ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування лікарського засобу

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 pH); 1 М розчин натрію гідроксиду (для корекції pH); вода для ін'єкцій.

Лікарська форма. Краплі очні, розчин.
Основні фізико-хімічні властивості: прозорий розчин, злегка зеленувато-жовтого кольору без видимих часток.

Фармакотерапевтична група. Симпатоміметики для лікування глаукоми.
Код АТХ S01E A05.

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 із ксенотрансплантатами сітківки у людей.
Місцеве застосування бримонідину тартрату зменшує внутрішньоочний тиск у людей при незначному впливі на серцево-судинну та респіраторну систему.
Клінічні дані щодо безпечного застосування препарату при бронхіальній астмі обмежені.
Внутрішньоочний тиск (ВОТ) починає знижуватися 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.
Після закапування 0,2 % розчину препарату 2 рази на добу протягом 10 днів його концентрація у плазмі крові була низькою (середнє C_{max} становило 0,06 нг/мл). Після багаторазового застосування (2 рази на добу протягом 10 днів) спостерігалася незначна кумуляція бримонідину у крові. Площа під фармакокінетичною кривою через 12 годин у стаціонарній фазі ($AUC_{0–12\ год}$) становила 0,31 нг год/мл порівняно з 0,23 нг год/мл після застосування першої дози. Після місцевого застосування середній період напіввиведення із системного кровотоку становив приблизно 3 години.
Зв'язування бримонідину з протеїнами плазми крові після місцевого застосування становить приблизно 29 %.
Бримонідин оборотно 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 була у 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 відзначалося значного відхилення C_{max} плазми та AUC пропорційно до дози.
Пацієнти літнього віку. Після застосування разової дози C_{max} плазми, AUC та період напіввиведення бримонідину у пацієнтів літнього віку (від 65 років) не відрізнялися від таких показників у пацієнтів молодшого віку. Це свідчить про те, що вік не впливає на системну абсорбцію препарату та його виведення.

Клінічні характеристики.

Показання.

Застосовувати для зниження підвищеного внутрішньоочного тиску у пацієнтів із відкритокутовою глаукомою або підвищеним очним тиском:

- у вигляді монотерапії, якщо місцеве застосування бета-блокаторів протипоказано;
- у складі комбінованої терапії з іншими лікарськими засобами, що знижують внутрішньоочний тиск, якщо зниження тиску при застосуванні цих препаратів недостатнє.

Протипоказання.

Гіперчутливість до діючої речовини або до допоміжних речовин лікарського засобу.

Одночасне застосування з інгібіторами моноаміноксидази (МАО) та антидепресантами, що впливають на норадренергічну передачу (наприклад, із трициклічними антидепресантами та міансерином).

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Хоча специфічна взаємодія бримонідину з лікарськими засобами не досліджувалася, слід враховувати можливість адитивного або посилюючого впливу препарату на дію депресантів центральної нервової системи (алкоголю, барбітуратів, опіатів, седативних засобів та анестетиків).

Дані про рівень катехоламінів у плазмі крові після застосування бримонідину відсутні. Однак бримонідин слід призначати з обережністю 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 відзначалося клінічно незначне зниження артеріального тиску. З обережністю призначати одночасно бримонідин та гіпотензивні засоби та/або серцеві глікозиди.

Рекомендовано спостереження на початку лікування (або при збільшенні дози препарату) при комбінованій терапії із 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 − ізопреналіном, празозином).

Особливості застосування.

Обережно слід застосовувати лікарський засіб пацієнтам з тяжкими 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 тромбоангіїтом.

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

Люксфен® містить бензалконію хлорид.

1 мл лікарського засобу містить 0,05 мг бензалконію хлориду, що еквівалентно 0,25 мг / 5 мл.

Бензалконію хлорид може поглинатись м’якими контактними лінзами і змінювати їх колір. Контактні лінзи слід зняти перед використанням препарату і одягнути їх знову через
15 хвилин після використання.

Бензалконію хлорид також може спричинити подразнення очей, особливо якщо наявна сухість очей або патології рогівки (передньої прозорої частини ока). У разі відчуття дискомфорту, печіння або болю в очах після використання цього лікарського засобу, слід звернутися до лікаря.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Досліджень щодо безпеки застосування препарату вагітним жінкам не проводились, тому Люксфен® не слід застосовувати у період вагітності. Невідомо, чи проникає бримонідин у грудне молоко, тому препарат не слід застосовувати у період годування груддю.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

Бримонідин може спричинити підвищену втомлюваність, сонливість, затуманення або порушення зору, що може вплинути на здатність керувати транспортними засобами чи працювати з іншими механізмами.

Спосіб застосування та дози.
По 1 краплі бримонідину закапувати в уражене око 2 рази на добу через рівні проміжки часу (приблизно через 12 годин). Корекція дози для пацієнтів літнього віку не потрібна.
Як і при застосуванні будь-яких очних крапель, для зменшення можливої системної абсорбції препарату рекомендовано протягом 1 хвилини натискати на слізний мішечок у медіальному куті очної щілини. Це необхідно зробити безпосередньо після закапування кожної краплі препарату. Якщо призначено більше одного виду очних крапель, їх слід закапувати з інтервалом 5–15 хвилин.

Діти.
Клінічні дослідження у дітей не проведені, ефективність та безпека застосування дітям не встановлені.

Передозування.
Передозування при офтальмологічному застосуванні.
При місцевому застосуванні у дорослих передозування не спостерігалося.
Відомі 2 випадки виникнення побічних ефектів після випадкового перорального застосування 9–10 крапель бримонідину дорослими пацієнтами. У них спостерігалося значне зниження артеріального тиску, в одного з пацієнтів приблизно через 8 годин після застосування препарату відзначалося підвищення артеріального тиску. Протягом 24 годин стан обох пацієнтів повністю нормалізувався. У третього пацієнта, який випадково прийняв перорально невідому кількість препарату, не відзначалося ніяких побічних ефектів. Відомі випадки виникнення серйозних побічних ефектів у дітей при випадковому пероральному застосуванні бримонідину. У них спостерігалися такі симптоми: пригнічення центральної нервової системи (ЦНС), типова недовготривала кома або стан, близький до втрати свідомості; млявість, сонливість, артеріальна гіпотензія, 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. Лікування симптоматичне.

Побічні реакції.
З боку серця: відчуття серцебиття/аритмії (у тому числі брадикардія та тахікардія), артеріальна гіпертензія, артеріальна гіпотензія.
З боку нервової системи: головний біль, сонливість, запаморочення, дисгевзія, синкопе.
З боку органів зору: подразнення очей (гіперемія, запалення та печіння, свербіж, відчуття стороннього тіла, фолікулярний кон’юнктивіт), розпливчасте 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 сльозотеча), фотофобія, ерозія рогівки та кератопатія, сухість в очах, блідість кон’юнктиви, порушення зору, кон’юнктивіт, ірит, міоз, іридоцикліт, свербіж повік.
З боку шкіри та підшкірної клітковини: шкірна реакція, у тому числі еритема, набряк обличчя, свербіж, висипання, вазодилатація.
З боку дихальної системи: симптоми захворювання верхніх дихальних шляхів, сухість слизової оболонки носа, диспное.
З боку травного тракту: сухість у роті, гастроінтестинальні симптоми.
Загальні розлади: підвищена втомлюваність, астенія.
З боку імунної системи: системні алергічні реакції (підвищена чутливість).
З боку психіки: депресія, безсоння.

Термін придатності. 3 роки. Після першого відкриття – 28 днів.

Умови зберігання. Зберігати при температурі не вище 25 °С у захищеному від світла місці. Зберігати у недоступному для дітей місці.
Упаковка. По 5 мл у пляшці; по 1 пляшці в картонній коробці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. ТОВ «Сантоніка».

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.
Вул. Вієверу 134 В, LT-46353, Каунас, Литва.