

ДОРСОБ

ИНСТРУКЦИЯ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО СРЕДСТВА

Торговое название
Дорсоб

Международное непатентованное название
Дорзоламид

Лекарственная форма
Капли глазные 2%, 5 мл

Состав
5 мл препарата содержит **активное вещество:** дорзоламид гидрохлорида - 111.30 мг (эквивалентно дорзоламиду 100.00 мг) **вспомогательные вещества:** маннитол, натрия цитрат, гидроксизилцеллюлоза (натрозол НХ 250), натрия гидроксид 5 М раствор до pH 5.65, бензалкония хлорид 50 % раствор, вода для инъекции.

Описание

Слегка вязкий прозрачный бесцветный раствор

Фармакотерапевтическая группа

Противоуглазные препараты и миотические средства.
Ингибиторы карбоангидразы. Дорзоламид.
Код АТХ S01E03

Фармакологические свойства

Фармакокинетика

Местное применение дорзоламид гидрохлорида, позволяет активному веществу оказывать влияние непосредственно на глаза при значительно более низких дозах, и с меньшим системным воздействием. Что приводит к снижению внутриглазного давления (ВГД) без нарушения кислотно-щелочного состава крови или ее электролитного состава. При местном применении, дорзоламид проникает в системный кровоток. При длительном применении, в результате селективного связывания с карбоангидразой (КА) II типа, дорзоламид накапливается в эритроцитах, в плазме крови поддерживаются крайне низкие концентрации свободной формы дорзоламид. Дорзоламид метаболизируется с образованием единственного N-деэтилированного метаболита, который менее активно угнетает карбоангидразы II типа по сравнению с дорзоламидом, однако способен угнетать и карбоангидразы I типа. Метаболит способен накапливаться в эритроцитах, где связывается, главным образом, с карбоангидразой I типа. Связь дорзоламид с белками плазмы крови составляет около 33%. Дорзоламид выводится почками в неизменном виде и в виде метаболита. После отмены препарата, дорзоламид нелинейно вымывается из эритроцитов, что сначала приводит к быстрому снижению его концентрации, далее выведение замедляется. Период полувыведения ($T_{1/2}$) составляет около 4 месяцев.

При пероральном применении дорзоламид для имитации максимального системного воздействия длительного местного применения офтальмологического препарата, стационарное состояние было достигнуто в течение 13 недель. В устойчивом состоянии, почти не определялось свободное активное вещество и его метаболит в плазме крови. Угнетение КА в эритроцитах было менее выражено, чем ожидалось (ниже уровня, способного оказать влияние на функцию почек или дыхания). Аналогичные фармакокинетические результаты наблюдались после длительного, местного применения дорзоламид. Тем не менее, у некоторых пожилых пациентов с нарушением функции почек (клиренс креатинина 30-60 мл/мин), отмечались более высокие концентрации метаболита в эритроцитах, но не выявлено никаких значимых различий в угнетении КА и клинически значимых системных побочных эффектов.

Фармакодинамика

Механизм действия

Дорсоб - противоуглазный препарат, селективно угнетающий карбоангидразу II типа. Угнетение карбоангидразы циклического тела приводит к снижению секреции внутриглазной жидкости за счет замедления образования бикарбонатных ионов, что в свою очередь приводит к замедлению транспорта ионов натрия (Na⁺) и воды. После местного применения 2% офтальмологического раствора Дорсоб, снижается повышенное внутриглазное давление, которое является ведущим фактором повреждения зрительного нерва и ухудшения зрительных функций (выпадения полей зрения). Дорзоламид не вызывает спазма accommodation, миоза, гемалогии; оказывает минимальное или вообще не влияет на частоту пульса и артериальное давление. Бета-адреноблокаторы для местного применения, снижают внутриглазное давление (ВГД) за счет уменьшения секреции жидкости, а также посредством других механизмов действия. Если дорзоламид добавляется к бета-блокатору, наблюдается дополнительное снижение ВГД. Это заключение согласуется с известными аддитивными эффектами бета-блокаторов и пероральных ингибиторов карбоангидразы.

Взрослые

Эффективность дорзоламид для пациентов с глаукомой или внутриглазной гипертензией. При монотерапии препарат применяют три раза в день (исходный уровень ВГД ≥ 23 мм рт.ст.), при применении в качестве дополнительной терапии к офтальмологическим бета-блокаторам (исходный уровень ВГД ≥ 22 мм рт.ст.), два раза в день. Эффект снижения ВГД от дорзоламид, как при монотерапии, так и при адьювантной терапии отмечается в течение всего дня и сохраняется также при длительном лечении. Эффект при длительной монотерапии похож на действие бетаксолола, но менее выражен, чем у тимолола. При применении дорзоламид в качестве дополнительной терапии к офтальмологическим бета-блокаторам, дополнительное снижает ВГД похож на эффект 2% пилокарпина при частоте его применения четыре раза в день.

Показания к применению

- в качестве дополнительной терапии к бета-блокаторам
- в качестве монотерапии у пациентов, не реагирующих на применение бета-блокаторов или в которых бета-блокаторы противопоказаны

Для лечения повышенного внутриглазного давления при заболеваниях:

- внутриглазной гипертензии
- открытоугольной глаукома
- псевдоэксfolиативная глаукома

Способ применения и дозы

Только для местного применения, закапывать в конъюнктивальный мешок пораженного глаза.

Возможны ирриты, избегать контакта с мягкими контактными линзами, удалять контактные линзы перед применением и выждать не менее 15 минут после закапывания препарата.

При монотерапии, доза препарата Дорсоб составляет одну каплю в конъюнктивальный мешок пораженного глаза (или глаз), три раза в день.

При комбинации с бета-адреноблокаторами для местного применения, доза препарата составляет одну каплю в конъюнктивальный мешок пораженного глаза (глаз), два раза в день.

При замене другого офтальмологического препарата против глаукомы на препарат Дорсоб, необходимо прекратить применение этого препарата за день до начала применения препарата Дорсоб.

При одновременном применении других местных офтальмологических препаратов интервал между инстилляциями должен быть не менее 10 минут. Если пациент одновременно использует глазную мазь, то ее наносят в последнюю очередь. Перед закапыванием глазных капель, контактные линзы необходимо снять, их можно снова надеть через 15 минут после закапывания.

Перед применением лекарственного препарата, необходимо тщательно вымыть руки, следует избегать соприкосновения пипетки с глазами и окружающими предметами.

При неправильном использовании, содержимое флакона может быть инфицировано и стать причиной инфекционных поражений глаза и последующей потери зрения.

Инструкция по применению

1. Перед первым применением, снимите защитный слой на горлышке флакона. Для закрытого флакона допустимо небольшое пространство между флаконом и крышкой.
2. Крышку флакончика необходимо снять.
3. Необходимо отклонить голову пациента назад и осторожно опустить нижнее веко до образования небольшого подбоя кармана между веком и глазом.
4. Флакончик необходимо перевернуть и слегка надавить на него до появления капли и закапать её в глаз. Кончик пипетки флакона не должен касаться глаза или века.
5. При необходимости, повторите процедуру со вторым глазом.
6. Сразу же после использования, необходимо закрыть флакончик крышкой.

Дети

Имеются ограниченные клинические данные по применению препарата Дорсоб, трижды в день у детей.

Побочные действия

Все выявленные нежелательные побочные эффекты распределены в соответствии с нижеперечисленной частотой встречаемости: очень часто: ($\geq 1/10$), часто: ($\geq 1/100$ до $< 1/10$), нечасто: ($\geq 1/1.000$ до $< 1/100$), редко: ($\geq 1/10.000$ до $< 1/1.000$), очень редко ($< 1/10.000$) и неизвестно (невозможно установить исходя из имеющихся данных), Очень часто ($\geq 1/10$)

- зипание, жжение и покалывание в глазах после инсталляции.
- Частота ($\geq 1/100$, $< 1/10$)
- поверхностные точечный кератит, слезоточивость, конъюнктивит, воспаление век, зуд в глазах, раздражение век, затуманенное зрение
- головная боль
- тошнота и горький привкус во рту
- астения/усталость
- Нечасто ($\geq 1/1.000$, $< 1/100$)
- иридоциклит
- Редко ($\geq 1/10.000$, $< 1/1.000$)
- покраснение глаз, боль в глазах, образование корок на веке, транзиторная миопия (проходящая после отмены препарата), отек роговицы, понижение внутриглазного давления, отслойка сетчатки (у пациентов после операции по поводу глаукомы)
- головокружения, парестезии
- носовое кровотечение
- раздражение горла, сухость в рту
- уролитиаз
- признаки и симптомы повышенной чувствительности: локальные проявления – пальпебральные реакции, системные реакции – отек Квинке, крапивница, зуд, сыпь, анафилаксия и редко бронхоспазм
- контактный дерматит, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз
- мочекаменная болезнь.

С неизвестной частотой

- ощущение инородного тела в глазу
- диспноэ

Дорзоламид не вызвал значимых нарушений электролитного состава в детской популяции.

Противопоказания

- повышенная чувствительность к активному веществу или к любому из вспомогательных веществ
- хроническая почечная недостаточность (клиренс креатинина менее 30 мл/мин)
- гиперхлоремический ацидоз
- беременность и период лактации
- дети до 8 лет

Лекарственные взаимодействия

Конкретные исследования лекарственных взаимодействий с дорзоламидом не проводились.

Дорзоламид применялся одновременно с нижеперечисленными препаратами без признаков неблагоприятных взаимодействий: офтальмологический раствор тимолола, офтальмологический раствор бетаксолола и системные препараты, в том числе ингибиторы АПФ, блокаторы кальциевых каналов, диуретики, нестероидные противовоспалительные препараты, аспирин и гормоны (например, эстроген, инсулин, тироксин).

Комбинация дорзоламид, миотических и адренергических агонистов не была достаточно изучена при терапии глаукомы.

Дорзоламид является ингибитором карбоангидразы и несмотря на то, что он применяется местно, он может всасываться и действовать системно. Не было выявлено случаев нарушения кислотно-основного равновесия других лекарственных препаратов. Однако, лечение пероральными ингибиторами карбоангидразы вызывает такие нарушения, а в некоторых случаях оно приводило к лекарственному взаимодействию (токсичности, связанной с поступлением большого количества салицилата). Это необходимо иметь виду пациентам, применяющим раствор глазных капель Дорсоб.

Особые указания

Пациенты с нарушением функции печени:

Препарат Дорсоб не применяется у пациентов с нарушениями функции печени, поэтому в таких случаях его следует применять с осторожностью.

Пациенты с нарушением функции почек:

Особенности применения у пациентов с тяжелыми нарушениями функции почек (клиренс креатинина менее 30 мл/мин) не изучены. Поскольку дорзоламид (как и его метаболит) выводится преимущественно через почки, не рекомендуется назначать препарат Дорсоб при данной патологии.

Пациенты с острой закрытоугольной глаукомой:

Лечение пациентов с острой закрытоугольной глаукомой требует назначения других лекарственных препаратов. Однозначно к офтальмологическим гипотензивным препаратам. Отсутствует опыт применения препарата Дорсоб у пациентов с острой закрытоугольной глаукомой.

Препарат Дорсоб содержит сульфонамидную группу, которая имеется у сульфаниламидов. Хотя препарат применяется местно, он может абсорбироваться с развитием системных эффектов, поэтому возможно развитие побочных реакций, характерных для сульфаниламидов, в том числе таких тяжелых, как синдром Стивенса-Джонсона и токсический эпидермальный некролиз. Если появляются признаки серьезных побочных реакций или гиперчувствительности, следует немедленно прекратить применение препарата.

При длительном применении 2% офтальмологического раствора дорзоламид, возможно развитие местных побочных эффектов, главным образом, конъюнктивита и реакции со стороны век. Многие из этих реакций имели клинические проявления по типу аллергических и проходили после отмены препарата. При появлении таких реакций, препарат следует отменить и провести оценку состояния пациента перед возобновлением терапии.

Так как дорзоламид является ингибитором углекислой ангидразы и может оказывать системное действие, пациенты, имеющие в анамнезе мочекаменную болезнь, могут иметь повышенный риск уролитиаза, при применении препарата Дорсоб.

У пациентов, получающих пероральные ингибиторы углекислой ангидразы и дорзоламид может развиваться аддитивный системный эффект с угнетением углекислой ангидразы, поэтому не рекомендуется одновременное применение пероральных ингибиторов карбоангидразы и препарата Дорсоб.

У пациентов с хроническими дефектами роговицы и/или имеющих в анамнезе внутриглазные хирургические вмешательства, при применении дорзоламид отмечалось развитие отека и необратимых изменений роговицы. Следует с осторожностью применять препарат Дорсоб у таких пациентов.

После процедуры фильтрации с применением водных растворов супрессоров были зарегистрированы случаи отслойки сетчатки одновременно с гипотонией глаза.

В состав 2% офтальмологического раствора Дорсоб входит консервант бензалкония хлорид, который может абсорбироваться мягкими контактными линзами и оказывать повреждающее действие на ткани глаза. Поэтому пациентам, использующим мягкие контактные линзы, следует удалить их перед применением капель и установить обратно не ранее, чем через 15 мин после закапывания. Препарат может изменять цвет мягких контактных линз.

Применение в педиатрии

Раствор дорзоламид не применялся у плода (менее 36 недель гестации) и детей в возрасте менее 1 недели. Пациенты с незрелыми почечными канальцами, должны получать препарат Дорсоб, только после тщательного рассмотрения соотношения польза/риск в связи с возможным риском развития метаболического ацидоза. Лекарственный препарат, не рекомендуется детям младше 8 лет, ввиду отсутствия данных по безопасности и эффективности (опыт медицинского применения детей ограничен).

Применение при беременности и в период лактации

Потенциальный риск для человека неизвестен. Возможен тератогенный эффект. Не следует использовать во время беременности. Применение при беременности возможно, если ожидаемый эффект от терапии, превышает потенциальный риск для плода.

Неизвестно, попадает или нет дорзоламид в грудное молоко. В связи с отсутствием данных по безопасности, в период применения препарата кормящим женщинам следует прекратить грудное вскармливание.

Особенности влияния лекарственного средства на способность управлять транспортным средством или потенциально опасными механизмами

Госкоплекс препарат может вызывать головокружение и зрительные нарушения, в период лечения следует избегать потенциально опасных видов деятельности, связанных с необходимостью концентрации внимания и повышенной скоростью психомоторных реакций.

Передозировка

Имеются ограниченные информация по передозировке дорзоламид гидрохлорида у человека при случайном или преднамеренном приеме/применении.

Симптомы при пероральном приеме: сонливость.

Симптомы при местном применении: тошнота, головокружение, головная боль, усталость, нарушение сна, дисфаргия.

Лечение: симптоматическое и поддерживающее, необходим мониторинг уровня электролитов (особенно калия) в крови и контроль величины pH крови, контроль возможных эффектов со стороны центральной нервной системы. При случайной и преднамеренной передозировке следует обратиться к врачу.

Форма выпуска и упаковка

По 5 мл препарата помещают во флаконы из полиэтилена, укупоренные пробкой-капельницей и белой завинчивающейся крышкой из белого непрозрачного полиэтилена среднего давления с контролем первого вскрытия.

По 1 флакону вместе с инструкцией по медицинскому применению на государственном и русском языках помещают в пачку из картона.

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 30°С.

Хранить в недоступном для детей месте!

Срок хранения

2 года

Период применения после первого вскрытия флакона - 28 дней.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска из аптек

По рецепту

Производитель

FAMAR A.V.E.,
Агиус Димитриус 63,
Алимос, Атика, 17456, Греция

Упаковщик

FAMAR A.V.E.,
Агиус Димитриус 63,
Алимос, Атика, 17456, Греция

Держатель регистрационного удостоверения

Belinda Laboratories LLP
Юпитер Хаус 5, Парк Каппела, Олдермастон,
Рединг, RG7 8NN Беркшир, Великобритания

Наименование, адрес, контактные данные организации, принимающей на территории Республики Казахстан претензии (предложения) от потребителей по качеству лекарственного средства и ответственной за пострегистрационное наблюдение за безопасностью лекарственного средства:

ТОО «Cepheus Medical» (Цефей Медикал): 050000, Республика Казахстан, г. Алматы, ул. Панфилова 98, БЦ «OLD SQUARE»
телефон: +7 (727) 300 69 71, +7 777 175 00 99 (круглосуточно)
электронная почта: cepheusmedical@gmail.com