

CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

TRUSOPT, 20 mg/ml, krople do oczu, roztwór

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

1 ml roztworu zawiera 22,26 mg chlorowodorku dorzolamidu co odpowiada 20 mg dorzolamidu (*Dorzolamidum*).

Substancje pomocnicze o znanym działaniu:

Jeden ml kropli do oczu w postaci roztworu zawiera 0,075 mg benzalkoniowego chlorku, a jedna kropla zawiera około 0,002 mg benzalkoniowego chlorku.

Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Krople do oczu, roztwór.

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1 Wskazania do stosowania

Leczenie zwiększonego ciśnienia wewnątrzgałkowego u pacjentów z:

- nadciśnieniem ocznym,
- jaskrą z otwartym kątem,
- jaskrą torebkową i innymi wtórnymi przypadkami jaskry z otwartym kątem.

4.2 Dawkowanie i sposób podawania

Dawkowanie

Krople do oczu Trusopt stosowane w monoterapii dawkuje się następująco: zakropić jedną kroplę do worka spojówkowego chorego oka (oczu) trzy razy na dobę.

W leczeniu wspomagającym, wraz ze stosowanymi miejscowo lekami beta-adrenolitycznymi, podaje się do worka spojówkowego chorego oka (oczu) jedną kroplę produktu leczniczego Trusopt, dwa razy na dobę.

Chcąc zastąpić kroplami do oczu Trusopt inny, stosowany miejscowo przeciwjaskrowy produkt leczniczy, należy przerwać leczenie tym produktem i rozpocząć stosowanie produktu leczniczego Trusopt w dniu następnym.

Podczas stosowania kilku produktów leczniczych podawanych do worka spojówkowego, należy zachowywać co najmniej 15 minut przerwy między zakraplaniem kolejnych produktów leczniczych. Maści do oczu powinny być zawsze zastosowane jako ostatnie.

Pacjent powinien zostać poinformowany, że nie wolno dotykać końcówką kroplomierza do oka lub jego okolic.

Należy pacjentowi udzielić informacji, że w przypadku nieprawidłowego postępowania krople do oczu mogą ulec zanieczyszczeniu powszechnie występującymi bakteriami, które mogą wywołać zakażenie oka. Stosowanie zanieczyszczonego roztworu może prowadzić do poważnych uszkodzeń oka, a w następstwie do utraty wzroku.

Pacjentów należy poinformować o właściwym sposobie użycia pojemników.

Sposób podawania

1. Umyć ręce
2. Otworzyć pojemnik. Należy zachować szczególną ostrożność, aby nie dotykać zakraplaczem do oka, skóry wokół oczu ani palców. Nieprzestrzeganie tego zalecenia może spowodować zakażenie kropli do oczu. Stosowanie zakażonych kropli do oczu może prowadzić do niebezpiecznych powikłań a nawet do utraty wzroku.
3. Odchylić głowę do tyłu i przytrzymać odwołony dnem do góry pojemnik nad okiem.
4. Odciągnąć dolną powiekę w dół i spojrzeć w górę. Lekko nacisnąć pojemnik powodując wypłynięcie pojedynczej kropli do przestrzeni pomiędzy powieką dolną a okiem.
5. Uciskać palcem ujście przewodu nosowo-łzowego lub zamknąć powieki na 2 minuty. Pomaga to powstrzymać przedostanie się leku do krążenia ogólnego. Uciśnięcie kanału nosowo-łzowego lub zamknięcie powiek przez 2 minuty zmniejsza wchłanianie ogólnoustrojowe. Może to powodować zmniejszenie ogólnoustrojowych działań niepożądanych oraz zwiększenie działania miejscowego
6. W celu zakroplenia leku do drugiego oka, jeśli wskazane przez lekarza, należy powtórzyć czynności z punktów od 3 do 5.
7. Założyć z powrotem nakrętkę i szczelnie zamknąć pojemnik.

Dzieci i młodzież

Dostępna jest ograniczona ilość danych klinicznych dotyczących stosowania dorzolamidu u dzieci trzy razy na dobę. (Informacje dotyczące dawkowania u dzieci, patrz punkt 5.1).

4.3 Przeciwwskazania

Nadwrażliwość na substancję czynną lub na którąkolwiek substancję pomocniczą wymienioną w punkcie 6.1.

4.4 Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

Nie badano zastosowania produktu leczniczego Trusopt u pacjentów z ciężką niewydolnością nerek (z klirensiem kreatyniny mniejszym niż 30 ml/min). Z uwagi na to, że dorzolamid i jego metabolity są wydalane głównie przez nerki, stosowanie produktu leczniczego Trusopt u tych pacjentów nie jest zalecane.

Leczenie pacjentów z ostrą jaskrą z zamkniętym kątem powoduje konieczność, poza podawaniem leków zmniejszających ciśnienie w gałce ocznej, także innych interwencji terapeutycznych. Nie badano zastosowania produktu leczniczego Trusopt u pacjentów z ostrą jaskrą z zamkniętym kątem.

Nie badano zastosowania produktu leczniczego Trusopt u pacjentów z niewydolnością wątroby, stąd zalecane jest zachowanie ostrożności podczas leczenia tych pacjentów.

Dorzolamid jest sulfonamidem i pomimo stosowania miejscowego ulega wchłonięciu do krążenia ogólnego. Wobec tego te same działania niepożądane, które występują po podaniu ogólnym sulfonamidów, mogą wystąpić po zastosowaniu miejscowym, w tym ciężkie reakcje takie jak zespół Stevensa-Johnsona oraz martwica toksyczno-rozplywna naskórka. W przypadku stwierdzenia objawów ciężkich działań niepożądanych lub nadwrażliwości należy przerwać stosowanie produktu leczniczego.

W badaniach klinicznych w czasie długotrwałego stosowania produktu leczniczego Trusopt obserwowano miejscowe objawy niepożądane, głównie zapalenie spojówek i podrażnienie powiek. Niektóre z tych reakcji miały obraz kliniczny i przebieg reakcji alergicznej, która ustępowała po zakończeniu stosowania produktu leczniczego. W tych sytuacjach należy rozważyć konieczność przerwania leczenia produktem leczniczym Trusopt.

Podczas stosowania środków hamujących wytwarzanie cieczy wodnistej (np. dorzolamidu) po zabiegach filtracyjnych opisywano przypadki odwarstwienia naczyniówki.

Istnieje zwiększone prawdopodobieństwo wystąpienia obrzęku rogówki u pacjentów z małą liczbą komórek śródbłonna. Należy zachować ostrożność podczas przepisywania produktu leczniczego Trusopt w tej grupie pacjentów.

Benzalkoniowy chlorek

Zgłaszano, że benzalkoniowy chlorek może powodować także podrażnienie oczu, objawy zespołu suchego oka lub może wpływać na film łzowy i powierzchnię rogówki. Benzalkoniowy chlorek należy stosować ostrożnie u pacjentów z zespołem suchego oka lub z uszkodzeniami rogówki. Pacjentów leczonych długotrwale należy kontrolować.

Stosowanie soczewek kontaktowych

Benzalkoniowy chlorek może być absorbowany przez miękkie soczewki kontaktowe i zmieniać ich zabarwienie. Należy usunąć soczewki kontaktowe przed zakropleniem i odczekać co najmniej 15 minut przed ponownym założeniem.

Dzieci i młodzież

Nie badano stosowania produktu leczniczego Trusopt u pacjentów poniżej 36 tygodnia wieku ciążowego i poniżej 1 tygodnia życia. U pacjentów ze znacznym niedorozwojem kanałków nerkowych Trusopt należy stosować jedynie po dokładnym rozważeniu stosunku ryzyka do korzyści, ze względu na zagrożenie wystąpieniem kwasicy metabolicznej.

4.5 Interakcje z innymi produktami leczniczymi i inne rodzaje interakcji

Nie przeprowadzono szczegółowych badań dotyczących interakcji.

W badaniach klinicznych nie stwierdzono interakcji podczas jednoczesnego stosowania produktu leczniczego Trusopt z tymololem i betaksololem w postaci kropli do oczu, lekami działającymi ogólnie: inhibitorami konwertazy angiotensyny, antagonistami kanału wapniowego, lekami moczopędnymi i niesteroidowymi lekami przeciwzapalnymi, w tym z kwasem acetylosalicylowym, a także ze środkami hormonalnymi (np. estrogeny, insulina, tyroksyna).

Istnieje możliwość wystąpienia nasilenia działania ogólnego podczas stosowania inhibitorów anhidrazy węglanowej u pacjentów jednocześnie przyjmujących doustny inhibitor anhidrazy węglanowej i Trusopt. Jednoczesne stosowanie produktu leczniczego Trusopt i doustnych inhibitorów anhidrazy węglanowej nie było przedmiotem badań i nie jest zalecane.

Dorzolamid jest inhibitorem anhidrazy węglanowej i pomimo stosowania miejscowego jest wchłaniany do krążenia ogólnego. W badaniach klinicznych lek ten nie powodował zaburzeń równowagi kwasowo-zasadowej. Jednak po zastosowaniu doustnych inhibitorów anhidrazy węglanowej obserwowano takie zaburzenia, a w kilku przypadkach wystąpiły interakcje z innymi

lekami (np.: objawy toksyczne podczas leczenia dużymi dawkami salicylanów), należy więc brać pod uwagę potencjalne ryzyko wystąpienia interakcji także u pacjentów leczonych produktem leczniczym Trusopt.

4.6 Wpływ na płodność, ciążę i laktację

Ciąża

Nie prowadzono odpowiednich, kontrolowanych badań dotyczących stosowania produktu leczniczego u kobiet w okresie ciąży. Trusopt może być zastosowany w okresie ciąży jedynie wówczas, gdy potencjalne korzyści uzasadniają podjęcie ewentualnego ryzyka wpływu na płód.

Karmienie piersią

Nie wiadomo, czy dorzolamid przenika do mleka ludzkiego. Należy podjąć decyzję czy przerwać karmienie piersią czy przerwać podawanie produktu leczniczego biorąc pod uwagę znaczenie terapii dla zdrowia matki.

4.7 Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn

U niektórych pacjentów stosujących Trusopt istnieje możliwość wystąpienia działań niepożądanych mogących wpływać na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn (patrz punkt 4.8). Do momentu całkowitego ustąpienia tych objawów pacjent nie powinien prowadzić pojazdów ani obsługiwać maszyn.

4.8 Działania niepożądane

W przeprowadzonych długotrwałych badaniach klinicznych u pacjentów leczonych produktem leczniczym Trusopt w monoterapii lub jako lekiem uzupełniającym w leczeniu lekami beta-adrenolitycznymi w postaci okulistycznej, najczęstszym (u około 3% pacjentów) powodem przerwania leczenia produktem leczniczym Trusopt były działania niepożądane dotyczące oczu, a przede wszystkim stwierdzenie zapalenia spojówek i reakcji ze strony powiek.

W trakcie badań klinicznych lub po wprowadzeniu produktu leczniczego do obrotu zgłaszano następujące działania niepożądane:

[Bardzo często: ($\geq 1/10$); Często: ($\geq 1/100$ do $< 1/10$); Niezbyt często: ($\geq 1/1000$ do $< 1/100$); Rzadko: ($\geq 1/10\,000$ do $< 1/1000$); Częstość nieznana (częstość nie może być określona na podstawie dostępnych danych)]

Zaburzenia układu nerwowego:

Często: ból głowy.

Rzadko: zawroty głowy, parestezje.

Zaburzenia oka:

Bardzo często: pieczenie i klucie.

Często: powierzchowne punktowate zapalenie rogówki, łzawienie, zapalenie spojówek, zapalenie powiek, swędzenie oczu, podrażnienie powiek, niewyraźne widzenie.

Niezbyt często: zapalenie tęczówki i ciała rzęskowego.

Rzadko: podrażnienie, w tym zaczerwienienie, ból, sklejanie powiek, przemijająca krótkowzroczność (ustępująca po zaprzestaniu terapii), odwarstwienie naczyniówki po zabiegach filtracyjnych.

Częstość nieznana: Uczucie ciała obcego w oku, światłowstręt.

Zaburzenia serca:

Częstość nieznana: kołatanie serca, częstoskurcz

Zaburzenia naczyniowe:

Częstość nieznana: Nadciśnienie tętnicze

Zaburzenia układu oddechowego, klatki piersiowej i śródpiersia:

Rzadko: krwawienie z nosa.

Częstość nieznana: Duszność

Zaburzenia żołądka i jelit:

Często: nudności, gorzki smak w ustach.

Rzadko: podrażnienie gardła, suchość w jamie ustnej.

Zaburzenia skóry i tkanki podskórnej:

Rzadko: kontaktowe zapalenie skóry, zespół Stevensa-Johnsona, martwica toksyczno-rozpływna naskórka.

Zaburzenia nerek i dróg moczowych:

Rzadko: kamica moczowa.

Zaburzenia ogólne i stany w miejscu podania:

Często: uczucie osłabienia i zmęczenia.

Rzadko: objawy podmiotowe i przedmiotowe miejscowych reakcji nadwrażliwości, w tym reakcji dotyczących powiek oraz objawy ogólnych reakcji alergicznych, w tym obrzęk naczynioruchowy, pokrzywka i świąd, wysypka, skurcz oskrzeli.

Badania diagnostyczne:

Nie stwierdzono klinicznie istotnych zaburzeń elektrolitowych związanych ze stosowaniem produktu leczniczego Trusopt.

Dzieci i młodzież

Patrz punkt 5.1.

Zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych

Po dopuszczeniu produktu leczniczego do obrotu istotne jest zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych. Umożliwia to nieprzerwane monitorowanie stosunku korzyści do ryzyka stosowania produktu leczniczego. Osoby należące do fachowego personelu medycznego powinny zgłaszać wszelkie podejrzewane działania niepożądane za pośrednictwem Departamentu Monitorowania Niepożądanych Działań Produktów Leczniczych Urzędu Rejestracji Produktów Leczniczych, Wyrobów Medycznych i Produktów Biobójczych, Al. Jerozolimskie 181C, 02-222 Warszawa, tel.: + 48 22 49 21 301, faks: + 48 22 49 21 309, Strona internetowa: <https://smz.ezdrowie.gov.pl>
Działania niepożądane można zgłaszać również podmiotowi odpowiedzialnemu.

4.9 Przedawkowanie

Należy stosować leczenie objawowe i podtrzymujące. Możliwe jest wystąpienie zaburzeń elektrolitowych, rozwój kwasicy oraz objawów ze strony ośrodkowego układu nerwowego. Konieczne jest sprawdzanie stężenia elektrolitów (zwłaszcza potasu) w surowicy oraz pomiary pH krwi.

Wartość parametru LD₅₀ po podaniu leku doustnie wynosi 1320 mg/kg (3960 mg/m²) u myszy oraz 1927 mg/kg (11 369 mg/m²) u samicy szczura.

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

5.1 Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: inhibitory anhidrazy węglanowej, kod ATC: S01EC03

Mechanizm działania

Anhidraza węglanowa jest enzymem obecnym w wielu tkankach organizmu, w tym w oku. U ludzi anhidraza węglanowa występuje w postaci wielu izoenzymów, z których najbardziej aktywnym jest anhidraza węglanowa II, obecna przede wszystkim w krwinkach czerwonych, ale także w innych tkankach. Hamowanie aktywności anhidrazy węglanowej w wyrostkach rzęskowych oka powoduje zmniejszenie ilości wydzielanej cieczy wodnistej. W następstwie tego dochodzi do zmniejszenia ciśnienia wewnątrzgałkowego.

Trusopt zawiera chlorowodorek dorzolamidu, silnie hamujący ludzką anhidrazę węglanową II. Po miejscowym podaniu do oka dorzolamid obniża zwiększone ciśnienie wewnątrzgałkowe, bez względu na to czy jest ono związane z jaskrą. Zwiększone ciśnienie wewnątrzgałkowe to jedna z głównych przyczyn uszkodzenia nerwu wzrokowego i związanej z jaskrą utraty pola widzenia. W odróżnieniu od leków zwężających źrenicę Trusopt zmniejsza ciśnienie wewnątrzgałkowe nie powodując, często towarzyszących przyjmowaniu miotyków, działań niepożądanych, takich jak nocna ślepota, kurcz akomodacji i zwężenie źrenicy. W przeciwieństwie do stosowanych miejscowo leków beta-adrenolitycznych, Trusopt wywiera niewielki wpływ lub pozostaje bez wpływu na częstość akcji serca i ciśnienie tętnicze.

Ciśnienie wewnątrzgałkowe zmniejszają także podawane miejscowo leki beta-adrenolityczne poprzez zmniejszenie wydzielania cieczy wodnistej oka, jednak mechanizm ich działania jest odmienny. Wykazano, że dodanie produktu leczniczego Trusopt do miejscowo stosowanego leku beta-adrenolitycznego powoduje większe zmniejszenie ciśnienia wewnątrzgałkowego. Podobne działanie obserwowano w przypadku stosowania leków beta-adrenolitycznych i doustnych inhibitorów anhidrazy węglanowej.

Działanie farmakodynamiczne

Działanie kliniczne

Dorośli

Skuteczność produktu leczniczego Trusopt, stosowanego u chorych z jaskrą lub nadciśnieniem ocznym w monoterapii trzy razy na dobę (początkowe ciśnienie wewnątrzgałkowe ≥ 23 mmHg) lub dwa razy na dobę jako lek uzupełniający w leczeniu beta-adrenolitykiem w postaci kropli do oczu (początkowe ciśnienie wewnątrzgałkowe ≥ 22 mmHg), potwierdzono w szeroko zakrojonych badaniach klinicznych z okresem obserwacji do jednego roku. Podczas stosowania, zarówno w monoterapii, jak też jako lek uzupełniający, produkt leczniczy zmniejszał ciśnienie wewnątrzgałkowe w ciągu całego dnia i efekt ten utrzymywał się w trakcie długotrwałego stosowania. Skuteczność leku po długotrwałym stosowaniu w monoterapii była podobna do skuteczności betaksololu. Stosowany jako lek uzupełniający w terapii lekami beta-adrenolitycznymi w postaci kropli do oczu, Trusopt powodował dodatkowe zmniejszenie ciśnienia wewnątrzgałkowego podobnie, jak podczas stosowania pilokarpiny 2% cztery razy na dobę.

Dzieci i młodzież

W celu oceny bezpieczeństwa stosowania produktu leczniczego Trusopt podawanego miejscowo trzy razy na dobę przeprowadzono trzymiesięczne, podwójnie maskowane, kontrolowane aktywne lekiem, wieloośrodkowe badanie z udziałem 184 (122 przyjmujących dorzolamid) pacjentów pediatrycznych w wieku od 1 tygodnia do <6 lat z jaskrą lub podwyższonym ciśnieniem wewnątrzgałkowym (początkowe ciśnienie wewnątrzgałkowe > 22 mmHg). U około połowy pacjentów w obu leczonych grupach rozpoznano jaskrę wrodzoną; pozostałe najczęstsze etiologie

obejmowały: zespół Sturge-Webera, dysgenezję mezodermalną rogówki i tęczówki oraz afakie. Podział pacjentów w zależności od wieku i leczenia stosowanego w monoterapii był następujący:

	Dorzolamid 2%	Tymolol
Kohorta wiekowa <2 lat	N=56 Przedział wiekowy: 1 do 23 miesięcy	Tymolol RŻ* 0,25% N=27 Przedział wiekowy: 0,25 do 22 miesięcy (RŻ – roztwór żelowy)
Kohorta wiekowa ≥2 – <6 lat	N=66 Przedział wiekowy: 2 do 6 lat	Tymolol 0,50% N=35 Przedział wiekowy: 2 do 6 lat

Sumarycznie u około 70 pacjentów w obu kohortach wiekowych leczenie stosowano przez okres co najmniej 61 dni, zaś u około 50 pacjentów leczenie stosowano przez 81-100 dni.

W przypadku uzyskania niezadowolającej kontroli ciśnienia wewnątrzgałkowego po zastosowaniu dorzolamidu lub tymololu w postaci żelu w monoterapii, zmieniano sposób leczenia na metodę otwartej próby zgodnie z następującym schematem: u 30 pacjentów w wieku <2 lat nastąpiła zmiana leczenia polegająca na jednoczesnym podawaniu 0,25% tymololu w postaci żelu raz na dobę oraz 2% dorzolamidu trzy razy na dobę; u 30 pacjentów w wieku ≥2 lat nastąpiła zmiana leczenia polegająca na jednoczesnym podawaniu 2% dorzolamidu oraz 0,5% tymololu dwa razy na dobę.

Ogólnie, badanie to nie wykazało istnienia dodatkowych zagrożeń dla bezpieczeństwa stosowania leku u dzieci. Działania niepożądane związane z przyjmowaniem leku, z których większość miała charakter miejscowy, niezbyt poważne działania w obrębie oczu, takie jak piekący i kłujący ból oczu, ból w miejscu wkroplenia i ból oczu obserwowano u około 26% (20% w grupie przyjmującej dorzolamid w monoterapii) dzieci. U niewielkiego odsetka pacjentów <4%, obserwowano obrzęk lub przymglenie rogówki. Częstość występowania reakcji miejscowych wydaje się być podobna do częstości obserwowanej przy stosowaniu komparatora. Po wprowadzeniu leku do obrotu obserwowano występowanie kwasicy metabolicznej u bardzo młodych pacjentów, szczególnie z niedorozwojem/upośledzeniem nerek.

Wyniki dotyczące skuteczności stosowania leku u dzieci sugerują, że średnie obniżenie ciśnienia wewnątrzgałkowego obserwowanego w grupie przyjmującej dorzolamid jest porównywalne do średniego obniżenia ciśnienia wewnątrzgałkowego obserwowanego w grupie przyjmującej tymolol, pomimo zaobserwowanych nieznacznie korzystniejszych wartości liczbowych dla tymololu.

Brak wyników dłuższych badań (>12 tygodni).

5.2 Właściwości farmakokinetyczne

W przeciwieństwie do doustnych inhibitorów anhidrazy węglanowej podanie miejscowe chlorowodoru dorzolamidu umożliwia bezpośrednie działanie leku w obrębie oka po zastosowaniu znacznie mniejszych dawek, co w rezultacie zapewnia znacznie mniejszą ekspozycję układową na lek. W związku z tym w badaniach klinicznych stwierdzono, że zmniejszeniu ciśnienia wewnątrzgałkowego nie towarzyszą zaburzenia równowagi kwasowo-zasadowej ani zaburzenia elektrolitowe charakterystyczne dla doustnych inhibitorów anhidrazy węglanowej.

Po stosowaniu miejscowym dorzolamid przenika do krążenia ogólnego. W celu określenia jego siły działania jako układowego inhibitora anhidrazy węglanowej po podaniu miejscowym, zmierzono stężenia leku i jego metabolitów w erytrocytach i w osoczu krwi oraz stopień hamowania anhidrazy węglanowej w erytrocytach. Po długotrwałym stosowaniu dorzolamid gromadzi się w erytrocytach ze względu na selektywne wiązanie z izoenzymem anhidrazy węglanowej II, a stężenia wolnego leku w osoczu krwi pozostają skrajnie małe. Jedynym metabolitem leku jest N-deetylo-dorzolamid, który hamuje aktywność anhidrazy węglanowej II słabiej niż dorzolamid, ale hamuje także izoenzym o mniejszej aktywności (anhydrazę węglanową I). Metabolit ten gromadzi się również w erytrocytach, w których wiąże się głównie z anhydrazą węglanową I. Dorzolamid wiąże się w umiarkowanym

stopniu z białkami osocza (około 33%). Dorzolamid jest wydalany głównie w moczu w postaci nie zmienionej. Jego metabolit jest także wydalany w moczu. Po zakończeniu przyjmowania leku następuje nieliniowe zmniejszanie stężenia dorzolamidu w erytrocytach. Początkowo następuje szybkie zmniejszanie się stężenia leku, po czym następuje faza wolniejszej eliminacji z okresem półtrwania wynoszącym około 4 miesiące.

Po doustnym podawaniu dorzolamidu w celu symulacji maksymalnej ekspozycji układowej możliwej po długotrwałym miejscowym stosowaniu dorzolamidu, stan równowagi osiągnięto w ciągu 13 tygodni. W stanie równowagi nie stwierdzono w osoczu obecności wolnego leku lub jego metabolitu. Stopień zahamowania aktywności anhidrazy węglanowej w erytrocytach był mniejszy niż ten, który prawdopodobnie wywiera działanie farmakologiczne na czynność nerek lub układu oddechowego. Podobne rezultaty farmakokinetyczne obserwowano po długotrwałym, miejscowym stosowaniu produktu leczniczego Trusopt. Jednak u niektórych pacjentów w wieku podeszłym z zaburzeniami czynności nerek (szacunkowy klirens kreatyniny 30-60 ml/min) obserwowano większe stężenie metabolitu dorzolamidu w erytrocytach. Nie stwierdzono istotnych różnic dotyczących stopnia zahamowania aktywności anhidrazy węglanowej, ani klinicznie znamiennych ogólnych działań niepożądanych, które można z tym wiązać.

5.3 Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

Wyniki badań na zwierzętach, którym podawano doustnie chlorowodorek dorzolamidu były związane z efektami farmakologicznymi ogólnego zahamowania aktywności anhidrazy węglanowej. Niektóre z uzyskanych wyników były specyficzne tylko dla określonych gatunków zwierząt i (lub) były następstwem kwasicy metabolicznej.

W badaniach klinicznych u pacjentów nie stwierdzono objawów kwasicy metabolicznej ani zaburzeń stężenia elektrolitów w surowicy krwi, które wskazywałyby na układowe zahamowanie aktywności anhidrazy węglanowej. Z tego względu u pacjentów przyjmujących Trusopt w dawkach leczniczych nie należy się spodziewać wystąpienia takich zaburzeń, jakie obserwowano w badaniach na zwierzętach.

6. DANE FARMACEUTYCZNE

6.1 Wykaz substancji pomocniczych

Benzalkoniowy chlorek, hydroksyetyloceluloza, mannitol, sodu cytrynian, sodu wodorotlenek (do uzyskania właściwego pH), woda do wstrzykiwań.

6.2 Niezgodności farmaceutyczne

Nie dotyczy.

6.3 Okres ważności

3 lata.

Okres ważności po pierwszym otwarciu pojemnika: 4 tygodnie.

6.4 Specjalne środki ostrożności podczas przechowywania

Przechowywać w temperaturze poniżej 25°C, w oryginalnym opakowaniu.
Chronić od światła.

6.5 Rodzaj i zawartość opakowania

Pojemnik zawiera 5 ml roztworu.

Biały, półprzezroczysty pojemnik z polietylenu o małej gęstości z przezroczystą końcówką kroplomierza i białą nasadką.

Nierozzerwany pasek zabezpieczający na etykiecie pojemnika wskazuje, że produkt leczniczy nie był używany.

Dostępne są następujące wielkości opakowań produktu leczniczego Trusopt:

1 pojemnik po 5 ml

3 pojemniki po 5 ml

Nie wszystkie wielkości opakowań muszą znajdować się w obrocie.

6.6 Specjalne środki ostrożności dotyczące usuwania i przygotowania produktu leczniczego do stosowania

Bez specjalnych wymagań.

7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Santen Oy
Niittyhaankatu 20
33720 Tampere
Finlandia

8. NUMER POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

R/6613

9. DATA WYDANIA PIERWSZEGO POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU I DATA PRZEDŁUŻENIA POZWOLENIA

Data wydania pierwszego pozwolenia na dopuszczenie do obrotu: 15 marca 1996 r.

Data ostatniego przedłużenia pozwolenia: 30 marca 2015 r.

10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO

01/2026