Дорзопт Плюс



Код АТХ:

- S01EX

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Дорзоламид
- Тимолол

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Капли глазные в виде прозрачного, бесцветного или почти бесцветного, слегка вязкого раствора.

	1 мл
дорзоламида гидрохлорид	22.26 мг,
что соответствует содержанию дорзоламида	20 мг
тимолола малеат	6.84 мг,
что соответствует содержанию тимолола	5 мг

Вспомогательные вещества: гиэтиллоза - 1 мг, лимонной кислоты моногидрат - 4 мг, натрия гидроксида раствор 1М - 0.066 мл, маннитол - 20 мг, бензалкония хлорид - 0.075 мг, натрия гидроксид раствор 1М/кислоты хлористоводородной раствор 1М - до pH 5.6±0.1, вода очищенная - до 1 мл.

5 мл - флакон-капельницы полимерные (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Вегетотропные средства
- Метаболики
- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противоглаукомный препарат, содержит два активных компонента: дорзоламид и тимолол, каждый из которых уменьшает повышенное внутриглазное давление за счет снижения секреции внутриглазной жидкости. Совместное действие этих веществ в составе комбинированного препарата Дорзопт Плюс приводит к более выраженному снижению внутриглазного давления.

Дорзоламид - селективный ингибитор карбоангидразы II типа. Ингибирование карбоангидразы цилиарного тела приводит к снижению секреции внутриглазной жидкости, предположительно за счет уменьшения образования гидрокарбонат-ионов, 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.

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

Фармакокинетика

Дорзоламид

Всасывание и распределение

Проникает внутрь глаза преимущественно через роговицу (в меньшей степени через склеру или лимб). Системная абсорбция - низкая. После попадания в кровь быстро проникает в эритроциты, содержащие значительное количество карбоангидразы II. Связывание с белками плазмы - 33%.

Метаболизм и выведение

Трансформируется в N-дезэтилированный метаболит, менее активный в отношении карбоангидразы II, но способный блокировать карбоангидразу I. При длительном применении накапливается в эритроцитах. Выводится почками в неизмененном виде и в виде метаболитов. После отмены быстрая фаза выведения сменяется медленной, обусловленной постепенным высвобождением дорзоламида из эритроцитов, с $T_{1/2}$ около 4 мес.

Тимолол

При местном применении тимолола 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 утреннего применения составила 0.46 нг/мл, после применения днем - 0.35 нг/мл.

Показания к применению:

Повышенное внутриглазное давление при:

— открытоугольной глаукоме;

— псевдоэксфолиативной глаукоме.

Относится к болезням:

- Глаукома

Противопоказания:

— бронхиальная астма (в т.ч. в анамнезе);

— тяжелая хроническая обструктивная болезнь легких (ХОБЛ);

— синусовая брадикардия;

— AV-блокада II и III степени;

— тяжелая сердечная недостаточность;

— кардиогенный шок;

— почечная недостаточность тяжелой степени (КК менее 30 мл/мин);

— дистрофические процессы в роговице;

— беременность;

— лактация (грудное вскармливание);

— детский и подростковый возраст до 18 лет (т.к. эффективность и безопасность изучены недостаточно);

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью:* печеночная недостаточность, пожилой возраст, сахарный диабет.

Способ применения и дозы:

Закапывают по 1 капле в конъюнктивальный мешок 2 раза/сут.

Если при лечении применяется несколько местных офтальмологических лекарственных средств, то их введение должно происходить с интервалом в 10 мин.

Длительность лечения устанавливает врач в зависимости от клинического состояния пациента.

Побочное действие:

Дорзоламид

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

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: головная боль, астения/усталость, парестезии.

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

Прочие: носовое кровотечение, раздражение глотки, сухость во рту, сыпь.

Тимолол

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 ЦНС и периферической нервной системы: звон в ушах, парестезии, головная боль, астения, усталость, головокружение, депрессия, бессонница, ночные кошмары, снижение памяти, нарастание симптомов миастении.

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

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

Дерматологические реакции: алопеция, псориазоподобная сыпь или обострение псориаза.

Аллергические реакции: анафилаксия, ангионевротический отек, крапивница, локальная или генерализованная сыпь.

Со стороны пищеварительной системы: диарея, диспепсия, сухость во рту.

Прочие: снижение либидо, болезнь Пейрони, системная красная волчанка.

Передозировка:

Симптомы неумышленной передозировки тимолола в форме глазных капель с развитием системных эффектов передозировки бета-адреноблокаторов для системного применения: головокружение, головная боль, одышка, брадикардия, бронхоспазм, остановка сердца.

Наиболее ожидаемыми симптомами передозировки дорзоламида являются нарушение электролитного баланса,

развитие ацидоза, головная боль, астения/усталость, парестезия.

Лечение: проводят симптоматическую и поддерживающую терапию. Следует контролировать концентрацию электролитов (прежде всего натрия) и pH плазмы крови. В исследованиях также показано, что тимолол не выводится при диализе.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат Дорзопт Плюс противопоказан к применению при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Исследований взаимодействия Дорзопт Плюс с другими лекарственными средствами не проводилось.

Тем не менее, 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).

Несмотря на то, что входящий в состав Дорзопт Плюс ингибитор карбоангидразы дорзоламид используется местно, он может проникать в системный кровоток. В клинических исследованиях применения офтальмологического раствора дорзоламида не было выявлено расстройств кислотно-щелочного равновесия. Тем не менее, при системном применении ингибиторов карбоангидразы эти расстройства известны, и в ряде случаев они могут сказываться на взаимодействии с другими лекарственными средствами (например, усиливать токсические реакции при применении салицилатов в высоких дозах).

Существует вероятность усиления, известных системных эффектов ингибирования карбоангидразы при комбинированном применении местных и системных ингибиторов карбоангидразы. Т.к. данные о применении подобной комбинации отсутствуют, совместное применение Дорзопт Плюс и системных ингибиторов карбоангидразы не рекомендуется.

Особые указания и меры предосторожности:

Перед началом применения препарата Дорзопт Плюс необходимо обеспечить адекватный контроль состояния сердечно-сосудистой системы. Пациенты с тяжелой патологией сердца в анамнезе и признаками сердечной недостаточности должны находиться под тщательным наблюдением.

Дорзопт Плюс содержит консервант бензалкония хлорид, который может осаждаться в мягких контактных линзах и оказывать повреждающее действие на ткани глаза. Поэтому пациентам, носящим мягкие контактные линзы, следует удалить их перед применением капель и установить обратно не ранее, чем через 20 мин после закапывания.

С осторожностью назначают препарат пациентам с сахарным диабетом, поскольку бета-адреноблокаторы могут маскировать симптомы острой гипогликемии.

Перед плановой хирургической операцией следует постепенно отменить препарат за 48 ч до общей анестезии, т.к. бета-адреноблокаторы усиливают действие миорелаксантов и средств для общей анестезии.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения необходимо воздержаться от вождения автотранспорта и занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Противопоказан при почечной недостаточности тяжелой степени (КК менее 30 мл/мин);

При нарушениях функции печени

С осторожностью при печеночной недостаточности.

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью в пожилом возрасте.

Применение в детском возрасте

Противопоказан детям до 18 лет.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей, сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25°С.

После вскрытия флакона капли следует использовать в течение 4 недель.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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