Атозибан



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Форма выпуска, описание и состав

Концентрат для приготовления раствора для инфузий бесцветный, прозрачный.

	1 мл
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. Атосибан - синтетический пептид, являющийся конкурентным антагонистом человеческого окситоцина на уровне рецепторов. Атосибан, 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 атосибан 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 (≤ 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 ± 73 нг/мл, в интервале от 298 до 533 нг/мл). Связывание с белками плазмы составляет 46-48 %. Атосибан 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 ± 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 атосибаном изоферментов системы цитохрома Р450 маловероятно.

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

Атосибан определяется в моче в очень малых количествах, его концентрация в моче в 50 раз ниже концентрации М1. Количество атосибана, 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 атосибану.

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 атосибана 18 мг/ч); 3) после этого проводится продолжительная (до 45 ч) инфузия атосибана в дозе 100 мкг/мин (скорость введения 8 мл/ч, доза атосибана 6 мг/ч).

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

Если возникает необходимость в повторном применении атосибана, 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 атосибаном 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:

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

Атосибан 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