

## Атозибан



### Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#) [Апрель](#)  
[Госреестр](#) [Википедия](#)  
[РЛС VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)<sup>англ</sup>

### Форма выпуска:

#### Форма выпуска, описание и состав

**Концентрат для приготовления раствора для инфузий** бесцветный, прозрачный.

	<b>1 мл</b>
атосибан	7.5 мг

Вспомогательные вещества: маннитол - 50 мг, хлористоводородной кислоты раствор 1М - до pH 4.5, вода д/и - до 1 мл.

0.9 мл - флаконы стеклянные (1) - пачки картонные.

5 мл - флаконы стеклянные (1) - пачки картонные.

### Фармакологические свойства:

#### Фармакодинамика

Средство, угнетающее родовую деятельность, блокатор окситоциновых рецепторов. Атозибан - синтетический пептид, являющийся конкурентным антагонистом человеческого окситоцина на уровне рецепторов. Атозибан, связываясь с рецепторами окситоцина, снижает частоту маточных сокращений и тонус миометрия, приводя к подавлению сократимости матки. Также атозибан связывается с рецепторами вазопрессина, угнетая эффект вазопрессина, но при этом не оказывает влияния на сердечно-сосудистую систему.

В случае развития преждевременных родов у женщины атозибан в рекомендованных дозах подавляет сокращения матки и обеспечивает матке функциональный покой. Расслабление матки начинается сразу после введения атосибана, в течение 10 минут сократительная активность миометрия значительно снижается, поддерживая стабильный функциональный покой матки ( $\leq 4$  сокращений в час) в течение 12 ч.

#### Фармакокинетика

Фармакокинетические показатели ( $V_d$ , клиренс и  $T_{1/2}$ ) не зависят от дозы. После в/в инфузии (300 мкг/ми в течение 6-12 ч)  $C_{max}$  атосибана в плазме достигается в течение 1 ч после начала инфузии (в среднем  $442 \pm 73$  нг/мл, в интервале от 298 до 533 нг/мл). Связывание с белками плазмы составляет 46-48 %. Атозибан проникает через плацентарный барьер. После введения атосибана со скоростью 300 мкг/мин соотношение концентрации атосибана в организме плода и концентрации атосибана в организме матери составляет 0.12. Среднее значение  $V_d$  составляет  $18.3 \pm 6.8$  л.

В плазме крови и в моче идентифицировано 2 метаболита. Соотношение концентрации основного метаболита М1 и концентрации атосибана в плазме крови составило 1.4 и 2.8 на втором часу инфузии и после ее прекращения соответственно. Метаболит М1 обладает фармакологической активностью наравне с атосибаном и выделяется с грудным молоком.

Ингибирование атозибаном изоферментов системы цитохрома P450 маловероятно.

После прекращения инфузии концентрация препарата в плазме быстро снижается со значениями  $T_{1/2\alpha}$ -фаза и  $T_{1/2\beta}$ -фаза  $0.21 \pm 0.01$  и  $1.7 \pm 0.3$  ч соответственно. Среднее значение клиренса составляет  $41.8 \pm 8.2$  л/ч.

Атозибан определяется в моче в очень малых количествах, его концентрация в моче в 50 раз ниже концентрации M1. Количество атозибана, выведенного с калом, не определялось

## Показания к применению:

При угрозе преждевременных родов у беременных: регулярные сокращения матки продолжительностью не менее 30 сек и частотой более 4 в течение 30 мин; раскрытие шейки матки от 1 до 3 см (0-3 см для нерожавших женщин); возраст старше 18 лет; срок беременности от 24 до 33 полных недель; нормальная ЧСС у плода.

## Противопоказания:

Срок беременности менее 24 или более 33 полных недель; преждевременный разрыв оболочек при беременности сроком более 30 недель; внутриутробная задержка развития плода; аномальная ЧСС у плода; маточное кровотечение, требующее немедленного родоразрешения; эклампсия и тяжелая преэклампсия, требующая немедленного родоразрешения; внутриутробная смерть плода; подозрение на внутриматочную инфекцию; предлежание плаценты; отслойка плаценты; любые состояния матери и плода, при которых сохранение беременности представляет опасность; грудное вскармливание; повышенная чувствительность к атозибану.

## Способ применения и дозы:

Вводят в/в сразу же после того как поставлен диагноз "преждевременные роды" в три этапа: 1) вначале в течение 1 мин вводят в начальной дозе 6.75 мг; 2) сразу после этого в течение 3 ч проводится инфузия в дозе 300 мкг/мин (скорость введения 24 мл/ч, доза атозибана 18 мг/ч); 3) после этого проводится продолжительная (до 45 ч) инфузия атозибана в дозе 100 мкг/мин (скорость введения 8 мл/ч, доза атозибана 6 мг/ч).

Общая продолжительность лечения не должна превышать 48 ч. Максимальная доза атозибана на весь курс составляет 330 мг.

Если возникает необходимость в повторном применении атозибана, также следует начинать с 1 этапа, за которым будет следовать инфузионное введение (этапы 2 и 3). Повторное применение можно начинать в любое время после первого применения препарата, повторять его можно до 3 циклов. Если после 3-х циклов терапии атозибаном сократительная активность матки персистирует, следует рассмотреть вопрос о применении другого препарата.

## Побочное действие:

*Со стороны пищеварительной системы:* очень часто ( $>1/10$ ) - тошнота, реже - рвота.

*Со стороны обмена веществ:* часто ( $>1/100$ ,  $<1/100$ ) - гипергликемия.

*Со стороны нервной системы:* часто ( $>1/100$ ,  $<1/100$ ) - головная боль, головокружение; редко ( $>1/1000$ ,  $<1/100$ ) - бессонница.

*Со стороны сердечно-сосудистой системы:* часто ( $>1/100$ ,  $<1/100$ ) - тахикардия, артериальная гипотензия, приливы.

*Со стороны кожи:* редко ( $>1/1000$ ,  $<1/100$ ) - зуд, кожная сыпь.

*Со стороны половой системы:* очень редко ( $>1/10\ 000$ ,  $<1/1000$ ) - маточное кровотечение, атония матки.

*Прочие:* очень редко ( $>1/10\ 000$ ,  $<1/1000$ ) - аллергические реакции.

## Применение при беременности и кормлении грудью:

Атозибан следует применять только в случае диагностированных преждевременных родов сроком от 24 до 33 полных недель беременности.

Атозибан противопоказан в период лактации (грудного вскармливания).

## **Взаимодействие с другими лекарственными средствами:**

Совместное применение атосибана с алкалоидами спорыньи нецелесообразно в связи с противоположным фармакологическим действием и показаниями к применению.

## **Особые указания и меры предосторожности:**

В случае подозрения на преждевременный разрыв оболочек пользу от применения атосибана для пролонгирования родов следует сопоставить с потенциальным риском развития хориоамнионита.

С осторожностью применять атосибан при многоплодной беременности, а также при сроке беременности 24-27 недель (из-за отсутствия достаточного клинического опыта).

В случае персистирующих сокращений матки во время введения атосибан следует проводить мониторинг сокращений матки, а также следить за ЧСС плода. Также следует рассмотреть возможность использования других препаратов.

Опыт применения атосибана у пациенток с нарушением функции печени и почек отсутствует.

Атосибан не применяется в случаях аномального прикрепления плаценты.

В случае внутриутробной ретардации плода, решение о продолжении введения или о повторном введении атосибана зависит от оценки зрелости плода.

Как антагонист окситоцина, атосибан теоретически может способствовать релаксации матки и спровоцировать послеродовое маточное кровотечение, поэтому следует постоянно проводить оценку степени кровопотери после родов.

*Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами*

Атосибан не влияет на способность управлять автомобилем и механизмами.

**Источник:** <http://drugs.thead.ru/Atoziban>