Фенотерол-Натив



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

Раствор для ингаляций прозрачный, бесцветный или со слабым желтоватым оттенком.

	1 мл
фенотерола гидробромид	1 мг

Вспомогательные вещества: натрия бензоат - 0.5 мг, динатрия эдетата дигидрат - 0.554 мг (соответствует динатрия эдетату - 0.5 мг), лимонной кислоты моногидрат - 1.64 мг (соответствует лимонной кислоте безводной - 1.5 мг), вода д/и - до 1 мл.

20 мл - флаконы темного стекла (1) с капельницей - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Фенотерол-натив является эффективным бронхолитическим средством для предупреждения и купирования приступов бронхоспазма при бронхиальной астме и других заболеваниях, сопровождающихся обратимой обструкцией дыхательных путей, таких как хроническая обструктивная болезнь легких, хронический бронхит, эмфизема легких.

Фенотерол - селективный стимулятор β_2-адренорецепторов. При применении препарата в более высоких дозах происходит стимуляция β_1-адренорецепторов (например, при назначении для токолитической терапии). Механизм действия связан с активацией аденилатциклазы через стимуляторный G_s-белок с последующим увеличением образования циклического аденозинмонофосфата (цАМФ), который активирует протеинкиназу А, последняя лишает миозин способности соединяться с актином, что препятствует сокращению гладкой мускулатуры и способствует бронхолитическому действию и устранению бронхоспазма.

Кроме того, фенотерол ингибирует высвобождение из тучных клеток медиаторов воспаления, тем самым оказывая защитное действие от влияния таких бронхоконстрикторов, как гистамин, метахолин, холодный воздух и аллергены. Применение фенотерола в дозе 0.6 мг повышает активность мерцательного эпителия бронхов и ускоряет мукоцилиарный транспорт.

За счет стимулирующего влияния на β-адренорецепторы фенотерол может оказывать действие на миокард (особенно в дозах, превышающих терапевтические), вызывая учащение и усиление сердечных сокращений.

Фенотерол предупреждает и быстро купирует бронхоспазм различного генеза. Начало действия после ингаляции - через 5 мин, максимум - 30-90 мин, продолжительность действия - 3-5 ч.

Фармакокинетика

Всасывание

10-30% активного вещества, освобождаемого из аэрозольного препарата после ингаляции, достигает нижних дыхательных путей в зависимости от метода ингаляции и используемой ингаляционной системы, а остальная часть депонируется в верхних дыхательных путях и проглатывается. В результате некоторое количество ингалируемого фенотерола попадает в ЖКТ. После ингаляции одной дозы препарата степень всасывания составляет 17% от введенной дозы. Всасывание носит двухфазный характер: 30% фенотерола гидробромида быстро всасывается с $T_{1/2}$ 11 мин, 70% - всасывается медленно с $T_{1/2}$ 120 мин. Не существует корреляции между концентрациями фенотерола в плазме крови, достигаемыми после ингаляции, и фармакодинамической кривой "время-эффект". Длительный (3-5 ч) бронхорасширяющий эффект препарата после ингаляции, сравнимый с соответствующим эффектом, достигаемым после в/в введения, не поддерживается высокими концентрациями активного вещества в системном кровотоке.

Распределение

Связывание с белками плазмы - 40-55%. В неизмененном виде фенотерол может проникать через плацентарный барьер и попадать в грудное молоко.

Метаболизм

При проглатывании активное вещество подвергается биотрансформации вследствие эффекта "первого прохождения" через печень. Метаболизирустся в печени. Таким образом, проглоченное количество препарата не оказывает влияние на концентрацию активного вещества в плазме крови, достигаемую после ингаляции. Биотрансформация фенотерола у человека протекает исключительно путем конъюгации с сульфатами преимущественно в стенке кишечника.

Выведение

Выводится почками и с желчью в виде неактивных сульфатных конъюгатов. Выделение фенотерола с мочой (0.27 л/мин) соответствует приблизительно 15% от среднего общего клиренса системно доступной дозы. Объем почечного клиренса свидетельствует о тубулярной секреции фенотерола дополнительно к гломерулярной фильтрации.

Показания к применению:

— приступы бронхиальной астмы или иные состояния с обратимой обструкцией дыхательных путей, такие как хроническая обструктивная болезнь легких, обструктивный бронхит, эмфизема легких;

— профилактика приступов бронхиальной астмы вследствие физического напряжения;

— в качестве бронхорасширяющего средства перед ингаляцией других лекарственных средств (антибиотиков, муколитических средств, ГКС);

— проведение бронходилатационных тестов при исследовании функции внешнего дыхания.

Относится к болезням:

- Бронхит
- Хроническая обструктивная болезнь легких
- Эмфизема легких

Противопоказания:

— гиперчувствительность к фенотеролу или любому компоненту препарата;

— гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия;

— тахиаритмия;

— возраст до 18 лет.

С *осторожностью:* гипертиреоз; артериальная гипотензия; артериальная гипертензия; атония кишечника; гипокалиемия; сахарный диабет; недавно перенесенный инфаркт миокарда (в течение последних 3 месяцев); заболевание сердца и сосудов, такие как хроническая сердечная недостаточность, ИБС, заболевания коронарных артерий, пороки сердца (в т.ч. аортальный стеноз); выраженные поражения церебральных и периферических артерий; феохромоцитома; глаукома.

Способ применения и дозы:

Препарат Фенотерол-натив предназначен только для ингаляционного введения.

20 капель = 1 мл.

1 капля = 50 мкг фенотерола гидробромида.

Дозы следует подбирать соответственно индивидуальным потребностям больного; кроме того, во время лечения больной должен находиться под наблюдением врача.

Приступы бронхиальной астмы и другие состояния, сопровождающиеся обратимой обструкцией дыхательных путей

Ингаляционно. 0.5 мл (10 капель = 0.5 мг фенотерола гидробромида) в большинстве случаев достаточно для немедленного купирования приступа.

При необходимости повторного назначения препарата ингалируют по 0.5 мл (10 капель = 0.5 мг фенотерола гидробромида) до 4 раз/сут, однако возможно уменьшение индивидуальной дозы в зависимости от эффективности лечения.

В тяжелых случаях, если доза 1 мл (20 капель) оказывается неэффективной, могут потребоваться более высокие дозы от 1 до 1.25 мл (20-25 капель = 1-1.25 мг фенотерола гидробромида).

В исключительно тяжелых случаях, если доза до 2 мл (40 капель) оказывается неэффективной, ингалируют под наблюдением врача 2 мл (40 капель = 2 мг фенотерола гидробромида).

Профилактика приступов бронхиальной астмы вследствие физического напряжения

Ингаляционно. 0.5 мл (10 капель = 0.5 мг фенотерола гидробромида) до физической нагрузки.

Лечение начинают, как правило, с наименьшей рекомендуемой дозы.

Рекомендуемую дозу разводят 0.9% раствором натрия хлорида до конечного объема 3-4 мл, распыляют и ингалируют до полного потребления полученного разведения.

Фенотерол-натив не следует разводить дистиллированной водой. Раствор разводят каждый раз заново перед применением; остатки разведенного раствора выливают.

Фенотерол-натив рекомендовано применять с использованием ингаляционного устройства - небулайзера. При наличии кислородно-дыхательной аппаратуры раствор лучше всего ингалировать при скорости потока 6-8 л/мин.

Фенотерол-натив можно ингалировать одновременно с холино- и муколитическими средствами. Это касается, прежде всего, препаратов ипратропия бромид и амброксол в форме растворов для ингаляции.

Побочное действие:

Определение частоты: очень часто (>1/10), часто (от 1/100 до 1/10), нечасто (от 1/1000 до 1/100), редко (от 1/10000 до 1/1000), очень редко (< 1/10000).

Со стороны нервной системы: очень часто - нервозность, тревожность, тремор, головная боль, головокружение; очень редко - возбуждение.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - тахикардия, ощущение сердцебиения; очень редко - аритмия, повышение систолического АД, снижение диастолического АД, ишемия миокарда.

Со стороны обмена веществ и питания: часто - гипокалиемия, гипергликемия.

Со стороны дыхательной системы: нечасто - кашель, раздражение гортани и глотки; редко - парадоксальный бронхоспазм.

Со стороны пищеварительной системы: нечасто - тошнота, рвота.

Со стороны кожи и подкожных тканей: нечасто - аллергические кожные реакции, такие как сыпь, зуд, крапивница; редко - гипергидроз.

Со стороны костно-мышечной системы: нечасто - мышечная слабость, спазм мышц, миалгия.

Со стороны иммунной системы: редко - гиперчувствительность.

Передозировка:

Симптомы: тахикардия, усиленное сердцебиение, снижение или повышение АД, повышение пульсового давления, боль за грудиной, аритмии, ощущение приливов крови к лицу, тремор, метаболический ацидоз, головная боль, головокружение, беспокойство, возбуждение, гипокалиемия.

Лечение: седативные средства, транквилизаторы, в тяжелых случаях проводят интенсивную симптоматическую терапию. В качестве специфических антидотов можно назначать бета-адреноблокаторы (предпочтительно селективные бета$_1$-адреноблокаторы); необходимо учитывать возможность усиления обструкции бронхов и осторожно подбирать дозы этих препаратов у больных, страдающих бронхиальной астмой.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Не было выявлено отрицательного влияния препарата на течение беременности. Тем не менее, беременным женщинам (особенно в I триместре) препарат назначается только в тех случаях, если предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода. Следует учитывать возможность ингибирующего эффекта фенотерола на сократительную активность матки.

Фенотерол проникает в грудное молоко. Безопасность применения препарата в период лактации не изучена. Применение препарата во время лактации возможно только в случаях, когда предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для ребенка.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

ГКС, антихолинергические средства, ксантиновые производные (например, теофиллин), кромоглициевая кислота могут усиливать действие фенотерола.

Бета-адренергические средства, ГКС и диуретики могут усиливать побочные эффекты фенотерола.

Возможно значительное снижение бронхорасширяющего действия Фенотерола-натив при одновременном назначении бета-адреноблокаторов.

Следует с осторожностью назначать бета-агонисты пациентам, получающим ингибиторы МАО или трициклические аптидепрессанты, т.к. эти препараты способны усиливать действие фенотерола.

Ингаляции галогенизированных углеводородных анестетиков (галотан, трихлорэтилен, энфлуран) могут усилить действие фенотерола на сердечно-сосудистую систему. Галотан способствует развитию аритмии.

Одновременное назначение бронхолитиков со сходным механизмом действия приводит к аддитивному эффекту и явлениям передозировки.

Особые указания и меры предосторожности:

Другие симпатомиметические бронходилататоры можно применять одновременно с Фенотеролом-натив только под наблюдением врача.

При острой, быстро усиливающейся одышке пациенту следует немедленно обратиться к врачу.

При длительном применении препарата:

— купирование приступов бронхиальной астмы может быть предпочтительнее регулярного применения препарата (симптоматическое лечение);

— необходимо проводить регулярное обследование пациентов для выявления необходимости дополнительного или более интенсивного противовоспалительного лечения (например, ингаляций ГКС) с целью контроля воспаления дыхательных путей и предупреждения длительных обострений бронхиальной астмы.

В случае усиления обструкции бронхов считается неприемлемым и может быть даже рискованным увеличение кратности приема бета$_2$-агонистов, содержащихся в таких препаратах, как Фенотерол-натив, сверх рекомендуемых доз. В такой ситуации следует пересмотреть план лечения и, особенно, адекватность противовоспалительной терапии.

При лечении бета$_2$-агонистами возможно развитие выраженной гипокалиемии. Особую осторожность следует проявлять при тяжелой бронхиальной астме, т.к. этот эффект может быть усилен сопутствующим применением производных ксантина, ГКС и диуретиков. При гипоксии возможно усиление влияния гипокалиемии на сердечный ритм. В таких ситуациях рекомендуется проводить регулярный контроль концентрации калия в сыворотке крови.

В редких случаях наблюдалась ишемия миокарда, связанная с бета$_2$-агонистами.

Применение фенотерола у пациентов с гипокалиемией, которые получают сердечные гликозиды, может вызвать аритмию.

У больных сахарным диабетом во время лечения необходимо проводить регулярный контроль содержания глюкозы в плазме.

Препарат содержит стабилизатор динатрия эдетат, который у некоторых пациентов может вызывать бронхоспазм.

Применение фенотерола может приводить к положительным результатам тестов на злоупотребление психоактивными препаратами по немедицинским показаниям, а так же на допинг у спортсменов.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Исследований по изучению влияния препарата на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами не проводилось. В случае развития побочных эффектов при применении препарата следует воздержаться от вождения автотранспорта и управления механизмами.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей, защищенном от света месте при температуре не выше 25°С. Не замораживать.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Fenoterol-Nativ