

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению лекарственного препарата

Бримонидин

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Бримонидин

Международное непатентованное наименование: бримонидин

Лекарственная форма: капли глазные

Состав

Действующее вещество: Бримонидина тартрат – 2,00 мг.

Вспомогательные вещества: Поливиниловый спирт 40-88, натрия цитрат, лимонной кислоты моногидрат, натрия хлорид, хлористоводородной кислоты раствор 1 М или натрия гидроксида раствор 1 М, вода для инъекций - до 1,00 мл.

Описание

Прозрачный желтовато-зеленый раствор.

Фармакотерапевтическая группа: Противоглаукомное средство – альфа₂ – адреномиметик селективный.

Код АТХ: S01EA05

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Бримонидин – селективный агонист α_2 -адренорецепторов. При инстилляции 0,2% раствора бримонидина снижение внутриглазного давления составляет 10-12 мм рт. ст., максимальное снижение внутриглазного давления достигается через 2 ч, длительность действия – 12 ч. Бримонидин имеет двойной механизм действия, он может понижать внутриглазное давление путем снижения синтеза внутриглазной жидкости и усиления увеосклерального оттока.

Фармакокинетика

После применения 0,2% раствора глазных капель бримонидина дважды в сутки на протяжении 10 дней среднее значение максимальной концентрации ($C_{\max}$) в плазме крови остается низким (в среднем 0,06 нг/мл).

При инстиллянии глазных капель максимальная концентрация препарата в плазме крови достигается через 0,5-2,5 ч, период полувыведения ($T_{1/2}$) препарата после местного применения в среднем составляет 2 часа.

Связь с белками крови при местном применении составляет 29%.

Бримонидин обратимо связывается с меланином. Концентрации бримонидина в радужной оболочке, ресничном теле и сетчатке после двух недель закапывания в глаза в 3-17 раз превышали данные показатели после закапывания одной дозы препарата. Системное всасывание бримонидина при местном применении замедлено. Метаболизируется препарат преимущественно в печени. Бримонидин и его метаболиты выводятся почками.

Показания к применению

Открытоугольная глаукома, офтальмогипертензия (в монотерапии и в комбинации с другими препаратами, снижающими внутриглазное давление).

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к бримонидину или к любому из вспомогательных компонентов препарата.

- Одновременный прием с ингибиторами моноаминоксидазы (МАО) и трициклическими или тетрациклическими антидепрессантами (в том числе миансерином).
- Детский возраст до 2-х лет (безопасность и эффективность препарата для данной возрастной категории не установлены).
- Период грудного вскармливания.

С осторожностью

У пациентов с почечной недостаточностью (клиренс креатинина ниже 40 мл/мин) и печеночной недостаточностью.

У пациентов с ортостатической гипотензией, сердечной недостаточностью и недостаточностью мозгового кровообращения, депрессией, синдромом Рейно, облитерирующим тромбангиитом бримонидин может усиливать тяжесть течения заболеваний, обусловленных сосудистой недостаточностью.

У пациентов, одновременно проходящих терапию гипотензивными препаратами и (или) сердечными гликозидами.

Применение препарата у детей младше 12 лет не рекомендовано.

У детей в возрасте от 2 до 7 лет. В период лечения необходим тщательный контроль состояния пациентов в возрасте от 2 до 7 лет (особенно с массой тела до 20 кг) в связи с высокой частотой встречаемости и выраженности сонливости.

При развитии аллергических реакций на препарат необходимо прекратить лечение и обратиться к врачу.

Возможно повышение внутриглазного давления в случае развития реакций замедленной гиперчувствительности (см. раздел «Побочное действие»).

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Исследования безопасности и эффективности применения бримонидина у беременных и кормящих не проводились. В исследованиях на животных местное применение бримонидина не приводило к нарушению внутриутробного развития. Применение бримонидина при беременности допускается только в тех случаях, когда ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода или ребенка.

Нет точных данных о проникновении в грудное молоко бримонидина при местном применении, однако риск не может быть исключен полностью. При назначении в период лактации грудное вскармливание рекомендуется прекратить на время лечения.

Способ применения и дозы

Местно.

В конъюнктивальный мешок пораженного глаза по 1 капле препарата 2 раза в сутки с интервалом между введениями 12 часов.

Продолжительность лечения определяется врачом.

С целью уменьшения возможной системной абсорбции препарата рекомендуется слегка прикрыть веко и прижать слезный мешок у внутреннего угла глаза (закрывая слезную точку) в течение одной минуты. Этот прием следует выполнять сразу же после закапывания каждой капли.

В случае необходимости использования двух или большего количества офальмологических препаратов, разные препараты следует закапывать с интервалом 5-15 минут. Глазные мази должны быть применены в последнюю очередь.

Пациенты с нарушением функции почек и печени

Применение бримонидина у пациентов с нарушением функции печени и почек не изучено, при лечении таких пациентов необходимо соблюдать осторожность (см. раздел «С осторожностью»).

Пациенты пожилого возраста

У пациентов пожилого возраста не отмечали отличий в безопасности или эффективности по сравнению со взрослыми пациентами. $C_{\max}$ и $T_{1/2}$ бримонидина были сходными у пожилых (65 лет и старше) и более молодых пациентов взрослой популяции, что демонстрирует отсутствие значимого влияния возраста на системное всасывание и выведение бримонидина. Не обязательно модифицировать дозировку у пациентов пожилого возраста.

Применение у детей

Бримонидин противопоказан детям до 2 лет (см. раздел «Противопоказания»). У детей в возрасте от 2 до 7 лет при применении 0,2% бримонидина возможно возникновение сонливости, что может явиться причиной прекращения лечения.

Следует осуществлять тщательный контроль состояния пациента в связи с высокой частотой случаев сонливости.

Частота сонливости может снижаться с увеличением возраста, но в большей степени определяется массой тела: у детей с массой ≤ 20 кг сонливость может чаще отмечаться по сравнению с детьми с массой > 20 кг (см. раздел «С осторожностью»).

Побочное действие

Наиболее часто встречаемыми нежелательными реакциями со стороны органа зрения являются аллергический конъюнктивит, конъюнктивальная инъекция, зуд слизистой оболочки глаз и кожи век. Большинство нежелательных реакций имели быстропроходящий характер и лёгкую степень тяжести (не требуют прекращения лечения). По данным клинических исследований симптомы аллергических реакций со стороны глаз наблюдались в 12,7% случаев (являясь причиной прекращения лечения в 11,5% случаев), при этом у большинства пациентов они проявлялись через 3-6 месяцев применения препарата.

Частота возникновения побочных эффектов классифицировалась следующим образом: очень часто ($\geq 1/10$), часто (от $\geq 1/100$ до $< 1/10$), нечасто (от $\geq 1/1000$ до $< 1/100$), редко (от $\geq 1/10\ 000$ до $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10\ 000$), частота возникновения неизвестна (невозможно оценить на основании имеющихся данных).

Со стороны органа зрения:

Очень часто – гиперемия конъюнктивы, ощущение жжения, зуд кожи век и слизистой оболочки глаз, ощущение инородного тела, нарушение четкости зрительного восприятия, аллергический блефарит, аллергический блефароконъюнктивит, аллергический конъюнктивит, фолликулярный конъюнктивит.

Часто – гиперемия и отек век, блефарит, отек конъюнктивы и слизистое отделяемое из глаз, кровоизлияние в конъюнктиву, конъюнктивит, ретенционное слезотечение,

эпифора, боль в глазу и слезотечение, фолликулез конъюнктивы глаз, местные аллергические реакции слизистой оболочки глаза (в том числе кератоконъюнктивит), катаракта, кератит, поражение век, фоточувствительность, поверхностная пятнистая кератопатия, выпадение поля зрения, функциональное поражение стекловидного тела, кровоизлияние в стекловидное тело, плавающие помутнения в стекловидном теле и снижение остроты зрения, светобоязнь, эрозия и помутнение роговицы, сухость и раздражение слизистой оболочки поверхности глаза, побледнение конъюнктивы.

Нечасто – ячмень.

Очень редко – ирит, миоз.

Со стороны центральной нервной системы:

Очень часто – головная боль, сонливость.

Часто – головокружение, нарушение вкусовых ощущений.

Нечасто – депрессия.

Очень редко – обморок, бессонница.

Со стороны сердечно-сосудистой системы:

Нечасто – сердцебиение/аритмии (включая брадикардию и тахикардию).

Очень редко – повышение или снижение артериального давления.

Со стороны органов дыхания:

Часто – бронхит, фарингит, кашель, одышка.

Нечасто – сухость слизистой оболочки носа.

Редко – одышка.

Со стороны желудочно-кишечного тракта:

Очень часто – сухость слизистой оболочки рта.

Часто – желудочно-кишечные расстройства.

Со стороны кожи и подкожно-жировой клетчатки:

Часто – сыпь, эритема, зуд, отек лица.

Инфекционные и паразитарные заболевания:

Часто – гриппоподобный синдром, инфекционное заболевание (озноб и респираторная инфекция), ринит, синусит, в т.ч. инфекционный.

Со стороны иммунной системы:

Нечасто – системные аллергические реакции.

Лабораторные показатели:

Часто – гиперхолестеринемия.

Другие:

Очень часто – утомляемость.

Часто – астения.

У детей отмечено: апноэ, брадикардия, снижение артериального давления, гипотермия, мышечная гипотония, бледность, сонливость, снижение внимания (см. раздел «С осторожностью»).

Пострегистрационное применение 2 мг/мл глазных капель бримонида выявило нежелательные реакции, указанные ниже, источником которых являлись спонтанные сообщения при неизвестном размере популяции, поэтому указать частоту их возникновения не представляется возможным.

Со стороны органа зрения: иридоциклит (передний увеит).

Со стороны кожи и подкожно-жировой клетчатки: аллергические реакции со стороны кожи, включая эритему, отек лица, зуд, сыпь и расширение сосудов кожи век.

Со стороны желудочно-кишечного тракта: тошнота.

Передозировка

Передозировка при местном применении

Симптомы передозировки при местном применении препарата представлены ранее отмеченными нежелательными реакциями.

Передозировка при случайном приеме препарата внутрь (взрослые пациенты)

Сообщений о случаях передозировки у взрослых достаточно мало.

Возможны следующие симптомы: угнетение центральной нервной системы, сонливость, угнетение и потеря сознания, гипотензия, брадикардия, снижение температуры тела, цианоз кожных покровов, апноэ, астения, рвота, судороги, аритмия, миоз.

Лечение передозировки при приеме препарата внутрь включает поддерживающую и симптоматическую терапию, необходимо поддерживать проходимость дыхательных путей.

Передозировка у детей и подростков

Передозировка бримонидином (в качестве дополнительной терапии врожденной глаукомы при случайном приеме внутрь) наблюдалась у детей младшего возраста (2-7 лет).

Симптомы: потеря сознания, заторможенность, сонливость, гипотензия, гипотония, брадикардия, гипотермия, цианоз, бледность, угнетение дыхания и апноэ.

Лечение: проведение поддерживающей и симптоматической терапии, контроль проходимости дыхательных путей, может быть необходима интенсивная терапия с применением интубации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Исследований по изучению взаимодействия препарата с другими лекарственными средствами не проводилось.

Бримонидин противопоказан пациентам, принимающим ингибиторы моноаминоксидазы (МАО), и пациентам, принимающим трициклические или тетрациклические антидепрессанты (в т.ч. миансерин).

Бримонидин в концентрации 2 мг/мл может усиливать действие веществ, влияющих на центральную нервную систему (алкоголь, барбитураты, опиоиды, седативные препараты и анестетики).

Следует проявлять осторожность в случае приема препаратов, способных воздействовать на всасывание в кровь и метаболизацию адреналина, норадреналина

и других, так называемых, биогенных аминов (хлорпромазин, метилфенидат, резерпин).

У некоторых пациентов после применения раствора бримонидина в концентрации 2 мг/мл отмечается небольшое снижение артериального давления. Следует проявлять осторожность при одновременном применении с гипотензивными препаратами и/или препаратами группы сердечных гликозидов (наперстянки).

При одновременном системном введении агонистов или антагонистов адренорецепторов (например, изопреналина или празозина) в первый раз, а также при изменении дозы этих одновременно вводимых системных препаратов (независимо от способа их введения), могут возникать взаимодействия с агонистами альфа-адренорецепторов или воздействия на их эффекты.

Особые указания

Бримонидин может усугублять течение синдромов, сопровождающихся сосудистой недостаточностью. Бримонидин следует с осторожностью применять у пациентов с депрессией, нарушением мозгового или коронарного кровообращения, синдромом Рейно, ортостатической гипотензией или облитерирующим тромбангиитом. Несмотря на то, что по результатам клинических исследований не обнаружено значимого влияния бримонидина на артериальное давление, у пациентов с сердечно-сосудистыми заболеваниями препарат следует применять с осторожностью.

Препарат Бримонидин является стерильным раствором и не содержит консервантов.

Специальная система укупорки многодозового флакона-капельницы предотвращает микробиологическое загрязнение благодаря специальной силиконовой мембране и фильтрации воздуха, засасываемого во флакон. Загрязнение не может попасть в раствор, а содержимое флакона остается стерильным в течение 90 дней.

Клинические исследования препарата Бримонидин у пациентов, применяющих контактные линзы, не проводились. Перед применением препарата следует снять контактные линзы. Интервал времени между использованием препарата и повторной установки контактных линз должен составлять не менее 15 минут.

Не использовать раствор после истечения срока годности, указанного на флаконе.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и механизмами

Препарат может вызывать состояние усталости или сонливости, снижение четкости зрения, особенно ночью или в условиях недостаточной освещенности, поэтому в период лечения препаратом следует воздержаться от вождения транспортных средств и обслуживания движущихся механизмов.

Форма выпуска

Капли глазные, 2 мг/мл.

По 5 мл или 10 мл препарата помещают во флакон-капельницу полимерную из полиэтилена высокого давления с крышкой навинчиваемой из полиэтилена низкого давления и пробкой-капельницей из полиэтилена низкого давления объемом 10 мл или во флакон-капельницу полимерный из полиэтилена высокого давления с винтовой горловиной, крышкой навинчиваемой из полиэтилена низкого давления и пробкой-капельницей из полиэтилена низкого или высокого давления, вместимостью 10 мл.

По 5, 10 мл в стерильные полимерные флаконы-капельницы, изготовленные по технологии «blow-fill-seal» «выдувание-наполнение-герметизация» из полиэтилена низкой плотности высокого давления, герметично закрытые крышками, навинчиваемыми из полиэтилена низкой плотности.

По 1 или 3 полимерному флакону-капельнице с инструкцией по медицинскому применению помещают в пачку из картона или хром-эрзац.

Условия хранения

В защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Срок годности

2 года.

После вскрытия флакон хранить не более 30 дней.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Юридическое лицо, на имя которого выдано регистрационное удостоверение

ООО «КОСМОФАРМ», Россия

107076, г. Москва, ул. Стромынка, д. 19, корп. 2, пом 128, ком 7.

тел.: +7(495) 644-00-31

факс: +7(495) 644-00-32

Производитель

ООО «Славянская аптека», Россия

601125, Владимирская обл., Петушинский район, пос. Вольгинский

Организация, принимающая претензии потребителей

ООО «КОСМОФАРМ», Россия

107076, г. Москва, ул. Стромынка, д. 19, корп. 2, пом 128, ком 7.

тел.: +7(495) 644-00-31

факс: +7(495) 644-00-32

О нежелательных явлениях сообщать:

ООО «АЗТ ФармРесурс», Россия

123458, г. Москва, ул. Твардовского, д. 8 стр. 1, «Технопарк «Строгино» для ООО
«АЗТ ФармРесурс»

Телефон: +7 (495) 230-22-42

E-mail: info@azt.grop

Представитель компании



Бородина Е. Н.