Дорзолан Экстра



Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр Википедия Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Форма выпуска, описание и состав

Капли глазные в виде прозрачной, бесцветной или почти бесцветной, слегка вязкой жидкости.

	1 мл
дорзоламида гидрохлорид	22.26 мг,
что соответствует содержанию дорзоламида	20 мг
тимолола малеат	6.83 мг,
что соответствует содержанию тимолола	5 мг

Вспомогательные вещества: натрия цитрата дигидрат - 2.94 мг, натрия гиалуронат - 1.8 мг, маннитол - 16 мг, натрия гидроксида раствор 1М - до pH 5.6, вода д/и - до 1 мл.

0.4 мл - тюбики-капельницы (5) - пакеты (2) - пачки картонные.
0.4 мл - тюбики-капельницы (5) - пакеты (4) - пачки картонные.
0.4 мл - тюбики-капельницы (5) - пакеты (6) - пачки картонные.
0.4 мл - тюбики-капельницы (5) - пакеты (12) - пачки картонные.
0.4 мл - тюбики-капельницы (5) - пакеты (18) - пачки картонные.
0.4 мл - тюбики-капельницы (10) - пакеты (1) - пачки картонные.
0.4 мл - тюбики-капельницы (10) - пакеты (2) - пачки картонные.
0.4 мл - тюбики-капельницы (10) - пакеты (3) - пачки картонные.
0.4 мл - тюбики-капельницы (10) - пакеты (6) - пачки картонные.
0.4 мл - тюбики-капельницы (10) - пакеты (9) - пачки картонные.
0.4 мл - тюбики-капельницы (10) - пачки картонные.
0.4 мл - тюбики-капельницы (20) - пачки картонные.
0.4 мл - тюбики-капельницы (30) - пачки картонные.
0.4 мл - тюбики-капельницы (60) - пачки картонные.
0.4 мл - тюбики-капельницы (90) - пачки картонные.
5 мл - флаконы (1) - пачки картонные.
7 мл - флаконы (1) - пачки картонные.
10 мл - флаконы (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Комбинированное противоглаукомное средство.

Дорзоламид - селективный ингибитор карбоангидразы II типа. Ингибирование карбоангидразы цилиарного тела приводит к снижению секреции внутриглазной жидкости, предположительно за счет уменьшения образования ионов гидрокарбоната, что в свою очередь приводит к замедлению транспорта натрия и внутриглазной жидкости.

Тимолол - неселективный бета-адреноблокатор. Хотя точный механизм действия тимолола в снижении внутриглазного давления до сих пор не установлен, ряд исследований показали преимущественное снижение образования внутриглазной жидкости, а также незначительное усиление ее оттока.

Совместное действие этих веществ в составе комбинированного лекарственного средства приводит к более выраженному снижению внутриглазного давления.

Снижение внутриглазного давления наступает через 20 мин после инстилляции, достигает максимума через 2 ч и продолжается не менее 24 ч.

Фармакокинетика

Дорзоламид проникает внутрь глаза преимущественно через роговицу (в меньшей степени через склеру или лимб). При местном применении дорзоламид проникает в системный кровоток. При длительном применении дорзоламид накапливается в эритроцитах в результате селективного связывания с карбоангидразой II типа, поддерживая чрезвычайно низкие концентрации свободного препарата в плазме. Связывание с белками плазмы - около 33%.

В результате метаболизма трансформируется в N-дезэтилированный метаболит, менее активный в отношении карбоангидразы II, но способный блокировать карбоангидразу I типа. Метаболит также накапливается в эритроцитах, где связывается главным образом с карбоангидразой I типа. Выводится почками в неизмененном виде и в виде метаболитов. После прекращения применения препарата дорзоламид нелинейно вымывается из эритроцитов, что сначала приводит к быстрому снижению его концентрации, затем выведение замедляется. $T_{1/2}$ составляет около 4 мес.

При приеме дорзоламида внутрь с целью моделирования максимального системного воздействия во время его местного применения, равновесного состояния удалось достичь через 13 недель. При этом в плазме крови практически не было обнаружено свободного дорзоламида или его метаболитов. Ингибирование карбоангидразы эритроцитов было недостаточным для того, чтобы достичь фармакологического действия на функцию почек и дыхания. Схожие фармакологические результаты наблюдались при длительном местном применении дорзоламида. Тем не менее, у некоторых пожилых пациентов с почечной недостаточностью (КК 30-60 мл/мин) были выявлены более высокие концентрации метаболита в эритроцитах, однако это не имело клинического значения.

При местном применении *тимолол* проникает в системный кровоток. Концентрация тимолола в плазме изучалась у 6 пациентов при местном применении тимолола в форме глазных капель 0.5% 2 раза/сут. Средняя C_{max} после применения утром составила 0.46 нг/мл, после применения днем - 0.35 нг/мл.

Показания к применению:

Повышенное внутриглазное давление при открытоугольной глаукоме и псевдоэксфолиативной глаукоме при недостаточной эффективности монотерапии.

Относится к болезням:

- Глаукома

Противопоказания:

Гиперреактивность дыхательных путей; бронхиальная астма (в т.ч. в анамнезе); тяжелая ХОБЛ; синусовая брадикардия; СССУ; синоатриальная блокада; АВ-блокада II-III степени; тяжелая сердечная недостаточность; кардиогенный шок; почечная недостаточность тяжелой степени (КК менее 30 мл/мин); гиперхлоремический ацидоз; дистрофические процессы в роговице; беременность; лактация (грудное вскармливание); детский и подростковый возраст до 18 лет; повышенная чувствительность к компонентам лекарственного средства.

С осторожностью

Сердечно-сосудистые заболеванияя в анамнезе, включая сердечную недостаточность, АВ-блокаду I степени; ХОБЛ легкой и средней степени тяжести; тяжелые нарушения периферического кровообращения (тяжелые формы болезни Рейно или синдрома Рейно); печеночная недостаточность; сахарный диабет; уролитиаз (в т.ч. в анамнезе); гипертиреоз; нарушения со стороны роговицы; пациенты пожилого возраста.

Способ применения и дозы:

Для местного применения. Закапывать по 1 капле в конъюнктивальный мешок глаза (или обоих глаз) 2 раза/сут.

В случае если препарат Дорзопт Плюс назначается в качестве замены другого офтальмологического препарата для

лечения глаукомы, последний необходимо отменить за 1 день до начала терапии препаратом Дорзопт Плюс.

В случае совместного применения с другими местными офтальмологическими препаратами введение препарата Дорзопт Плюс следует проводить с интервалом 10 мин.

При носослезной окклюзии (закрывании век) на 2 мин после закапывания препарата происходит снижение его системной абсорбции, что может привести к усилению местного действия.

Длительность лечения устанавливает врач в зависимости от клинического состояния пациента.

Побочное действие:

Известны следующие возможные нежелательные реакции действующих компонентов комбинации.

Дорзоламид

Со стороны нервной системы: головная боль, головокружение, астения/усталость, парестезии.

Со стороны органа зрения: воспаление века, слезотечение, раздражение и шелушение века, иридоциклит, точечный кератит, транзиторная миопия (проходящая после отмены препарата).

Аллергические реакции: ангионевротический отек, бронхоспазм, крапивница, зуд, сыпь.

Со стороны дыхательной системы: носовое кровотечение.

Тимолол (местное применение)

Нарушения психики: депрессия.

Со стороны иммунной системы: анафилаксия, ангионевротический отек, крапивница, локальная или генерализованная сыпь.

Со стороны нервной системы: звон в ушах, парестезии, головная боль, астения, усталость, головокружение, бессонница, ночные кошмары, снижение памяти, нарастание симптомов миастении.

Со стороны дыхательной системы: бронхоспазм (преимущественно у пациентов с предшествующей бронхообструктивной патологией), кашель, боль в груди.

Со стороны органа зрения: конъюнктивит, блефарит, кератит, снижение чувствительности роговицы, синдром сухого глаза; расстройства зрения, включающие изменения преломляющей способности глаза (в ряде случаев из-за отмены миотиков), диплопия, птоз.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: аритмия, остановка сердца, снижение АД, обморок, синдром Рейно, снижение температуры рук и ног.

Со стороны пищеварительной системы: диарея, диспепсия, сухость во рту, раздражение глотки, боль в животе.

Со стороны кожи и подкожных тканей: алопеция, псориазоподобная сыпь или обострение псориаза.

Со стороны костно-мышечной системы и соединительной ткани: хромота, системная красная волчанка.

Со стороны половой системы: снижение либидо, болезнь Пейрони.

Общие расстройства и нарушения в месте введения: отеки.

В пострегистрационный период при применении *комбинации дорзоламид+тимолол* отмечались следующие нежелательные реакции: одышка, дыхательная недостаточность, брадикардия, AV-блокада, отслойка хориоидальной оболочки глаза, тошнота, контактный дерматит, синдром Стивенса-Джонсона и токсический эпидермальный некролиз. Зарегистрированы случаи отека и необратимого разрушения роговицы у пациентов с хроническими дефектами роговицы и/или перенесших внутриглазную хирургическую операцию.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказано применение при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Существует возможность усиления гипотензивного эффекта и/или развития выраженной брадикардии при совместном применении офтальмологического раствора тимолола и блокаторов медленных кальциевых каналов, симпатолитиков, бета-адреноблокаторов, антиаритмических средств (включая амиодарон), сердечных гликозидов, парасимпатомиметиков, опиоидных анальгетиков и ингибиторов МАО.

При совместном применении тимолола и ингибиторов изофермента CYP2D6 (например, хинидин или селективные ингибиторы обратного захвата серотонина) сообщалось о потенцированном эффекте системной блокады β-адренорецепторов (например, снижение ЧСС, депрессия).

Системные бета-адреноблокаторы могут усиливать действие гипогликемических препаратов.

Системные бета-адреноблокаторы могут усилить выраженность артериальной гипертензии, являющейся эффектом отмены клонидина.

Имеются единичные данные о развитии мидриаза при совместном применении тимолола и адреналина.

Существует вероятность усиления, известных системных эффектов ингибирования карбоангидразы при комбинированном применении местных и системных ингибиторов карбоангидразы.

Особые указания и меры предосторожности:

Компоненты комбинированного лекарственного средства могут проникать в системный кровоток. Поскольку тимолол является бета-адреноблокатором, нежелательные реакции, развивающиеся при системном применении бета-адреноблокаторов, могут отмечаться при местном применении данной комбинации.

Перед началом применения необходимо обеспечить адекватный контроль состояния сердечно-сосудистой системы.

Пациенты с сердечно-сосудистыми заболеваниями в анамнезе, включая сердечную недостаточность, должны находиться под тщательным наблюдением на предмет появления признаков ухудшения этих заболеваний (контроль ЧСС и АД).

Зарегистрированы сообщения о случаях сердечной недостаточности с летальным исходом на фоне применения тимолола в виде глазных капель.

При появлении первых признаков или симптомов сердечной недостаточности применение данного лекарственного средства необходимо прекратить.

Пациентам с блокадой сердца I степени следует назначать бета-адреноблокаторы с осторожностью вследствие их способности замедлять проведение импульса.

Зарегистрированы сообщения о случаях бронхоспазма с летальным исходом у пациентов с бронхиальной астмой на фоне применения тимолола в виде глазных капель.

У пациентов с ХОБЛ легкой и средней степени тяжести т применять с осторожностью и только в случае, если предполагаемая польза от лечения превышает потенциальный риск.

Препарат необходимо применять с осторожностью у пациентов с тяжелыми нарушениями периферического кровообращения (тяжелые формы болезни или синдрома Рейно).

С осторожностью применять у пациентов со спонтанной гипогликемией или у пациентов с сахарным диабетом (особенно с лабильным течением) на фоне применения инсулина или пероральных гипогликемических препаратов, поскольку бета-адреноблокаторы могут маскировать симптомы гипогликемии.

Бета-адреноблокаторы могут маскировать некоторые клинические признаки гипертиреоза (например, тахикардию). При подозрении на развитие гипертиреоза пациенты должны находиться под тщательным наблюдением. Необходимо избегать резкой отмены бета-адреноблокаторов из-за риска развития тиреотоксического криза.

Дорзоламид является сульфаниламидом. Нежелательные реакции, выявленные при системном применении сульфаниламидов, могут отмечаться при местном применении (синдром Стивенса-Джонсона и токсический эпидермальный некролиз). При появлении признаков серьезных реакций гиперчувствительности применения лекарственного средства необходимо прекратить.

При лечении бета-адреноблокаторами пациентов с атопией или тяжелыми анафилактическими реакциями на различные аллергены в анамнезе возможно усиление ответа при повторном контакте с этими аллергенами. В этой группе пациентов применение эпинефрина в стандартной терапевтической дозе для купирования аллергических реакций может оказаться неэффективным.

При применении у пациентов, принимающих системные бета-адреноблокаторы, необходимо учитывать возможное взаимное усиление фармакологического действия препаратов как в отношении известных системных эффектов бета-адреноблокаторов, так и в отношении снижения внутриглазного давления. Совместное применение с другими бета-адреноблокаторами не рекомендуется.

При необходимости отмены местного применения тимолола, как и в случае отмены системных бета-адреноблокаторов, прекращение терапии у пациентов с ИБС необходимо проводить постепенно.

Применяемые в офтальмологии бета-адреноблокаторы могут вызвать сухость слизистой глаза. У пациентов с нарушениями со стороны роговицы препарат следует применять с осторожностью. У пациентов с низким количеством эндотелиальных клеток имеется повышенный риск развития отека роговицы.

Применение системных ингибиторов карбоангидразы может приводить к нарушению кислотно-щелочного равновесия и сопровождаться уролитиазом, особенно у пациентов с мочекаменной болезнью в анамнезе.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и механизмами

В период применения необходимо воздержаться от управления транспортными средствами и механизмами и занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Источник: http://drugs.thead.ru/Dorzolan_Ekstra