

Состав

действующее вещество: дорзоламид;

1 мл раствора содержит 20 мг дорзоламидом (в виде дорзоламидом гидрохлорида);

вспомогательные вещества: маннит (Е 421), бензалкония хлорид, гидроксиэтилцеллюлоза, натрия, натрия гидроксид, вода для инъекций.

Лекарственная форма

Капли глазные, раствор.

Основные физико-химические свойства: прозрачный, слегка вязкий, бесцветный водный раствор.

Фармакотерапевтическая группа

Противоглаукомные препараты и миотические средства. Ингибиторы карбоангидразы. Дорзоламид. Код АТХ S01E C03.

Фармакодинамика

Препарат Резлод содержит дорзоламидом гидрохлорид - сильный ингибитор карбоангидразы ИИ (СА-II) человека. После местного офтальмологического применения дорзоламид уменьшает повышенное внутриглазное давление, связанное или не связан с глаукомой, который является главным фактором риска в патогенезе повреждения зрительного нерва и сужении поля зрения. Дорзоламид не вызывает сужение зрачка и уменьшает внутриглазное давление без развития таких побочных реакций как ночная слепота и аккомодационный спазм. Дорзоламид проявляет минимальное влияние или не влияет на частоту сердечных сокращений или артериальное давление.

Поскольку механизм действия дорзоламидом отличается от механизма действия блокаторов бета-адренорецепторов, при его применении в такой комбинации как сопутствующей терапии наблюдается синергическое действие обоих компонентов, сопровождается дополнительным уменьшением внутриглазного давления.

Фармакокинетика

В отличие от пероральных препаратов ингибиторов карбоангидразы, дорзоламидом гидрохлорид при местном применении действует непосредственно в глазу при существенно меньших дозах, и поэтому такое применение сопровождается менее выраженной системной действием. В клинических исследованиях это приводило к уменьшению внутриглазного давления без сопутствующих расстройств кислотно-щелочного баланса или изменения параметров электролитов, присущие пероральным препаратам ингибиторов карбоангидразы.

При местном применении дорзоламид достигает системного кровотока. Для оценки потенциала системного ингибирования карбоангидразы после местного применения измеряли концентрации дорзоламидом и его метаболитов в эритроцитах и плазме крови, а также ингибирование карбоангидразы в эритроцитах.

При длительном применении дорзоламид аккумулируется в эритроцитах в результате селективного связывания с СА-II, в то время как в плазме крови поддерживаются очень низкие концентрации свободной действующего вещества. Дорзоламид образует один N-дезетильзований метаболит, который ингибирует СА-II меньшей степени, чем начальная соединение, но также ингибирует менее активный изофермент СА-I. Метаболит также аккумулируется в эритроцитах, где он связывается преимущественно с СА-I. Дорзоламид умеренно связывается с белками плазмы (около 33%) и выводится с мочой (преимущественно в неизмененном виде), как и его метаболит. После отмены происходит нелинейное вымывания дорзоламидом из эритроцитов, что сначала приводит к быстрому снижению концентрации дорзоламидом, после чего наступает медленнее фаза вывода с периодом полувыведения составляет примерно 4 месяца.

При пероральном приеме, который моделировал максимальную системное действие дорзоламидом после длительного местного офтальмологического применения, равновесное состояние достигалось в пределах 13 недель. В равновесном состоянии в плазме крови практически не было обнаружено ни свободной действующего вещества, ни метаболита; ингибирования СА в эритроцитах было меньше, чем считается необходимым для фармакологического воздействия на функцию почек или дыхания. Подобные фармакокинетические результаты наблюдались после длительного местного применения дорзоламидом.

Однако у некоторых пациентов пожилого возраста с поврежденной функцией почек (установлен клиренс креатинина 30 - 60 мл/мин) концентрации метаболита в эритроцитах были выше, хотя это не сопровождалось существенными различиями в подавлении карбоангидразы; клинически

значимых системных побочных реакций, непосредственно связанных с этими явлениями, не наблюдалось.

Показания

Препарат Резлод показан:

- для монотерапии пациентов с повышенным внутриглазным давлением, которым противопоказано применение блокаторов бета-адренорецепторов, или при отсутствии ответа на терапию блокаторами бета-адренорецепторов при лечении:
- внутриглазной гипертензии;
- открытоугольной глаукомы;
- псевдоэксфолиативным глаукомы;
- как вспомогательная терапия при применении блокаторов бета-адренорецепторов.

Противопоказания

Гиперчувствительность к действующему веществу или к любым вспомогательным веществам препарата.

У пациентов с тяжелым поражением почек (клиренс креатинина <30 мл/мин) или с гиперхлоремическим ацидозом применения дорзоламидом не изучались. Поскольку дорзоламид и его метаболиты выводятся преимущественно почками, таким пациентам противопоказано применение препарата.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Специальных исследований лекарственных взаимодействий препарата не проводилось.

В клинических исследованиях дорзоламид применяли одновременно с указанными ниже лекарственными препаратами, не сопровождалось развитием побочных взаимодействий: глазные капли тимолола или бетаксолола и лекарственные средства системного действия, такие как АПФ-ингибиторы, антагонисты кальция, диуретики, нестероидные противовоспалительные препараты, включая ацетилсалициловую кислоту, и гормоны (например эстроген, инсулин, тироксин).

Взаимодействия между дорзоламидом и миотиками или агонистами адренорецепторов при Противоглаукомные терапии полностью не изучены.

Особенности применения

У пациентов с поражением функции печени применение дорзоламидом не изучались, поэтому при лечении таких пациентов препарат следует применять с осторожностью.

Лечение пациентов с острым приступом закрытоугольной глаукомы требует терапевтического вмешательства в дополнение к терапии офтальмологическими гипотензивными препаратами. У пациентов с острым приступом закрытоугольной глаукомы применения дорзоламидом не изучались.

Дорзоламид содержит сульфонамидную группу, которая также содержится в сульфаниламидах, и поэтому он абсорбируется в системный кровоток даже при местном применении. Благодаря этому при местном применении препарата могут наблюдаться такие же типы побочных реакций, присущих сульфаниламидам, включая серьезные реакции, такие как синдром Стивенса - Джонсона и токсический эпидермальный некролиз. При появлении признаков серьезных реакций или реакций гиперчувствительности применение препарата следует прекратить.

Терапия пероральными препаратами ингибиторов карбоангидразы, особенно у пациентов с конкрементами мочевыводящих путей в анамнезе, приводила к развитию мочекаменной болезни вследствие расстройств кислотно-щелочного баланса. Хотя при применении дорзоламидом расстройств кислотно-щелочного баланса не наблюдалось, существуют отдельные сообщения о случаях мочекаменной болезни у пациентов, принимающих такое лечение. Поскольку дорзоламид является местным ингибитором карбоангидразы, который абсорбируется в системный кровоток у пациентов с конкрементами мочевыводящих путей в анамнезе при применении дорзоламидом может повышаться риск развития мочекаменной болезни.

Если наблюдаются аллергические реакции (например конъюнктивит или реакции со стороны век), следует рассмотреть целесообразность прекращения лечения.

Поскольку при одновременном применении пероральных препаратов ингибиторов карбоангидразы и дорзоламидом существует вероятность синергетического влияния на известные системные эффекты ингибирования карбоангидразы, такое применение не рекомендуется.

Сообщалось о случаях отека роговицы и необратимой декомпенсации роговицы при применении препарата у пациентов с уже существующими хроническими дефектами роговицы и / или с историей офтальмологических хирургических

вмешательств. Поэтому таким пациентам местные препараты дорзоламидом следует применять с осторожностью.

Имеются сообщения о случаях отслойки сосудистой оболочки глаза с одновременной внутриглазной гипотонией при назначении водных супрессантов после процедур фильтрации.

Препарат содержит консервант бензалкония хлорид, который может вызвать раздражение и обесцвечивать мягкие контактные линзы, поэтому контактные линзы следует снимать перед закапыванием препарата и повторно вставлять их не раньше, чем через 15 минут после применения.

Сообщалось, что бензалкония хлорид вызывает раздражение глаз, симптомы синдрома «сухого глаза» и может поражать слезную пленку и поверхность роговицы. Поэтому препарат следует с осторожностью назначать больным синдромом «сухого глаза» и пациентам с вероятностью повреждения роговицы.

Во время длительного применения препарата пациенты должны находиться под контролем.

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

Исследований о влиянии препарата на способность пациентов управлять автомобилем и работать с механизмами не проводили. Возможные побочные реакции, такие как головокружение и нарушение зрения, могут влиять на способность пациентов управлять автомобилем и работать с механизмами.

Применение в период беременности или кормления грудью

Беременность.

Препараты дорзоламидом не следует применять в период беременности. Адекватных клинических данных о применении препарата в период беременности нет. У кроликов дорзоламид вызывал тератогенные эффекты при введении в дозах, токсичных для матери.

Кормления грудью.

Неизвестно, проникает дорзоламид в грудное молоко. У крыс в период лактации наблюдалось уменьшение наращивания массы тела приплода. В случае необходимости лечение дорзоламидом кормления грудью не рекомендуется.

Способ применения и дозы

При применении в качестве монотерапии закапывают по 1 капле препарата в конъюнктивальный мешок пораженного глаза три раза в сутки.

При применении в качестве вспомогательной терапии в сочетании с офтальмологическими препаратами блокаторов бета-адренорецепторов закапывают по 1 капле препарата в конъюнктивальный мешок пораженного глаза дважды в сутки.

Если препарат назначается на замену другому офтальмологическому Противоглаукомным средствам, применение препарата Резлод следует начинать на следующий день после последнего применения предыдущего препарата.

При применении нескольких местных офтальмологических препаратов их следует закапывать по меньшей мере с 10-минутным интервалом.

Перед применением препарата необходимо вымыть руки, а при закапывании глазных капель следует избегать любого контакта наконечника капельницы с глазом или кожей.

Пациентов следует проинформировать о правильном обращении с офтальмологическими флаконами-капельницами.

Пациентов также следует проинформировать, что при ненадлежащем обращении глазные капли могут контаминироваться распространенными бактериями, которые вызывают инфекционные заболевания глаз. Применение контаминированных растворов может привести к серьезному поражению глаз с последующей потерей зрения.

Дети

Поскольку клинические данные по лечению детей глазными каплями дорзоламидом ограничены, такое применение не рекомендуется.

Передозировка

Существует лишь ограниченная информация по случайной передозировке или преднамеренного глотания глазных капель дорзоламидом. Сообщалось о развитии таких симптомов передозировки: при глотании внутрь - сонливость при местном применении - тошнота, головокружение, головная боль, слабость, расстройства сна и дисфагия.

При передозировке следует проводить симптоматическое и поддерживающее лечение. При передозировке могут наблюдаться электролитный дисбаланс, развитие ацидоза и возможные реакции со стороны центральной нервной

системы. При передозировке следует контролировать сывороточные уровни электролитов (в частности калия) и уровень pH крови.

Побочные реакции

Самой распространенной причиной прекращения лечения в клинических исследованиях дорзоламидом было развитие побочных реакций, связанных с препаратом, со стороны органа зора, в первую очередь - конъюнктивита и реакций со стороны век.

Побочные реакции, которые наблюдались при проведении клинических исследований или послерегистрационных наблюдений применения глазных капель дорзоламидом, указанные ниже классами системных органов.

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

Со стороны органа зора: жжение и покалывание, поверхностный пятнистый кератит, слезотечение, конъюнктивит, воспаление век, зуд глаз, раздражение век, затуманивание зрения, иридоциклит, раздражение глаз (включая покраснение), боль, шелушение кожи век, кратковременное миопия (которая проходила при прекращении лечения), отек роговицы, внутриглазная гипотония, отслойка сосудистой оболочки глаза после фильтрационной хирургии, ощущение инородного тела в глазу.

Со стороны сердца: учащенное сердцебиение.

Дыхательные торакальные и медиастинальные расстройства: носовое кровотечение, одышка.

Желудочно-кишечные расстройства: тошнота, привкус горечи во рту, раздражение горла, сухость во рту.

Со стороны кожи и подкожной ткани: контактный дерматит, синдром Стивенса - Джонсона, токсический эпидермальный некролиз.

Со стороны почек и мочевыводящих путей: мочекаменная болезнь.

Общие нарушения и реакции в месте введения: астения/слабость, местные и системные реакции гиперчувствительности, включая ангионевротический отек, крапивница, зуд, сыпь, тяжесть дыхания, бронхоспазм.

Срок годности

2 года.

Не применять после истечения срока годности, указанного на упаковке.
Применять не более 28 дней после вскрытия флакона.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 30 °С в оригинальной упаковке для защиты от света. Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 5 мл раствора капель глазных во флаконах-капельницах, закрытых колпачками с контролем первого вскрытия. По 1 флакону-капельнице в картонной коробке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

Фамарь А.В.Е. (Завод Алимос)/Famar A.V.E. (Alimos plant);
Фарматен С.А./Pharmathen S.A.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Агиу Димитриу 63, Алимос Аттика 17456, Греция/Agiou Dimitriou 63, Alimos Attiki 17456, Greece

Дервенакион 6, Паллини Аттика 15351, Греция/Dervenakion 6, Pallini Attiki 15351, Greece.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).