Косопт



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 прозрачной, бесцветной или почти бесцветной, слегка вязкой жидкости.

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

Вспомогательные вещества: бензалкония хлорид (в виде 50% раствора бензалкония хлорида) - 0.075 мг (0.15 мг), натрия цитрат - 2.94 мг, маннитол - 16 мг, гиэтеллоза (гидроксиэтилцеллюлоза) - 4.75 мг, 1М раствор натрия гидроксида - q.s. до pH 5.6, вода д/и - q.s. до 1 мл.

5 мл - флаконы пластиковые типа "Окуметер Плюс" (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противоглаукомный препарат комбинированного состава. Содержит два активных компонента: дорзоламида гидрохлорид и тимолола малеат, каждый из которых уменьшает повышенное внутриглазное давление за счет снижения секреции внутриглазной жидкости. Совместное действие этих веществ в составе препарата приводит к более выраженному снижению внутриглазного давления.

Дорзоламида гидрохлорид является селективным ингибитором карбоангидразы II типа. Ингибирование

карбоангидразы цилиарного тела приводит к снижению секреции внутриглазной жидкости, предположительно за счет уменьшения образования бикарбонатных ионов, что в свою очередь приводит к замедлению транспорта натрия и жидкости.

Тимолола малеат является неселективным бета-адреноблокатором. Хотя точный механизм действия тимолола малеата в снижении внутриглазного давления до сих пор не установлен, ряд исследований показали преимущественное снижение образования, а также незначительное усиление оттока жидкости.

Фармакокинетика

Дорзоламида гидрохлорид

При местном применении дорзоламид проникает в системный кровоток. При длительном применении дорзоламид накапливается в эритроцитах в результате селективного связывания с карбоангидразой IIтипа, поддерживая чрезвычайно низкие концентрации свободного препарата в плазме. В результате метаболизма дорзоламида образуется единственный N -десэтильный метаболит, который менее выраженно блокирует карбоангидразу II типа по сравнению с начальной его формой, однако в то же время ингибирует карбоангидразу I типа - менее активный изоэнзим. Метаболит также накапливается в эритроцитах, где связывается главным образом с карбоангидразой I типа.
Около 33% дорзоламида связывается с белками плазмы крови. Дорзоламид выводится с мочой в неизмененном виде и в виде метаболита. После прекращения применения препарата дорзоламид нелинейно вымывается из эритроцитов, что сначала приводит к быстрому снижению его концентрации, а затем элиминация замедляется. T1/2 составляет около 4 месяцев.

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

Тимолола малеат

При местном применении тимолола малеат проникает в системный кровоток. Концентрация тимолола в плазме изучалась у 6 пациентов при местном применении глазных капель тимолола малеата 0,5% дважды в день. Средняя пиковая концентрация после утренней дозировки составила 0,46 нг/мл, после дневной дозировки - 0,35 нг/мл. Гипотензивный эффект наступает через 20 минут после инстилляции, достигает максимума через 2 часа и продолжается не менее 24 часов.

Показания к применению:

Повышенное внутриглазное давление:

— при открытоугольной глаукоме;

— при псевдоэксфолиативной глаукоме.

Относится к болезням:

- Глаукома

Противопоказания:

— бронхиальная астма, бронхиальная астма в анамнезе, тяжелая ХОБЛ;

— синусовая брадикардия, AV-блокада II и III степени, выраженная сердечная недостаточность, кардиогенный шок;

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

— дистрофические процессы в роговице;

— беременность;

— период лактации (грудного вскармливания);

— детский и подростковый возраст до 18 лет (в связи с недостатком данных по эффективности и безопасности);

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

Способ применения и дозы:

Косопт назначают по 1 капле в конъюнктивальный мешок пораженного глаза (или обоих глаз) 2 раза/сут.

В случае если Косопт назначают в качестве замены другого офтальмологического препарата для лечения глаукомы, последний следует отменить за день до начала терапии Косоптом.

В случае совместного использования с другим местным офтальмологическим препаратом, Косопт следует назначать с интервалом не менее 10 мин.

Правила использования препарата

Косопт представляет собой стерильный раствор, поэтому пациенты должны быть проинструктированы, как правильно пользоваться флаконом.

1. Перед первым использованием препарата необходимо удостовериться, что защитная полоска снаружи флакона не повреждена. У невскрытых флаконов может иметься зазор между флаконом и колпачком.

2. Следует удалить защитную полоску для того, чтобы открыть колпачок.

3. Чтобы открыть флакон, необходимо открутить колпачок, поворачивая его по направлению указательных стрелок на верхней поверхности колпачка.

4. Наклонить голову назад и слегка оттянуть нижнее веко вниз для появления пространства между веком и глазом.

5. Перевернуть флакон, большим или указательным пальцем слегка нажать в месте специально обозначенном на флаконе так, чтобы одна капля попала в глаз. Нельзя касаться поверхности глаза или века наконечником флакона. При неправильном использовании, флакон может инфицироваться и стать причиной серьезных инфекционных повреждений глаза и последующей потери зрения.

6. Повторить пункты 4 и 5 для другого глаза, если это необходимо.

7. Закрыть флакон колпачком, закрутив его до плотного соприкосновения с флаконом. Не следует нажимать на крышку слишком сильно, иначе можно повредить флакон или крышку.

8. Не следует увеличивать отверстие специально разработанного дозаторного наконечника.

Побочное действие:

Косопт в целом хорошо переносится. В клинических исследованиях побочных эффектов, свойственных исключительно этому комбинированному препарату, не наблюдалось. Побочные реакции ограничивались уже известными побочными эффектами дорзоламида гидрохлорида и/или тимолола малеата. В целом системные побочные эффекты были слабо выражены и не приводили к отмене препарата.

В клинических исследованиях Косопт назначался 1035 пациентам. Около 2.4% пациентов препарат был отменен в связи с местными побочными реакциями со стороны глаза. Приблизительно 1.2% пациентов препарат был отменен из-за местных побочных реакций по типу гиперчувствительности или аллергии.

Наиболее часто наблюдались побочные эффекты со стороны органа зрения: чувство жжения или зуда в глазу, искажение вкуса, эрозии роговицы, инъекции конъюнктивы, нечеткость зрения, слезотечение.

Ниже приведены возможные побочные эффекты компонентов препарата.

Дорзоламида гидрохлорид

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

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

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

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

Тимолола малеат (местное применение)

Со стороны органа зрения: конъюнктивит, блефарит, кератит, снижение чувствительности роговицы, сухость;

расстройства зрения, включающие изменения преломляющей способности глаза (в ряде случаев из-за отмены миотиков), диплопия, птоз.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: звон в ушах, аритмия, гипотензия, обморок, сердечно-сосудистые нарушения, нарушения ритма, остановка сердца, отеки, хромота, парестезии, феномен Рейно, снижение температуры рук и ног.

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

Дерматологические реакции: алопеция, псориазоподобные высыпания или обострение псориаза.

Аллергические реакции: анафилаксия, ангионевротический отек, крапивница, локальные или генерализованные высыпания.

Со стороны ЦНС: головокружение; депрессия, бессонница, кошмарные сновидения, снижение памяти, нарастание симптомов миастении.

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

Со стороны организма в целом: головная боль, астения, усталость, боль в груди, снижение либидо, болезнь Пейрони, системная красная волчанка.

Передозировка:

Данные по случайной или преднамеренной передозировке Косопта отсутствуют.

Симптомы: описаны случаи неумышленной передозировки глазных капель, содержащих **тимолола малеат**, с развитием системных эффектов передозировки бета-адреноблокаторов, принимаемых внутрь: головокружение, головная боль, одышка, брадикардия, бронхоспазм, остановка сердца.

Наиболее ожидаемыми симптомами передозировки **дорзоламида** являются нарушение электролитного баланса, развитие ацидоза, возможные побочные эффекты со стороны ЦНС.

Лечение: проведение симптоматической и поддерживающей терапии. Следует контролировать уровень электролитов (прежде всего натрия) и pH плазмы крови. В исследованиях также показано, что тимолол не удаляется при диализе.

Применение при беременности и кормлении грудью:

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

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Специфических исследований взаимодействия препарата Косопт с другими лекарственными средствами не проводилось.

Тем не менее, существует возможность усиления гипотензивного эффекта и/или выраженной брадикардии при совместном применении глазных капель тимолола малеата и системных блокаторов кальциевых каналов, катехоламин-истощающих средств, β-адреноблокаторов, антиаритмических средств (включая амиодарон), гликозидов наперстянки, парасимпатомиметиков, опиоидных анальгетиков и ингибиторов МАО.

Потенцированный эффект системной блокады бета-адренорецепторов (например, уменьшение ЧСС, депрессия) сообщался при совместном использовании тимолола и ингибиторов CYP2D6 (например, хинидин или селективные ингибиторы обратного захвата серотонина).

Вследствие этого, возможность подобного взаимодействия необходимо принимать во внимание у пациентов, получающих Косопт.

Несмотря на то, что при монотерапии Косоптом эффект на зрачок минимален или отсутствует, существуют единичные описания развития мидриаза при совместном применении тимолола малеата и адреналина.

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 Косопта и системных ингибиторов, карбоангидразы не рекомендуется.

Особые указания и меры предосторожности:

49% пациентов в клинических исследованиях были в возрасте 65 лет и старше, 13% пациентов - в возрасте 75 лет и старше. Разницы в эффективности и безопасности препарата в этих возрастных группах по сравнению с более молодыми пациентами не было. Тем не менее, не следует исключать возможности более высокой чувствительности к препарату у некоторых пожилых пациентов.

Активные вещества препарата Косопт могут абсорбироваться в системный кровоток. Входящий в состав препарата тимолол является бета-адреноблокатором, таким образом побочные реакции, известные при системном применении бета-адреноблокаторов, могут отмечаться при местном применении препарата, в т.ч. обострение вазоспастической стенокардии (стенокардии Принцметала), нарушения периферического и центрального кровообращения, артериальная гипотензия.

Необходим адекватный контроль сердечной недостаточности перед началом лечения Косоптом. Пациенты с тяжелой патологией сердца в анамнезе и признаками сердечной недостаточности должны находиться под тщательным наблюдением, необходимо следить за ЧСС у таких пациентов.

При появлении первых признаков или симптомов сердечной недостаточности использование Косопта следует прекратить.

Зарегистрированы сообщения о смерти в результате бронхоспазма у пациентов с бронхиальной астмой и сердечной недостаточностью на фоне применения глазных капель, содержащих тимолола малеат.

Не проводилось исследований применения Косопта у пациентов с печеночной недостаточностью, в связи с чем препарат у таких пациентов следует применять с осторожностью.

Применение системных ингибиторов карбоангидразы может приводить к нарушению КЩР и сопровождаться уролитиазом, особенно у пациентов с мочекаменной болезнью в анамнезе. Во время применения Косопта подобных нарушений не наблюдалось, сообщения об уролитиазе были редкими. Т.к. в состав Косопта входит ингибитор карбоангидразы, который при местном применении может абсорбироваться и проникать в системный кровоток, то риск развития уролитиаза у пациентов с мочекаменной болезнью в анамнезе может повышаться при лечении Косоптом.

Терапия бета-адреноблокаторами может искажать некоторые симптомы гипогликемии у пациентов с сахарным диабетом или гипогликемией.

Бета-адреноблокаторы могут сглаживать течение гипертиреоза. Прекращение приема бета-адреноблокаторов может быть причиной ухудшения состояния.

В случае предстоящего оперативного вмешательства под общей анестезией, необходимо отменить препарат за 48 ч до операции, т.к. тимолол усиливает действие миорелаксантов и общих анестетиков.

В состав Косопта входит консервант бензалкония хлорид, который может быть причиной возникновения раздражения глаза. Линзы следует вынуть перед закапыванием препарата и подождать в течение не менее 15 мин после закапывания перед тем, как вновь их надеть. Бензалкония хлорид способен обесцвечивать мягкие контактные линзы.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

При применении Косопта возможно развитие побочных эффектов, которые у некоторых пациентов могут затруднять управление автомобилем или работу со сложными механизмами.

При нарушениях функции почек

Противопоказание: почечная недостаточность тяжелой степени (КК < 30 мл/мин).

При нарушениях функции печени

Не проводилось исследований применения Косопта у пациентов с печеночной недостаточностью, в связи с чем препарат у таких пациентов следует применять с осторожностью.

Применение в пожилом возрасте

49% пациентов в клинических исследованиях были в возрасте 65 лет и старше, 13% пациентов - в возрасте 75 лет и старше. Разницы в эффективности и безопасности препарата в этих возрастных группах по сравнению с более молодыми пациентами не было. Тем не менее, не следует исключать возможности более высокой чувствительности к препарату у некоторых пожилых пациентов.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет.

Условия хранения:

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

После первого вскрытия флакона препарат не следует использовать более 4 недель.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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