

## **Состав**

*действующее вещество:* 1 мл бримонидина тартрата 2 мг;

1 мл содержит 23 капель;

*вспомогательные вещества:* натрия хлорид, кислота винная, натрия тартрат, гипромеллоза, бензалкония хлорид, натрия гидроксид, вода для инъекций.

## **Лекарственная форма**

Капли глазные, раствор.

*Основные физико-химические свойства:* прозрачный, слегка вязкий раствор зеленовато-желтого цвета без видимых механических частиц.

## **Фармакотерапевтическая группа**

Противоглаукомные и миотические средства. Код АТХ S01E A05.

## **Фармакодинамика**

Бримонидин является агонистом альфа-2-адренорецепторов, который в тысячи раз более селективный для альфа-2 адренорецепторов, чем для альфа-1-адренорецепторов.

Такая селективность является причиной отсутствия мидриаза и сужение микрососудов, связанных с ксенотрансплантата сетчатки человека.

Местное применение бримонидина тартрата у человека снижает внутриглазное давление с минимальным влиянием на показатели сердечно-сосудистой и легочной деятельности.

Бримонидина тартрат 0,2% характеризуется быстрым началом действия, пиковый гипотонический эффект относительно глаз достигается в течение 2 часов после применения. В рамках исследований бримонидина тартрат 0,2% снижал внутриглазное давление в среднем на 4-6 мм рт.ст.

Результаты исследований на животных и человеке свидетельствуют о том, что бримонидина тартрат имеет двойной механизм действия. Считается, что бримонидина тартрат 0,2% снижает ВТО вследствие уменьшения продукции водянистой влаги и повышения увеосклерального оттока.

## **Фармакокинетика**

После глазного применения 0,2% бримонидина тартрата дважды в день в течение 10 дней его концентрация в плазме крови были низкими (средняя максимальной концентрации составляла 0,06 нг/мл). Повторные закапывания (2 раза в день в течение 10 дней) приводили к его незначительного накопления в крови. Площадь под кривой плазменной концентрации во времени через 12 часов составила в равновесном состоянии (AUC 0-12год) 0,31 нг/ч/мл по сравнению с 0,23 нг/ч/мл после первой дозы. Период полувыведения из системного кровообращения у человека после местного применения составлял примерно 3 часа. Степень связывания бримонидина с белками плазмы после местного применения у человека составляет примерно 29%.

В тканях глаза Бримонидин обратимо связывается с меланином *in vitro* и *in vivo*. После двух недель применения в глаза концентрации бримонидина в радужной оболочке и собственной сосудистой оболочке глаза были в 3-17 раз выше, чем после однократной дозы. В случае отсутствия меланина накопления не наблюдается.

Значение связывания с меланином не выяснено. Однако биомикроскопической исследования пациентов, получавших бримонидина тартрат 0,2% до 1 года, показало наличия каких-либо существенных побочных реакций относительно глаз. У обезьян, получавших дозы примерно в 4 раза превышающих рекомендованную дозу бримонидина тартрата, не было выявлено значительного глазной токсичности.

У человека Бримонидин хорошо всасывается и быстро выводится после перорального приема. Существенная часть дозы (около 75%) выводится с мочой в виде метаболитов за 5 дней. Результаты исследований *in vitro*, которые проводились с использованием животной и человеческой печени, свидетельствуют о том, что его метаболизм обусловлен преимущественно альдегидоксидазой и цитохрома P450. Считается, что системное вывода части обусловлено печеночным метаболизмом. Экскреция с мочой является главным путем выведения бримонидина и его метаболитов.

### Пациенты пожилого возраста:

С макс, AUC и период полувыведения бримонидина после применения однократной дозы пациентам пожилого возраста 65 лет были такими же, как у взрослых молодого возраста, свидетельствует о том, что возраст не влияет на системную абсорбцию и выведение лекарственного средства.

## **Показания**

- Открытоугольная глаукома или повышенное внутриглазное давление (ВГД).
- Монотерапия у пациентов, которым противопоказано применение местных бета-блокаторов.
- В составе комплексной терапии с другими препаратами для снижения ВГД, когда монотерапия не дает желаемого результата.

### **Противопоказания**

- Повышенная чувствительность к действующему веществу или другим компонентам препарата.
- Одновременное применение с ингибиторами МАО и антидепрессантами, влияющие на норадренергическую передачу (например трициклические и тетрациклические антидепрессанты, миансерин).
- Детский возраст (до 18 лет).
- Период кормления грудью.

### **Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий**

Противопоказано одновременное применение с ингибиторами МАО и антидепрессантами, влияющие на норадренергическую передачу (например трициклические и тетрациклические антидепрессанты, миансерин).

Хотя специфическое взаимодействие бримонидина с лекарственными средствами не исследовалась, следует учитывать возможность аддитивного или усиливающего влияния препарата на действие лекарственных средств, угнетающих ЦНС (алкоголя, барбитуратов, опиатов, седативных средств и анестетиков).

Данные об уровне катехоламинов в плазме крови после применения бримонидина отсутствуют.

Однако следует с осторожностью назначать пациентам, которые применяют лекарственные средства, которые могут повлиять на метаболизм и увеличивают концентрацию аминов в плазме крови (например хлорпромазин, метилфенидат, резерпин).

У некоторых пациентов после применения бримонидина тартрата наблюдалось клинически незначительное снижение артериального давления, поэтому следует с осторожностью применять одновременно Бримонидин, гипотензивные средства и сердечные гликозиды.

Рекомендовано наблюдение в начале лечения (или при увеличении дозы препарата) при комбинированной терапии с системными средствами (независимо от их фармацевтической формы), которые могут взаимодействовать с агонистами альфа-адренорецепторов или влиять на их эффективность (например агонистами или антагонистами адренорецепторов изопреналином, празозином).

### **Особенности применения**

Следует с осторожностью применять препарат пациентам с тяжелой, неустойчивой и неконтролируемой формой сердечно-сосудистых заболеваний.

Для пациентов пожилого возраста коррекции дозы не требуется.

У некоторых пациентов, которые получали бримонидина тартрат 0,2%, наблюдались аллергические реакции со стороны глаз. При возникновении аллергической реакции применение препарата Бримонал 0,2% следует прекратить.

Следует с осторожностью применять Бримонал 0,2% пациентам с депрессией, нарушением мозгового кровообращения и коронарной недостаточностью, синдромом Рейно, ортостатической гипотензии и облитерирующим тромбангиите.

Влияние средства Бримонал 0,2% на пациентов с печеночной или почечной недостаточностью исследовался, поэтому следует быть осторожным при применении средства для пациентов с соответствующими заболеваниями.

Бримонал 0,2% содержит консервант - бензалкония хлорид, который всасывается мягкими контактными линзами. При пользовании мягкими (гидрофильными) контактными линзами не следует применять их в течение 15 минут после применения средства Бримонал 0,2%. Если используется более чем один офтальмологический средство наружно, интервал времени между приложениями различных лекарственных средств должен быть 5-15 минут.

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

Бримонидин может вызвать головокружение, сонливость, нарушение зрения, что может повлиять на способность управлять транспортными средствами и механизмами. К такой деятельности можно приступать не ранее чем через 15 мин после применения капель, пока не прояснится зрение.

## **Применение в период беременности или кормления грудью**

Исследования по безопасности применения бримонидина тартрата беременным женщинам не проводились, поэтому Бримонал 0,2% не применять в период беременности.

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

## **Способ применения и дозы**

Препарат назначать взрослым.

Рекомендуется закапывать одну каплю препарата Бримонал 0,2% в пораженный глаз дважды в сутки с интервалом 12 часов.

Коррекция дозы для людей пожилого возраста не требуется.

Как и при применении любых глазных капель, рекомендуется нажать на протяжении одной минуты на участок слезного мешка во внутреннем уголке глаза для снижения системной абсорбции. Это следует сделать сразу после закапывания каждой капли. Если назначено более одного вида глазных капель, их следует закапывать с интервалом 5-15 мин.

## **Дети**

Эффективность и безопасность применения бримонидина детям не исследованы.

## **Передозировка**

*Передозировка при офтальмологическом применении.*

У взрослых случаев местного передозировки препарата не отмечалось.

*Системное передозировки при случайном пероральном применении препарата.*

Известно о 2 случаях возникновения побочных эффектов после случайного перорального применения 9-10 капель бримонидина взрослым пациентам. В них наблюдалось значительное снижение артериального давления, у одного из пациентов примерно через 8 часов после приема препарата отмечалось повышение артериального давления. В течение 24 часов состояние обоих пациентов полностью нормализовалось. Еще у одного пациента, который принял внутрь неизвестное количество препарата, не отмечали никаких побочных эффектов. Известны случаи возникновения серьезных побочных эффектов у

детей при случайном пероральном применении бримонидина. В них наблюдались следующие симптомы: угнетение ЦНС, недолговременная кома или потеря сознания, артериальная гипотония, брадикардия, гипотермия и апноэ, что требовало проведения интенсивной терапии с интубацией. В течение 6-24 часов состояние всех пациентов полностью нормализовалось.

При пероральном передозировке других альфа-2-агонистов сообщалось о случаях появления таких симптомов: артериальная гипотензия, астения, рвота, летаргия, седация, брадикардия, аритмия, миоз, апноэ, гипотермия, угнетение функции дыхания и судороги.

Лечение симптоматическое.

*Дети:*

Побочные реакции после случайного проглатывания бримонидина у детей также были зарегистрированы. Они включали угнетение ЦНС, временную кому, нарушение сознания, летаргию, сонливость, артериальная гипотензия, брадикардия, гипотермию, бледность, угнетение дыхания, апноэ, требующие интенсивной терапии, интубации соответственно.

Симптомы полностью исчезли в течение 6-24 часов во всех субъектов.

## **Побочные реакции**

В каждой группе нежелательные явления определены в порядке уменьшения их тяжести. Частота определена следующим образом: очень часто ( $\geq 1/10$ ) часто ( $<1/10$ ); редкие ( $<1/100$ ); редкие ( $<1/1000$ ); очень редкие ( $<1/10000$ ); неизвестно (частота не может быть оценена по имеющимся данным):

*Со стороны сердечно-сосудистой системы.*

Нечасто: сердцебиение, аритмии (в том числе брадикардия и тахикардия).

*Со стороны нервной системы.*

Очень часто: головная боль, сонливость.

Часто: головокружение, нарушение вкуса.

Очень редкие: обмороки.

*Со стороны органов зрения.*

Очень часто: раздражение глаз (гиперемия глаза, ощущение жжения и покалывания, ощущение инородного тела, фолликулы конъюнктивы, зуд в

глазах), затуманенное зрение, аллергический блефарит, аллергический блефароконъюнктивит, аллергический конъюнктивит, аллергические реакции глаз и фолликулярный конъюнктивит.

Часто: местное раздражение (гиперемия века, отек век, блефарит, боль глаз и слезотечение, выделения из конъюнктивы, отек конъюнктивы), светобоязнь, эрозия, сухость глаз, побледнение конъюнктивы, нарушение зрения, конъюнктивит.

Очень редкие: ирит (передний увеит), миоз.

*Со стороны органов дыхания, грудной полости, средостения.*

Часто: симптомы верхних дыхательных путей.

Нечасто: сухость в носу

Редкие: одышка.

*Со стороны желудочно-кишечного тракта.*

Очень часто: сухость во рту.

Часто: желудочно-кишечные симптомы.

*Сосудистые расстройства.*

Очень часто: артериальная гипертензия, гипотензия.

*Нарушение общего состояния, связанные с местом применения.*

Очень часто: усталость.

Часто: астения.

*Со стороны иммунной системы.*

Нечасто: системные аллергические реакции.

*Со стороны психики.*

Нечасто: депрессия

Очень редкие: бессонница.

Во время пострегистрационных применения бримонидина в клинической практике были зарегистрированы следующие побочные реакции (частота случаев неизвестна, так как они были зарегистрированы спонтанно в популяции

неизвестного количества).

*Со стороны органов зрения:*

иридоциклит (передний увеит), зуд век.

*Со стороны кожи и подкожной клетчатки:*

кожные реакции, включая эритему, отек лица, зуд, сыпь и вазодилатацию.

### **Срок годности**

2 года.

### **Условия хранения**

Хранить в недоступном для детей, защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С. Не замораживать. После вскрытия хранить не более 28 суток.

### **Упаковка**

По 10 мл в пластиковом флаконе-капельнице, закрытом колпачком с контролем первого вскрытия.

По 1 флакону-капельнице в картонной коробке.

### **Категория отпуска**

По рецепту.

### **Производитель**

ООО «УНИМЕД ФАРМА»/«UNIMED PHARMA Ltd».

### **Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности**

ул. Ориешкова 11 821 05 Братислава, Словацкая Республика/Orieskova 11 821 05 Bratislava, Slovak Republic.

### **Источник инструкции**

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