Бринзопт



Код АТХ:

- S01EC04

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Бринзоламид

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Форма выпуска, описание и состав

Капли глазные в виде суспензии белого или почти белого цвета.

	1 мл
бринзоламид	10 мг

Вспомогательные вещества: тилоксапол - 0.25 мг, карбомер 974P - 4 мг, маннитол (E421) - 33 мг, натрия хлорид - 2.5 мг, динатрия эдетата дигидрат - 0.1 мг, бензалкония хлорид - 0.15 мг, натрия гидроксид или хлористоводородная кислота - до pH 7.5±0.1, вода очищенная - до 1 мл.

5 мл - флаконы из полиэтилена вместимостью 5 мл (1) с капельным аппликатором - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Метаболики
- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Бринзоламид является ингибитором карбоангидразы II (КА-II). Карбоангидраза - фермент, определяемый во многих тканях организма, в т.ч. в тканях глаза. Катализирует обратимые реакции, в которых происходит гидратация двуокиси углерода и гидролиз угольной кислоты.

Ингибирование карбоангидразы на уровне цилиарного тела снижает секрецию водянистой влаги за счет замедления образования ионов бикарбоната с последующим снижением транспорта натрия и воды, что приводит к снижению внутриглазного давления. Повышение внутриглазного давления является основным фактором риска повреждения зрительного нерва и сужения границ полей зрения.

Фармакокинетика

Всасывание и распределение

После инстилляции бринзоламид попадает в системный кровоток. Благодаря высокому сродству к КА-II бринзоламид адсорбируется в эритроцитах. Связывание с белками плазмы составляет около 60%.

Метаболизм

У человека происходит образование метаболита N-дезэтилбринзоламид, который связывается с КА и накапливается в эритроцитах. Данный метаболит связывается в основном с КА-I в присутствии бринзоламида. В плазме концентрация бринзоламида и N-дезэтилбринзоламида ниже предела количественного определения (<7.5 нг/мл).

Выведение

Отмечается большой $T_{1/2}$ бринзоламида из цельной крови (в среднем 24 недели). Бринзоламид выводится в основном почками в неизмененном виде (приблизительно 60%). N-дезэтилбринзоламид также присутствует в моче наряду со следовыми количествами метаболитов N-дезметоксипропил и О-десметил.

Показания к применению:

Бринзопт предназначен для снижения повышенного внутриглазного давления при офтальмогипертензии и открытоугольной глаукоме:

— в качестве монотерапии у взрослых пациентов, которые не реагируют на бета-адреноблокаторы;

— у взрослых пациентов, которым противопоказаны бета-адреноблокаторы;

— в качестве дополнительной терапии к бета-адреноблокаторам или аналогам простагландинов.

Относится к болезням:

- Глаукома

Противопоказания:

— повышенная чувствительность к действующему веществу или любому из вспомогательных веществ;

— известная чувствительность к сульфонамидам;

— тяжелая почечная недостаточность;

— гиперхлоремический ацидоз.

Способ применения и дозы:

Дозы

При применении препарата Бринзопт в качестве монотерапии или в комбинации с другими препаратами рекомендуют закапывать 1 каплю в конъюнктивальный мешок пораженного глаза (пораженных глаз) 2 раза/сут. Некоторые пациенты могут лучше реагировать на лечение при применении препарата по 1 капле 3 раза/сут.

При переходе с терапии другим офтальмологическим противоглаукомным препаратом на лечение бринзоламидом применение препарата Бринзопт начинают со следующего дня.

Если применяют более одного лекарственного средства для местного применения, остальные препараты следует инстиллировать с интервалом не менее 5 мин, глазные мази следует применять в последнюю очередь.

Если пропущена одна доза препарата, лечение продолжают со следующей дозой. Доза не должна превышать 1 каплю в пораженный глаз (пораженные глаза) 3 раза/сут.

Способ применения

Препарат применяют местно. После закапывания рекомендуется провести носослезную окклюзию или осторожно закрыть веки. Это может снизить попадание препарата в системный кровоток и уменьшить, тем самым, развитие системных побочных эффектов.

Перед применением препарата флакон следует хорошо взбалтывать.

Для предотвращения заражения кончика капельницы и суспензии следует избегать его соприкосновения с поверхностью глаза и другими поверхностями. Между применениями флакон следует хранить плотно закрытым.

У **пациентов пожилого возраста** нет необходимости в коррекции дозы.

Применение бринзоламида не исследовалось у **пациентов с печеночной недостаточностью**, поэтому при указанной патологии применение препарата не рекомендуется.

Применение бринзоламида не исследовалось у **пациентов с тяжелой почечной недостаточностью (КК <30 мл/мин)** или у **пациентов с гиперхлоремическим ацидозом**. Поскольку бринзоламид и его основной метаболит выводятся преимущественно почками, Бринзопт противопоказан для пациентов с указанными состояниями.

Эффективность и безопасность препарата Бринзопт у **пациентов в возрасте от 0 до 17 лет** не были установлены. Не рекомендуется применение препарата у данной группы пациентов.

Побочное действие:

В клинических исследованиях, включающих более 2732 пациентов, получавших бринзоламид в качестве монотерапии или дополнительной терапии с тимололом малеатом 5 мг/мл, самыми часто сообщаемыми побочными реакциями были: дисгевзия (6.0%) (горький или необычный вкус) и временное затуманивание зрения (5.4%) после закапывания на протяжении от нескольких секунд до нескольких минут.

Частота побочных реакций, приведенная далее, определяется с помощью следующих категорий частоты: очень часто (≥1/10); часто (≥1/100 и <1/10); нечасто (≥1/1000 и <1/100); редко (≥1/10 000 и <1/1000); очень редко (<1/10 000); с неизвестной частотой (не может быть оценена на основе имеющихся данных). В каждой группе частоты, побочные реакции представлены в порядке частоты встречаемости. Побочные реакции были получены из клинических исследований и из пострегистрационных спонтанных сообщений.

Инфекции и заражения: нечасто - назофарингит, фарингит, синусит; с неизвестной частотой - ринит.

Со стороны системы кроветворения: нечасто - снижение количества красных кровяных клеток, увеличение содержания хлора в плазме.

Со стороны иммунной системы: с неизвестной частотой - гиперчувствительность.

Со стороны обмена веществ и питания: с неизвестной частотой - пониженный аппетит.

Психические расстройства: нечасто - апатия, депрессия, подавленное настроение, снижение либидо, ночные кошмары, нервозность; редко - бессонница.

Со стороны нервной системы: нечасто - моторная дисфункция, амнезия, головокружения, парестезия, головная боль; редко - нарушения памяти, сонливость; с неизвестной частотой - тремор, гипоэстезия, агевзия.

Со стороны органа зрения: часто - затуманивание зрения, раздражение глаз, боль в глазах, ощущение инородного тела в глазах, глазная гиперемия; нечасто - эрозия роговицы, кератит, точечный кератит, кератопатия, накопления в глазу, окрашивание роговицы, дефект эпителия роговицы, нарушения целостности эпителия роговицы, блефарит, зуд глаз, конъюнктивит, отек конъюнктивы, мейбомит, светобоязнь, аллергический конъюнктивит, накопление пигмента в роговице при проведении диагностических проб для подтверждения нарушения целостности эпителия роговицы, птеригиум, пигментация склеры, астенопия, дискомфорт в глазах, необычное ощущение в глазу, синдром сухого глаза, субконъюнктивальные кисты, конъюнктивальная инъекция, зуд век, выделения из глаз, корочка на краях век, слезотечение; редко - отек роговицы, диплопия, снижение остроты зрения, фотопсии, гипестезия, отек периорбитальной области, повышение внутриглазного давления, изменение соотношения диаметров экскавации к диаметру диска зрительного нерва; с неизвестной частотой - нарушения со стороны роговицы, нарушение зрения, аллергические проявления со стороны глаз, мадароз, нарушения со стороны век, эритема век.

Со стороны органа слуха и лабиринта: редко - звон в ушах; с неизвестной частотой - головокружение.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: нечасто - кардиореспираторный дистресс-синдром, брадикардия, учащенное сердцебиение; редко - стенокардия, нарушение ритма сердечных сокращений; с неизвестной частотой - аритмия, тахикардия, гипертензия, повышение АД, снижение АД, увеличение частоты сердечных сокращений.

Со стороны органов дыхания, грудной клетки и средостения: нечасто - одышка, носовое кровотечение, ротоглоточная боль, глоточно-гортанная боль, раздражение в горле, синдром кашля верхних дыхательных путей, насморк, чиханье; редко - гиперактивность бронхов, чувство заложенности в области верхних дыхательных путей, отек слизистой околоносовых пазух, заложенность носа, кашель, сухость в носу; с неизвестной частотой - бронхиальная астма.

Со стороны ЖКТ: часто - дисгевзия; нечасто - эзофагит, диарея, тошнота, рвота, диспепсия, боль в верхней части живота, дискомфорт в животе, дискомфорт в желудке, метеоризм, частое опорожнение кишечника, желудочно-кишечные расстройства, снижение чувствительности в области рта, парестезия в области рта, сухость во рту.

Со стороны гепатобилиарной системы: с неизвестной частотой - изменение результатов анализа функционального состояния печени.

Со стороны кожи и подкожно-жировой клетчатки: нечасто - сыпь, макуло-папулезная сыпь, ощущение стянутости кожи; редко - крапивница, выпадение волос, генерализованный зуд; с неизвестной частотой - дерматит, эритема.

Со стороны скелетно-мышечной системы и соединительной ткани: нечасто - боль в спине, мышечные спазмы, миалгия; с неизвестной частотой - артралгия, боль в конечностях.

Со стороны функции почек и мочевыводящих путей: нечасто - боль в области почек; с неизвестной частотой - поллакиурия.

Со стороны репродуктивной системы: нечасто - эректильная дисфункция.

Общие нарушения: нечасто - боль, дискомфорт в груди, повышенная утомляемость, необычные ощущения; редко - боль в груди, ощущение тревоги, астения, раздражительность; с неизвестной частотой - периферические отеки, недомогание.

Травмы, отравления и осложнения в ходе инстилляции: нечасто - ощущение инородного тела в глазу.

Описание отдельных побочных реакций

Дисгевзия (горький или необычный привкус во рту после закапывания) является наиболее распространенной системной побочной реакцией, отмеченной в ходе клинических исследований бринзоламида. Скорее всего, она связана с прохождением глазных капель в носоглотку через носослезный канал. Носослезная окклюзия или легкое закрытие век после закапывания может помочь в снижении частоты появления данного эффекта.

Бринзопт является ингибитором карбоангидразы с сульфонамидной структурой, отмечается его экскреция в системный кровоток. Побочные эффекты в отношении ЖКТ, нервной системы, гематологических показателей, почек, а также метаболические нарушения в основном отмечались при системном применении ингибиторов карбоангидразы. Побочные эффекты, отмеченные при пероральном применении ингибиторов карбоангидразы, могут возникнуть и после местного применения в офтальмологии.

Не были замечены неожиданные побочные реакции при использовании бринзоламида в качестве дополнительной терапии к травопросту. Наблюдаемые побочные реакции при применении дополнительной терапии были замечены после применения каждого действующего вещества в отдельности.

Применение в педиатрии

В малочисленных краткосрочных клинических исследованиях примерно у 12.5% педиатрических пациентов наблюдались побочные реакции, большинство из которых были местными, несерьезными глазными реакциями, такими как конъюнктивальная инъекция, раздражение глаз, выделения из глаз и слезотечение.

Передозировка:

Не было отмечено случаев передозировки при местном применении.

Симптомы: могут развиться электролитный дисбаланс, ацидоз, возможны нарушения со стороны нервной системы.

Лечение: симптоматическая и поддерживающая терапия. Необходимо контролировать плазменные концентрации электролитов (в особенности калия) и pH крови.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Фертильность

По результатам исследований на животных не получено сведений о влиянии бринзоламида на фертильность. Не проводилось исследований по оценке влияния раствора бринзоламида для местного офтальмологического применения на фертильность у человека.

Беременность

Нет достоверных данных относительно применения бринзоламида у беременных женщин. В исследованиях на животных получены данные о репродуктивной токсичности после системного применения. Бринзоламид не рекомендуется к применению во время беременности и женщинами детородного возраста, не использующими средства контрацепции.

Период грудного вскармливания

Неизвестно, выделяется ли бринзоламид/его метаболиты в грудное молоко после инстилляции в конъюнктивальную полость. В исследованиях на животных продемонстрирована экскреция минимальных уровней бринзоламида в грудное молоко после перорального применения.

В связи с возможностью появления побочных эффектов у грудного ребенка в ходе лечения матери каплями Бринзопт, 10 мг/мл, должно быть принято решение о прекращении грудного вскармливания или о прекращении лечения, принимая во внимание важность лечения для матери и важность грудного вскармливания для ребенка.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Специальные исследования относительно взаимодействия препарата Бринзопт с другими лекарственными средствами не проводились. В клинических исследованиях, где бринзоламид применялся одновременно с офтальмологическими препаратами - аналогами простагландина и тимололом, не было отмечено неблагоприятного взаимодействия. Исследования совместного применения бринзоламида с миотиками или адренергическими препаратами не проводились.

Изоферменты цитохрома Р450, ответственного за метаболизм бринзоламида, включают CYP3A4 (в основном), CYP2A6, CYP2C8 и CYP2C9. Ожидается, что ингибиторы CYP3A4, такие как кетоконазол, итраконазол, клотримазол, ритонавир и тролеандомицин, будут ингибировать метаболизм бринзоламида посредством CYP3A4. Рекомендуется соблюдать осторожность при одновременном применении ингибиторов CYP3A4. Тем не менее, накопление бринзоламида маловероятно, т.к. выведение осуществляется почками. Бринзоламид не является ингибитором изоферментов цитохрома Р450.

Особые указания и меры предосторожности:

Бринзопт является ингибитором карбоангидразы с сульфонамидной структурой, и хотя он применяется местно, может поступать в системный кровоток. Те же типы побочных реакций, которые относятся к сульфонамидам, могут возникнуть и в случае местного применения бринзоламида. Если появляются признаки серьезных реакций гиперчувствительности, рекомендуется прекратить применение данного препарата.

Были зарегистрированы нарушения кислотно-щелочного баланса при пероральном применении ингибиторов карбоангидразы. Препарат следует применять с осторожностью у пациентов с риском развития почечной недостаточности из-за возможного развития метаболического ацидоза.

Бринзоламид не изучался у недоношенных новорожденных (гестационный возраст менее 36 недель) или у детей в возрасте до 1 недели. Пациенты с аномалиями или значительной незрелостью почечных канальцев могут получать лечение бринзоламидом только после тщательной оценки соотношения риск/польза, т.к. существует риск развития метаболического ацидоза.

Существует потенциальный аддитивный эффект известных системных эффектов ингибирования карбоангидразы у пациентов, получавших ингибиторы карбоангидразы одновременно внутрь и местно. Одновременное применение бринзоламида и ингибиторов карбоангидразы для приема внутрь не изучалось и не рекомендуется.

Бринзоламид оценивался изначально при совместном применении с тимололом в качестве дополнительной терапии глаукомы. Кроме того, был изучен эффект снижения внутриглазного давления бринзоламида, применяемого в качестве дополнительной терапии к аналогу простагландина, травопросту. Нет доступных долгосрочных данных относительно применения бринзоламида в качестве дополнительной терапии к травопросту.

Опыт применения бринзоламида в лечении пациентов с псевдоэксфолиативной или пигментной глаукомой ограничен. Рекомендуется соблюдать осторожность при применении препарата Бринзопт у таких пациентов и осуществлять тщательный контроль внутриглазного давления. Бринзоламид не изучался у пациентов с узкоугольной глаукомой и его применение не рекомендуется у пациентов с указанной патологией.

Возможное влияние бринзоламида на эндотелий роговицы не было исследовано у пациентов с поврежденной роговицей (в особенности у пациентов со снижением количества эндотелиальных клеток).

Применение бринзоламида у пациентов, которые носят контактные линзы, не изучалось. Рекомендуется тщательное наблюдение при использовании бринзоламида у таких пациентов, поскольку ингибиторы карбоангидразы могут влиять на степень увлажнения роговицы, что при ношении контактных линз может увеличивать риск травмы роговицы. Требуется тщательный мониторинг состояния пациентов с высоким риском повреждения роговицы, таких как пациенты с сахарным диабетом и дистрофиями роговицы.

Бензалкония хлорид, который часто используется в офтальмологических препаратах в качестве консерванта, может вызывать точечную кератопатию и/или токсическую язвенную кератопатию. Поскольку Бринзопт содержит бензалкония хлорид, необходим тщательный мониторинг в случае частого или длительного применения у пациентов с синдромом сухого глаза или в случаях повреждения роговицы. Бензалкония хлорид может изменить цвет мягких контактных линз. Пациентов следует проинформировать о том, что необходимо вынимать мягкие контактные линзы перед применением препарата Бринзопт и устанавливать их снова через 15 мин после закапывания.

Не были изучены возможные эффекты синдрома отмены после прекращения лечения препаратом Бринзопт; ожидается, что эффект снижения внутриглазного давления продлится 5-7 дней.

Использование в педиатрии

Эффективность и безопасность препарата Бринзопт у пациентов в возрасте от 0 до 17 лет не были установлены. Не рекомендуется применение препарата у данной группы пациентов.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Бринзопт оказывает незначительное влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами.

Временное затуманивание зрения или другие нарушения зрения могут повлиять на способность управлять автомобилем. Если после закапывания отмечается затуманенное зрение, пациенту следует должен подождать до тех пор, пока зрение не восстановится, перед тем как управлять автомобилем или работать с техникой.

Ингибиторы карбоангидразы для приема внутрь могут повлиять на способность выполнять задачи, требующие концентрации внимания и/или высокой координации движений. Бринзопт поступает в системный кровоток и, таким образом, данные явления могут возникнуть после местного применения.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в оригинальной упаковке в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°C. Не использовать после истечения срока годности.

После вскрытия флакон следует использовать в течение 4 недель.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Brinzopt