожностью.

Капли содержат хлорид бензалкония, который может вызвать раздражение глаз.

Необходимо избегать прямого контакта с мягкими контактными линзами.

Контактные линзы необходимо снять перед закапыванием препарата и надеть их примерно через 15 минут.

Препарат изменяет цвет мягких контактных линз.

Больные пожилого возраста

Указанное дозирования касается также лиц пожилого возраста.

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

Препарат может вызвать побочные явления, например помутнение зрения, головокружение, тошноту, которые могут повлиять на способность управлять автотранспортом и работать с механизмами.

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

Капли Дорзол® во время беременности применять не рекомендуется.

В случае применения капель Дорзол® кормления грудью не рекомендуется.

Способ применения и дозы

Рекомендуется закапывать по 1 капле Дорзола® в конъюнктивальный мешок больного глаза 3 раза в день при монотерапии.

В медиальный угол каждого глаза закапать по 1 капле. Легко нажать на зону слезного мешка сразу после закапывания, чтобы уменьшить возможность системного поглощения Дорзола®.

Если лекарственное средство применяется как дополнительная терапия, вместе с местным бета-блокаторами закапывать по 1 капле Дорзола® в конъюнктивальный мешок больного глаза дважды в день.

Когда одно лекарство от глаукомы заменяют капли Дорзол®, применение этих лекарств прекращается приемом соответствующей дневной дозы и на следующий день следует начинать прием капель Дорзол®.

В случае местного применения нескольких Офтальмика принимать их нужно с промежутками в 10 минут.

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

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

Дети

Данные о применении лекарственного средства детям ограничены, поэтому его назначают детям.

Передозировка

Отсутствуют данные о случайное или преднамеренное передозировка дорзоламидом, принятого перорально.

Симптомы

При приеме внутрь наблюдается сонливость.

При местном применении отмечается тошнота, нечеткость, головная боль, усталость, ненормальные сновидения и дисфагия.

Лечение

Лечение при передозировке должно быть симптоматическим и поддерживающим.

Возможны нарушения уровня электролитов, развитие ацидоза, а также побочные эффекты со стороны нервной системы. Необходимо наблюдать за уровнем электролитов.

Побочные реакции

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

Со стороны органа зрения: пощипывание и жжение, поверхностный точечный 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, ощущение инородного тела в глазу.

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

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

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

Со стороны сердечно-сосудистой системы:

Сильные сердцебиения, которое может быть ускоренным или нерегулярным (пальпитация) -частота не может быть оценена на основе имеющихся данных.

Со стороны почек и мочевыделительной системы: уролитиаз (мочекаменная болезнь).

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

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

Срок годности

2 года.

Условия хранения

Хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 30 °С. После вскрытия флакона глазные капли следует применить в течение 4 недель.

Упаковка

По 5 мл раствора во флаконе-капельнице; 1 флакон-капельница в картонной коробке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

Ядран-Галенский Лабораторий д.д./Jadran-Galenski Laboratorij d.d.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Свильно 20 51000 Риека, Хорватия/Svilno 20 51000 Rijeka, Croatia

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — Государственного реестра лекарственных средств Украины.