Состав

действующее вещество: бримонидина тартрат;

1 мл бримонидина тартрата 2 мг;

вспомогательные вещества: спирт поливиниловый 40-88; натрия; кислота лимонная моногидрат, натрия хлорид, кислота соляная разведенная, 10% раствор натрия гидроксид, 10% раствор вода очищенная.

Лекарственная форма

Капли глазные, раствор.

Основные физико-химические свойства: прозрачная, желто-зеленого цвета раствор.

Фармакотерапевтическая группа

Противоглаукомные и миотические средства. Код АТХ S01E A05.

Фармакодинамика

Бримонидин является агонистом α-2-адренорецепторов. Родство бримонидина с α-2-адренорецепторами рецепторами в 1000 раз больше по сравнению с родством с α-1-адренорецепторами рецепторами. Благодаря этому Бримонидин не вызывает расширение зрачков, стеноза капилляров ксеногенних трансплантатов сетчатки у человека.

У людей тартрат бримонидина после введения в конъюнктивальный мешок снижает внутриглазное давление, минимально влияя на работу сердечно-сосудистой системы и органов дыхания.

Ограниченные данные о применении препарата пациентам с бронхиальной астмой не подтвердили возникновения побочных действий.

Бримонидин характеризуется быстрым началом действия, а его максимальная гипотензивное действие возникает через 2 часа после применения. В двух клинических исследованиях, проведенных в течение года, Бримонидин снижал внутриглазное давление примерно на 4-6 мм ртутного столба.

Согласно флюорофотометричнимы исследованиями на животных и людях, тартрат бримонидина проявляет двойной механизм действия. Вероятно,

Бримонидин снижает внутриглазное давление путем уменьшения синтеза внутриглазной жидкости и усиление увеосклерального оттока.

Клинические исследования подтверждают, что Бримонидин можно эффективно комбинироваться с бета-адреноблокаторами для местного применения. Краткосрочные клинические исследования подтверждают также, что Бримонидин оказывает существенную клиническую аддитивное действие в сочетании с Травопрост (6 недель) и латанопростом (3 месяца).

Фармакокинетика

После 10 дней введения в конъюнктивальный мешок раствора 0,2% 2 раза в сутки наблюдалась низкая концентрация бримонидина в плазме (Cmax составляла в среднем 0,06 нг / мл).

После многократного применения (2 раза в сутки в течение 10 дней) зафиксировано небольшое кумуляции препарата в крови. Площадь под фармакокинетической кривой «концентрация - время» в течение 12 часов в равновесном состоянии (AUC0-12 ч) составляла 0,31 нг · ч / мл по сравнению с 0,23 нг · ч / мл после введения первой дозы. Период полувыведения из общего кровообращения после местного введения препарата составлял примерно 3 часа.

После местного введения Бримонидин связывается с белками плазмы примерно на 29%.

In vitro и in vivo Бримонидин связывается обратимо с меланином в тканях глаза. После 2 недель местного применения препарата концентрация бримонидина в радужной оболочке, реснитчатом теле и сосудистой / сетчатой оболочке была в 3-17 раз больше, чем после введения единичной дозы. Не выявлено накопление лекарственного средства в случае отсутствия меланина.

Значение связывания с меланином у людей не изучено. Однако не подтверждены неблагоприятные побочные офтальмологические действия в биомикроскопи исследованиях глаз у пациентов, проходивших лечение Бримонидина течение периода до 1 года. Симптомы токсического воздействия на органы зрения не подтверждены также в исследованиях на животных, которым в течение года вводили тартрат бримонидина в дозах, в 4 раза больше по сравнению с дозами, рекомендованными для людей.

После приема у людей, Бримонидин быстро всасывается из желудочно-кишечного тракта, а затем быстро выводится из организма. Значительная часть дозы (около 75%) выводится в виде метаболитов в течение 5 дней не выявлено наличие неизмененном виде в моче. Исследования in vitro с применением

печеночной ткани животных и людей указывают, что метаболические изменения бримонидина происходят, главным образом, с участием альдегидоксидазы и цитохрома Р450. Итак, главным путем выведения препарата из общей системы кровообращения является печеночный метаболизм.

Кинетический профиль

Не выявлено существенных отклонений от пропорциональной зависимости между дозой бримонидина, максимальной концентрацией в плазме крови Cmax и AUC после однократного введения лекарственного средства в концентрации 0,08%, 0,2% и 0,5% соответственно.

Пациенты пожилого возраста

Cmax, AUC и период полувыведения бримонидина после однократной дозы имеют схожие значения у пациентов пожилого возраста (старше 65) и у молодых пациентов. Данные наблюдения указывают на отсутствие зависимости между возрастом и всасыванием лекарств в систему общего кровообращения, а также его выводом.

Клинические исследования, которые длились 3 месяца (с участием пациентов пожилого возраста) подтвердили, что общее воздействие бримонидина был очень незначителен.

Показания

Применять для снижения повышенного внутриглазного давления у пациентов с открытоугольной глаукомой или повышенным глазным давлением:

- В монотерапии, если местное применение бета-блокаторов противопоказано.
- В составе комбинированной терапии с другими лекарственными средствами, снижающими внутриглазное давление, если снижение давления при применении этих препаратов недостаточно.

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к бримонидина тартрата или другим компонентам препарата.
- Детский возраст (до 18 лет).
- Противопоказано применять пациентам, которые проходят лечение ингибиторами МАО (МАО), а также антидепрессантами, влияющие на норадренергическую передачу (например, трициклические

антидепрессанты и миансерин).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Лекарственное средство Бриглау ЭКО противопоказан пациентам, которые проходят лечение с применением ингибиторов МАО, и пациентам, принимающим антидепрессанты, влияющие на норадренергическую передачу (то есть трициклические антидепрессанты и миансерин).

Несмотря на отсутствие специальных исследований лекарственного взаимодействия препарата Бриглау ЭКО, следует учитывать возможность усиления эффекта лекарственных средств, угнетающих ЦНС (алкоголь, барбитураты, производные опия, седативные препараты, общие анестетики).

Следует с осторожностью назначать пациентам, которые принимают лекарственные средства, которые могут влиять на метаболизм аминов и их распределение в сосудистом русле, например хлорпромазин, метилфенидат, резерпин.

После применения бримонидина у некоторых пациентов наблюдалось снижение артериального кровяного давления, которое не имело клинического значения. С осторожностью следует назначать гипотензивные лекарственные средства и сердечные гликозиды.

Следует быть осторожными, применяя Бримонидин одновременно с антигипертензивными препаратами и (или) сердечными гликозидами. Также следует быть осторожными, начиная применения (или при изменении дозы) системного препарата (независимо от фармацевтической формы), который может взаимодействовать с α-адренорецепторами или влиять на их работу, то есть агонистов или антагонистов адренорецепторов (например, изопреналина, празозина).

Особенности применения

Следует соблюдать осторожность при применении лекарственного средства пациентам с заостренным или нестабильным и неконтролируемым заболеванием системы кровообращения.

У некоторых пациентов (12,7%) в процессе клинических исследований были зафиксированы случаи реакции гиперчувствительности в области глаз после приема бримонидина.

В случае возникновения аллергических реакций следует прекратить применение бримонидина. Отмечались замедленные реакции гиперчувствительности, связанные с глазами, после применения бримонидина, при этом некоторые из сообщений касались реакций, связанных с ростом внутриглазного давления.

С осторожностью следует назначать препарат Бриглау ЭКО пациентам с депрессией, церебральной и коронарной недостаточностью, синдромом Рейно, при ортостатической гипотензии и облитерирующий тромбангиите.

Не проводились исследования по применению препарата пациентам с печеночной или почечной недостаточностью, поэтому требуется осторожность при применении бримонидина этими пациентами.

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

Бримонидин может вызвать чувство усталости и сонливости, которые могут влиять на способность управлять транспортными средствами и другими механизмами. Бримонидин может также вызвать нарушение остроты зрения и ухудшение зрения, что может препятствовать способности управлять транспортными средствами и обслуживать механизмы, особенно ночью или в сумерках. Пациент должен дождаться исчезновения указанных симптомов, прежде чем приступать к управлению транспортным средством или обслуживание механизмов.

Применение в период беременности или кормления грудью

Контролируемых исследований с участием беременных женщин не проводили. В период беременности и кормления грудью препарат Бриглау ЭКО следует применять только тогда, когда ожидаемая польза для матери значительно превышает потенциальный риск для плода или ребенка.

Неизвестно, проникает Бримонидин в грудное молоко, поэтому препарат не следует применять в период кормления грудью.

Способ применения и дозы

Применение взрослым, включая пациентов пожилого возраста.

Рекомендуется применение 1 капле бримонидина в больной глаз (глаза) 2 раза в сутки, с перерывом примерно 12 часов. Для пациентов пожилого возраста коррекции дозы не требуется. Для снижения системной абсорбции сразу после закапывания лекарственного средства рекомендуется прижать и удерживать 1

минуту слезный мешок на внутреннем углу глаза (нажатие слезной точки).

При использовании более чем одного лекарственного офтальмологического препарата для местного применения рекомендуется соблюдение перерывов между их применением не менее 5-15 минут.

Применение при почечной и печеночной недостаточности.

Не проводились исследования по применению бримонидина пациентам с нарушениями функции печени или почек.

Дети

Эффективность и безопасность применения бримонидина детям не исследованы, поэтому лекарственное средство не следует применять детям.

Передозировка

Передозировка при введении в глаз (взрослые)

В описанных случаях передозировки наблюдались симптомы, отвечали известным побочным эффектам.

Системное передозировки вследствие случайного приема внутрь (взрослые)

Существуют ограниченные данные о случайном применения внутрь бримонидина взрослыми пациентами. Единственной зафиксированной побочным действием было снижение артериального давления. После зафиксированного эпизода снижение артериального давления возникла «отраженная» гипертензия. Порядок действий в случае приема передозировки включает вспомогательную терапию и симптоматическое лечение; необходимо обеспечить проходимость дыхательных путей пациента.

Поступали сообщения о передозировке другими альфа-2-агонистов, которые вызывали такие симптомы, как артериальная гипотензия, астения, рвота, летаргия, седация, брадикардия, аритмия, миоз, апноэ, гипотония, гипотермия, дыхательная недостаточность и судороги. Лечение симптоматическое.

Передозировка при местном применении и системное передозировки при случайном приеме внутрь у детей

Симптомы передозировки бримонидина, такие как апноэ, брадикардия, кома, артериальная гипотензия, гипотермия, гипотония, летаргия, бледная кожа, дыхательная недостаточность, сонливость, были зафиксированы у

новорожденных, младенцев и детей, получавших глазной раствор бримонидина (0,1-0, 2%) как составную лечения врожденной глаукомы или при случайном попадании бримонидина внутрь.

Некоторые из этих симптомов требовали интенсивной терапии с интубацией. Все пациенты полностью выздоравливали в течение 6-24 часов.

Побочные реакции

Чаще всего возникают такие побочные действия (в 22-25% пациентов): сухость слизистой оболочки полости рта, гиперемия конъюнктивы и ощущение жжения / покалывание глаз. Вышеперечисленные симптомы обычно носят временный характер и не требуют прерывания лечения.

Симптомы аллергических реакций в области глаз встречались в 12,7% пациентов, участвовавших в клинических исследованиях (будучи причиной прекращения участия в исследовании 11,5% пациентов). Эти реакции в основном возникали между 3-м и 9-м месяцами лечения.

В пределах каждой группы по частоте возникновения побочные эффекты перечислены соответственно к ослаблению их проявления. Частота возникновения побочных эффектов классифицируется следующим образом: очень часто (≥1 / 10); часто (от ≥1 / 100 до <1/10); нечасто (от ≥1 / 1000 до <1/100); редко (от ≥1 / 10000 до <1/1000); очень редко (<1/10000), частота неизвестна (невозможно определить из имеющихся данных).

Со стороны сердца

Частота неизвестна: аритмия (в том числе брадикардия и тахикардия).

Со стороны нервной системы

Очень часто: головная боль, сонливость.

Часто: головокружение, нарушение вкуса.

Очень редко: потеря сознания.

Со стороны органов зрения

Очень часто: раздражение глаз (гиперемия конъюнктивы, жжение и покалывание, зуд, фоликульоз конъюнктивы, ощущение инородного тела), снижение остроты зрения - аллергическое воспаление век и конъюнктивит, аллергическое воспаление конъюнктивы, аллергические реакции в области глаз и фолликулярный конъюнктивит.

Часто: местное раздражение (отек и покраснение век, воспаление краев век, отек конъюнктивы и наличие выделений из конъюнктивального мешка, боль в глазах и слезотечение), светочувствительность, повреждение и изменение цвета эпителия роговицы, сухость глаз, обесцвечивание конъюнктивы , нарушение зрения, конъюнктивит.

Очень редко: воспаление радужной оболочки, сужение зрачков.

Со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения

Часто: симптомы со стороны верхних дыхательных путей.

Нечасто: сухость слизистой оболочки носа.

Редко: одышка.

Со стороны желудочно-кишечного тракта

Очень часто: сухость слизистой оболочки полости рта.

Часто: желудочно-кишечные расстройства.

Со стороны сосудов

Очень редко: гипотензия артериальная, гипертензия.

Общие расстройства и расстройства в месте введения

Очень часто: усталость.

Часто: слабость (астения).

Со стороны иммунной системы

Нечасто: общие аллергические реакции.

Со стороны психики

Нечасто: депрессия.

Очень редко: бессонница.

Ниже приведены побочные эффекты, которые наблюдались в клинической практике в постмаркетинговый период при применении лекарственного препарата, содержащего бримонидина тартрат, в виде раствора глазных капель. Поскольку данные получены из добровольных сообщений, количество пациентов, у которых возникали побочные реакции, неизвестно, поэтому невозможно

оценить частоту их возникновения.

Со стороны органов зрения

Воспаление радужной оболочки и ресничного тела (воспаление сосудистой оболочки переднего сегмента глаза); зуд век.

Со стороны кожи и подкожных тканей

Кожные реакции, включающие эритема, отек лица, зуд, сыпь и расширение кровеносных сосудов.

У новорожденных и младенцев, в которых элементом терапии врожденной глаукомы было применение бримонидина, наблюдались симптомы передозировки, такие как потеря сознания, летаргия, чувство сонливости, снижение артериального давления, вялость, брадикардия, гипотермия, цианоз, бледность, задержка дыхания и апноэ.

Срок годности

2 года. Не применять лекарственное средство после окончания срока годности, указанного на упаковке. Срок годности после вскрытия - 90 дней.

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 30 ° С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 5 мл раствора в полиэтиленовом флаконе-капельнице с крышкой с гарантийным кольцом.

По 1 флакону в картонной коробке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

Варшавский фармацевтический завод Польфа АО, Польша.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Ул. Каролькова 22/24, 01-207 Варшава, Польша.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — Государственного реестра лекарственных средств Украины.