ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування лікарського засобу

ДОРЗОЛ®
(DORZOL®)

Склад:
діюча речовина: дорзоламід;
1 мл препарату містить дорзоламіду гідрохлориду 22,3 мг, що еквівалентно 20 мг дорзоламіду;
допоміжні речовини: бензалконію хлорид, маніт (Е 421), натрію цитрат, натрію гідроксид, гідроксіетилцелюлоза, вода очищена.

Лікарська форма.
Краплі очні, розчин.
Основні фізико-хімічні властивості: прозора і безбарвна або майже безбарвна рідина.

Фармакотерапевтична група.
Засоби для застосування в офтальмології. Протиглаукомні препарати та міотичні засоби. Інгібітори карбоангідрази. Дорзоламід.
Код АТХ S01E C03.

Фармакологічні властивості.
Фармакодинаміка.
Карбоангідраза (СА) – фермент, який міститься в багатьох тканинах, у тому числі в тканинах ока. У людей СА існує в декількох ізоферментах, з яких найактивнішим є СА II. СА II переважно міститься в еритроцитах, але зустрічається і в інших тканинах. Інгібування СА в циліарних відростках в оці зменшує виділення сліз, передусім уповільненням створення бікарбонатних іонів, з подальшим зменшенням концентрації натрію і рідини. В результаті цього знижується очний тиск.
Дорзоламід є сильним інгібітором СА II у людини. Після застосування знижує очний тиск, незалежно від того пов’язаний він з глаукомою чи ні. Підвищений очний тиск – головний фактор ризику в патогенезі ушкодження очного нерва і у втраті поля зору при глаукомі. Очний тиск знижується без звичайних побічних дій міотичних засобів подібно до нічної сліпоти, спазму акомодації і звуження зіниці. Дорзоламід не впливає на пульс або артеріальний тиск або такий ефект мінімальний.
Місцеве застосування бета-блокаторів також знижує очний тиск зменшенням виділення сліз, а також іншими механізмами дії. Дослідження показали, що застосування дорзоламіду разом з місцевим бета-блокатором додатково знижує очний тиск. Це явище підтверджує раніше відомий факт про додатковий ефект бета-блокаторів і інгібіторів карбоангідрази.
Фармакокінетика.
На відміну від інгібіторів карбоангідрази, які приймаються всередину, місцеве застосування дорзоламіду дає змогу активній речовині діяти безпосередньо на око, навіть при застосуванні у невеликих дозах, що також зменшує його системну дію. У такий спосіб можна знизити інтраокулярний тиск без порушення кислотно-лужної рівноваги і електролітного балансу, які супроводжують застосування інгібіторів карбоангідрази.
Дорзоламід надходить у периферичний кровообіг навіть при місцевому застосуванні. Для оцінки величини системної інгібіції карбоангідрази при місцевому застосуванні препарату визначали концентрацію активної речовини і метаболітів у плазмі і еритроцитах, а також інгібіцію активності карбоангідрази в еритроцитах. Дорзоламід накопичується в еритроцитах під час тривалого застосування внаслідок селективного зв’язування з СА II, тоді як у плазмі у вільній формі зберігається в дуже низьких концентраціях. З активної речовини утворюється один N-дизетильний метаболіт, що менше гальмує активність СА II, ніж активна речовина, проте гальмує також активність менш активного ізоферменту (СА I). Метаболіт також накопичується в еритроцитах, де зв’язується спочатку з СА I. Дорзоламід зв’язується з протеїнами плазми (близько 33 %). Виділяється спочатку з сечею, причому в незміненій формі. Метаболіт також виділяється з сечею. Після припинення застосування препарату дорзоламід виводиться нелінійно з еритроцитів, з початковим швидким зниженням концентрації та подальшою фазою повільного виведення з періодом напіввиведення приблизно 4 місяці.

Подібні фармакокінетичні результати отримані також при тривалому місцевому застосуванні дорзоламіду. У деяких хворих літнього віку з ослабленою функцією нирок з кліренсом креатиніну (CrCl) 30–60 мл/хв, спостерігаються підвищені концентрації метаболітів в еритроцитах, але немає різниці в ступені інгібіції карбоангідрази і клінічно значимих системних побічних явищ.

Клінічні характеристики.

Показання.

Дорзол® застосовують для лікування підвищеного очного тиску у хворих з:
- очною гіпертензією;
- відкритокутовою глаукомою;
- псевдоексфоліативною глаукомою;

як додаткову терапію при лікуванні бета-блокаторами або як монотерапію, коли лікування бета-блокаторами не було успішним або бета-блокатори протипоказані.

Протипоказання.

- Підвищена чутливість до активних речовин або до будь-якої допоміжної речовини;
- тяжкі порушення функції нирок (CrCl < 30 мл/хв);
- гіперхлоремічний ацидоз.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Можливість взаємодії крапель Дорзол® з іншими ліками не досліджувалася.

При одночасному застосуванні дорзоламіду з нижчезазначеними ліками не було виявлено небажаних взаємодій: очні краплі тимолол і бетаксолол, ліки з системним ефектом – інгібітори ангіотензинперетворювального ферменту (АПФ), блокатори кальцієвих каналів, сечогінні засоби, нестероїдні протизапальні препарати, у тому числі ацетилсаліцилова кислота і гормони (наприклад естроген, інсулін і тироксин).

Взаємодію дорзоламіду, міотика і агоніста та адренорецепторів протягом лікування глаукоми не вивчено повністю.

Дорзоламід потенціює ефект інших антиглаукомних препаратів. Ацетазоламід при прийомі внутрішньо підвищує ризик розвитку системних побічних ефектів дорзоламіду.

Ефект таких інгібіторів ацетилхолінестерази, як фізіостигмін, галантамін, неостигмін або піридостигмін (які часто застосовуються при міастенії), може бути знижений дорзоламідом.

При сумісному застосуванні разом із діуретиками можлива значна втрата калію.

Призначення одночасно з фенітоїном може погіршити перебіг остеопорозу.

Саліцилова кислота, яку застосовують разом з дорзоламідом, може призвести до розвитку ацидозу. Крім того, консервант, що міститься в краплях дорзоламіду (бензалконію хлорид), може взаємодіяти з м’якими контактними лінзами.

Особливості застосування.

Хворим з гострою глаукомою закритокутового типу також необхідне застосування інших ліків разом з тими, що знижують очний тиск. Застосування крапель Дорзол® у хворих з гострою глаукомою закритокутового типу не досліджували.

Як і усі офтальмологічні ліки, які застосовуються місцево, препарат також може всмоктуватися системно. Дорзоламід, як і сульфонаміди, містить сульфонамідну групу. Тому при місцевому застосуванні можливі побічні ефекти, які спостерігаються також при системному застосуванні сульфонамідних препаратів, включаючи такі тяжкі реакції, як синдром Стівенса-Джонсона та токсичний епідермальний некроліз. У разі появи ознак гострих реакцій або підвищеної чутливості прийом ліків слід припинити.

У разі появи ознак алергічної реакції (кон’юнктивіт, реакції на повіках) потрібно розглянути можливість припинення застосування крапель Дорзол®.

Лікування пероральними інгібіторами карбоангідрази пов’язане з уролітіазом як результатом порушення кислотно-лужної рівноваги, особливо у хворих, у яких вже були ниркові камені. Хоча при застосуванні крапель Дорзол® не відмічалося порушень кислотно-лужної рівноваги, є рідкісні повідомлення про появу уролітіазу. Дорзоламід є інгібітором карбоангідрази для місцевого застосування, який може системно всмоктуватися, і у хворих з нирковими каменями в анамнезі існує підвищений ризик появи уролітіазу.

У хворих, які приймають пероральний інгібітор карбоангідрази і дорзоламід, існує підвищений ризик додаткового системного ефекту, тому одночасне застосування не рекомендується.
Є випадки появи набряку рогової оболонки і необоротної декомпенсації рогової оболонки у хворих, які раніше мали хронічний дефект рогової оболонки і/або перенесли хірургічне втручання на оці. Таким хворим дорзоламід слід застосовувати з обережністю.
У хворих, які приймають ліки для запобігання сльозотечі, може спостерігатися увеїт з одночасною гіпотонією ока після фільтраційної операції.
Порушення функції печінки.
Застосування Дорзолу® у хворих з порушеною функцією печінки не досліджували, тому таким хворим його слід застосовувати з обережністю.
Краплі містять хлорид бензалконію, який може спричинити подразнення очей.
Необхідно уникати прямого контакту з м'якими контактними лінзами.
Контактні лінзи необхідно зняти перед закапуванням препарату і надіти їх приблизно через 15 хвилин.
Препарат змінює колір м'яких контактних лінз.
Хворі літнього віку
Зазначене дозування стосується також хворих літнього віку.

Застосування у період вагітності або годування груддю.
Краплі Дорзол® під час вагітності застосовувати не рекомендується.
У разі застосування крапель Дорзол® годування груддю не рекомендується.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами.
Лікарський засіб може спричинити побічні явища, наприклад затьмарення зору, запаморочення, нудоту, що можуть вплинути на здатність керувати автотранспортом і працювати з іншими механізмами.
У період лікування слід уникати потенційно небезпечних видів діяльності, пов'язаних з необхідністю концентрації уваги та підвищеної швидкості психомоторних реакцій, особливо на початку лікування препаратом.

Спосіб застосування та дози.
Рекомендується закапувати по 1 краплі Дорзолу® в кон'юнктивальний мішок хворого ока 3 рази на день у разі монотерапії.
У медіальний кут кожного ока закапати по 1 краплі. Легко натиснути на зону слізного мішка одразу після закапування, щоб зменшити можливість системного поглинання Дорзолу®.
Якщо лікарський засіб застосовується як додаткова терапія, разом з місцевим бета-блокатором закапувати по 1 краплі Дорзолу® в кон'юнктивальний мішок хворого ока двічі на день.
Коли одні ліки від глаукоми замінюють на краплі Дорзол®, застосування цих ліків припиняється прийомом відповідної денної дози і наступного дня слід розпочинати прийом крапель Дорзол®.
У разі місцевого застосування кількох офтальміків приймати їх потрібно з проміжками в 10 хвилин.
Хворих слід попередити, що потрібно вимити руки перед застосуванням лікарського засобуі не торкатися піпеткою ока і навколишніх поверхонь.
Хворих також необхідно проінформувати, що при неправильному поводженні з очними краплями вони розчини можуть бути контаміновані бактеріями, які спричинюють інфекцію очей. При застосуванні контамінованого розчину можливі тяжкі ушкодження з подальшою втратою зору.

Діти.
Дані про застосування лікарського засобу дітям обмежені, тому його не застосовують дітям.

Передозування.
Відсутні дані про випадкове або навмисне передозування дорзоламіду, прийнятого перорально.
Симптоми
При застосуванні всередину спостерігається сонливість.

При місцевому застосуванні відмічається нудота, затуманення, головний біль, втома, ненормальні сновидіння і дисфагія.
Лікування
Лікування при передозуванні має бути симптоматичним і підтримуючим.
Можливі порушення рівня електролітів, розвиток ацидозу, а також побічні ефекти з боку нервової системи. Необхідно спостерігати за рівнем електролітів.

Побічні реакції.
З боку нервової системи: головний біль, запаморочення, парестезії.
З боку органів зору: пощипування і печіння, поверхневий точковий кератит, сльозотеча, кон'юнктивіт, запалення повік, свербіж очей, подразнення повік, затьмарення зору, блефарит, іридоцикліт, подразнення і почервоніння, біль, лущення повік, тимчасова короткозорість (яка зникає після припинення лікування), набряк рогової оболонки, гіпотонія ока, увеїт після фільтраційної операції, відчуття стороннього тіла в оці.
З боку дихальної системи, грудної клітки і середостіння: носова кровотеча, синусит, риніт, задишка.
З боку травної системи: нудота і гіркий присмак у роті, подразнення горла, сухість у роті.
З боку шкіри і підшкірних тканин: контактний дерматит, синдром Стівенса – Джонсона, токсичний епідермальний некроліз (синдром Лайєлла).
З боку серцево-судинної системи:
Сильне серцебиття, яке може бути прискореним або нерегулярним (пальпітація) –частота не може бути оцінена на основі наявних даних.
З боку нирок і сечовидільної системи: уролітіаз (сечокам'яна хвороба).
Загальні порушення і реакції в місці застосування: астенія/втома, ознаки і симптоми підвищеної чутливості: локально-пальпебральні реакції, ангіоневротичний набряк, кропив'янка, свербіж, висип, анафілаксія і рідко бронхоспазм.
*Результати лабораторних тестів:*застосування дорзоламіду не було пов'язано з клінічно значимими порушеннями рівня електролітів.

Термін придатності. 2 роки.

Умови зберігання.
Зберігати у недоступному для дітей місці при температурі не вище 30 °С. Після відкриття флакона очні краплі слід застосувати протягом 4 тижнів.

Упаковка.
По 5 мл розчину у флаконі-крапельниці; 1 флакон-крапельниця у картонній коробці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник.
Ядран-Галенський Лабораторій д.д. / Jadran-Galenski Laboratorij d.d.

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.
Свільно 20, 51000 Рієка, Хорватія / Svilno 20, 51000 Rijeka, Croatia