

ІНСТРУКЦІЯ для медичного застосування препарату

ЛЮКСФЕН® (LUXFEN®)

Склад:

діюча речовина: brimonidine

1 мл розчину містить бримонідину тартрату 2 мг, що еквівалентно 1,3 мг бримонідину;

допоміжні речовини: бензалконію хлорид; спирт полівініловий, натрію хлорид; натрію цитрат; кислота лимонна, моногідрат; 1 М розчин хлористоводневої кислоти (для корекції рН); 1 М розчин натрію гідроксиду (для корекції рН); вода очищена.

Лікарська форма. Краплі очні, розчин.

Фармакотерапевтична група. Симпатоміметики для лікування глаукоми.

Код АТС S01E A05.

Клінічні характеристики.

Показання.

Відкритокутова глаукома або підвищений внутрішньоочний тиск (ВОТ).

- Монотерапія у пацієнтів, яким протипоказано застосування місцевих бета-блокаторів.
- У складі комплексної терапії з іншими препаратами для зниження ВОТ, коли монотерапія не дає бажаного результату.

Протипоказання.

Гіперчутливість до діючої речовини або до допоміжних речовин препарату.

Дитячий вік.

Період вагітності та годування груддю.

Однчасне застосування з інгібіторами МАО та антидепресантами, що впливають на норадренергічну передачу (наприклад, із трициклічними антидепресантами та міансеріном).

Спосіб застосування та дози. По 1 краплі бримонідину закачують в уражене око двічі на день через рівні проміжки часу (приблизно через 12 годин). Корекція дози для людей літнього віку не потрібна.

Як і при застосуванні будь-яких очних крапель, для зменшення можливої системної абсорбції препарату рекомендовано протягом 1 хв натискати на слізний мішечок у медіальному куті очної щілини (крапкаста оклюзія). Це необхідно зробити безпосередньо після закапування кожної краплі препарату. Якщо призначено більше одного виду очних крапель, їх слід закапувати з інтервалом 5-15 хв.

Побічні реакції.

З боку серцево-судинної системи: відчуття серцебиття/аритмії (у тому числі брадикардія та тахікардія), артеріальна гіпертензія, артеріальна гіпотензія.

З боку ЦНС: головний біль, сонливість, запаморочення, дисгевзія, синкопе.

З боку органів зору: подразнення очей (гіперемія, запалення та печіння, свербіж, відчуття стороннього тіла, фолікулярний кон'юнктивіт), розпливчате бачення, алергічний блефарит, алергічний блефарокон'юнктивіт, алергічний кон'юнктивіт, очна алергічна реакція та фолікулярний кон'юнктивіт, місцеве подразнення (гіперемія та набряк повік, блефарит, набряк кон'юнктиви та виділення з очей, біль в очах та слезотеча), фотофобія, ерозія рогівки та кератопатія, сухість в очах, блідість кон'юнктиви, порушення зору, кон'юнктивіт, ірит, міоз, іридоцикліт, свербіж повік, шкірна реакція, в тому числі еритема, набряк обличчя, свербіж, висипання, вазодилатація.

З боку дихальної системи: симптоми захворювання верхніх дихальних шляхів, сухість слизової оболонки носа, диспное.

З боку травної системи: сухість у роті, гастроінтестинальні симптоми.

Загальні розлади: втома, астенія.

З боку імунної системи: системні алергічні реакції (підвищена чутливість).

З боку психіки: депресія, безсоння.

Передозування.

Передозування при офтальмологічному застосуванні.

При місцевому застосуванні у дорослих передозування не спостерігалось.

Відомі 2 випадки виникнення побічних ефектів після випадкового перорального застосування 9-10 крапель бримонідину дорослими пацієнтами. У них спостерігалось значне зниження артеріального тиску, у одного з пацієнтів приблизно через 8 годин після прийому препарату відмічалось підвищення артеріального тиску. Протягом 24 годин стан обох пацієнтів повністю нормалізувався. У третього пацієнта, який прийняв перорально невідому кількість препарату, не відмічалось ніяких побічних ефектів. Відомі випадки виникнення серйозних побічних ефектів у дітей при випадковому пероральному застосуванні бримонідину. У них спостерігались такі симптоми: пригнічення ЦНС, типова недовготривала кома або стан, близький до втрати свідомості, млявість, сонливість, гіпотонія, брадикардія, гіпотермія, блідість, пригнічення дихання та апное, що потребувало проведення інтенсивної терапії з інкубацією при необхідності. Протягом 6-24 годин стан всіх пацієнтів повністю нормалізувався.

При пероральному передозуванні інших альфа-2-агоністів повідомлялося про випадки появи таких симптомів: артеріальна гіпотензія, астенія, блювання, летаргія, седація, брадикардія, аритмія, міоз, апное, гіпотермія, ціаноз, пригнічення функції дихання та судоми.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Дослідження з безпеки застосування препарату вагітним жінкам не проводились, тому Люксфен® не застосовують у період вагітності. Не відомо, чи проникає бримонідин у грудне молоко, тому препарат не слід застосовувати у період годування груддю.

Діти.

У зв'язку з відсутністю клінічних досліджень у дітей, препарат рекомендований до застосування дорослим.

Особливості застосування. Обережно слід застосовувати препарат пацієнтам з важкими або нестабільними та неконтрольованими серцево-судинними захворюваннями.

При появі алергічних реакцій лікування бримонідином слід припинити.

З обережністю слід застосовувати препарат пацієнтам з депресією, недостатністю мозкового кровообігу, коронарною недостатністю, синдромом Рейно, ортостатичною гіпотензією або облітеруючим тромбоемболією.

У зв'язку з тим, що вплив бримонідину на пацієнтів з печінковою або нирковою недостатністю не вивчався, препарат цим пацієнтам слід застосовувати з обережністю.

Люксфен® містить бензалконію хлорид як консервант, який може викликати місцеве подразнення очей. Слід уникати контакту препарату з м'якими контактними лінзами. Контактні лінзи слід зняти перед закапуванням і знову вставити їх через 15 хв після закапування. Відомі випадки знебарвлення м'яких контактних лінз.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами. Бримонідин може спричинити втомленість, сонливість, затьмарення або порушення зору, що може вплинути на здатність керувати транспортними засобами та механізмами.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій. Хоча специфічна взаємодія бримонідину з лікарськими засобами не досліджувалась, слід враховувати можливість адитивного або посилюючого впливу препарату на дію депресантів ЦНС (алкоголю, барбітуратів, опіатів, седативних засобів та анестетиків).

Дані про рівень катехоламінів у плазмі крові після застосування бримонідину відсутні. Однак бримонідин слід призначати з обережністю тим пацієнтам, які застосовують препарати, що впливають на метаболізм та збільшують концентрацію амінів у плазмі крові (наприклад, хлорпромазин, метилфенідат, резерпін). Після застосування бримонідину у деяких пацієнтів відмічалоя клінічно незначне зниження артеріального тиску. З обережністю призначають одночасно бримонідин та гіпотензивні засоби та/або серцеві глікозиди. Рекомендовано спостереження на початку лікування (або при збільшенні дози препарату) при комбінованій терапії з системними засобами (незалежно від їх фармацевтичної форми), що можуть взаємодіяти з агоністами альфа-адренорецепторів або впливати на їх ефективність (наприклад, агоністами або антагоністами адренергічних рецепторів – ізопреналієм, празозином).

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Бримонідин – це агоніст альфа-2-адренергічних рецепторів, що у тисячу разів більш селективний до альфа-2-адренорецепторів, ніж до альфа-1-адренорецепторів. Ця селективність призводить до відсутності мідріазу та вазоконстрикції мікросудин, асоційованих з ксенотрансплантатами сітківки у людей.

Місцеве застосування бримонідину тартрату призводить до зменшення внутрішньоочного тиску у людей при незначному впливі на серцево-судинну та респіраторну систему.

Клінічні дані з приводу безпечного застосування препарату при бронхіальній астмі обмежені.

ВОТ починає знижуватись досить швидко після застосування препарату, а його максимальне зниження спостерігається через 2 години. Бримонідин знижує внутрішньоочний тиск за рахунок зменшення водянистої вологи та незначного збільшення увеосклерального відтоку.

Фармакокінетика.

Загальна характеристика.

Після закапування 0,2 % розчину препарату двічі на день протягом 10 днів його концентрація в плазмі крові була низькою (середнє C_{max} становило 0,06 нг/мл). Після багаторазового застосування (двічі на день протягом 10 днів) спостерігалась незначна кумуляція препарату у крові. Площа під фармакокінетичною кривою через 12 годин у стаціонарній фазі AUC - 0-12 годин) становила 0,31 нг год/мл порівняно з 0,23 нг год/мл після застосування першої дози. Після місцевого застосування середній період напіввиведення з системного кровотоку становив приблизно 3 години.

Зв'язування бримонідину з протеїнами плазми крові після місцевого застосування становить приблизно 29 %.

Бримонідин зворотно зв'язується з меланіном у тканинах ока *in vitro* та *in vivo*. Після 2 тижнів закапування в очі концентрація бримонідину в райдужній оболонці, циліарному тілі та судинній оболонці-сітківці була 3-17 разів вищою, ніж після одноразового застосування. Акумуляція не спостерігається при відсутності меланіну. Значення зв'язування меланіну не з'ясоване. Після перорального прийому бримонідин добре абсорбується та швидко виводиться. Більша частина дози (приблизно 75 %) виводиться у вигляді метаболітів із сечею протягом 5 днів. У сечі відсутній бримонідин у незміненому вигляді. Препарат метаболізується головним чином під впливом альдегідоксидази та цитохрому P450. Таким чином, системна елімінація відбувається в основному за рахунок первинного метаболізму у печінці.

Після одноразового застосування препарату у дозах 0,08 %, 0,2 % та 0,5 % не відмічалоя значного відхилення C_{max} плазми та AUC пропорційно дозі.

Особливості застосування в окремих групах пацієнтів.

Пацієнти літнього віку.

Після застосування разової дози C_{max} плазми, AUC та період напіввиведення бримонідину у літніх пацієнтів (65 років і старше) не відрізняються від таких показників у пацієнтів молодшого віку, що свідчить про те, що вік не впливає на системну абсорбцію препарату та його виведення.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості: прозорий розчин, злегка зеленувато-жовтого кольору.

Термін придатності. 2 роки. Після першого відкриття – 28 днів.

Умови зберігання. Зберігати в захищеному від світла та недоступному для дітей місці при температурі не вище 25 °С.

Упаковка. По 5 мл розчину у пляшці. Кожна пляшка упакована в індивідуальну картонну коробку

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. АБ «Санітас».

Місцезнаходження. Вул. Вієверу 134 В,LT-46352, Каунас, Литва.