Инструкция по применению
Астмасол Раствор для ингаляций 20 мл

Характеристики



Форма выпуска: Раствор
Страна: Россия
Производитель: Гротекс
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Ипратропия бромид+Фенотерол
Количество в упаковке: 1

Описание

Тюбик-капельница А или флакон - прозрачная, бесцветная или слегка окрашенная жидкость. Ампула Б (растворитель) - прозрачная, бесцветная жидкость. Раствор: тюбик-капельница А + ампула Б (растворитель) - прозрачная, бесцветная или слегка окрашенная жидкость.

Действующее вещество

Ипратропия бромид+Фенотерол

Состав

Состав тюбик-капельницы А или флакона на 1 мл: Действующие вещества: Ипратропия бромида моногидрат 0,261 мг в пересчете на ипратропия бромид 0,25 мг Фенотерола гидробромид 0,5 мг Вспомогательные вещества: Бензалкония хлорид 0,1 мг Динатрия эдетата дигидрат 0,5 мг Натрия хлорид 8,8 мг Хлористоводородной кислоты раствор 1 М до pH 3,0-4,0 Вода для инъекций до 1 мл Состав ампулы Б (растворитель) на 1 мл: Натрия хлорид 9,0 мг Вода для инъекций до 1 мл

Форма выпуска

Раствор

Фармакокинетика

Терапевтический эффект комбинации ипратропия бромида и фенотерола является

следствием его местного действия в дыхательных путях. Развитие бронходилатации не прямопропорционально фармакокинетическим показателям действующих веществ. После ингаляции в легкие обычно попадает (в зависимости от лекарственной формы и метода ингаляции) 10-39% от вводимой дозы препарата. Оставшаяся часть дозы осаждается на мундштуке, в ротовой полости и ротоглотке. Часть дозы, осевшая в ротоглотке, проглатывается и поступает в желудочно-кишечный тракт. Часть дозы препарата, попадающая в легкие, быстро достигает системного кровотока (в течение нескольких минут). Отсутствуют доказательства того, что фармакокинетика комбинированного препарата отличается от таковой каждого из отдельных компонентов. Фенотерол Проглоченная часть дозы метаболизируется до сульфатных конъюгатов. Абсолютная биодоступность при приеме внутрь низкая (около 1,5%). После внутривенного введения свободный и конъюгированный фенотерол составляют в 24-часовом анализе мочи соответственно 15% и 27% от введенной дозы. Общая системная биодоступность ингалируемой дозы фенотерола оценивается в 7%. Кинетические параметры, описывающие распределение фенотерола, рассчитаны по концентрации в плазме после внутривенного введения. После внутривенного введения профили плазменная концентрация-время могут быть описаны 3-камерной фармакокинетической моделью, согласно которой период полувыведения составляет примерно 3 часа. В этой 3-камерной модели кажущийся объем распределения фенотерола в равновесном состоянии (Vdss) приблизительно 189 л (~ 2,7 л/кг). Около 40% фенотерола связывается с белками плазмы. Доклинические исследования показали, что фенотерол и его метаболиты не проникают через гематоэнцефалический барьер. Общий клиренс фенотерола - 1,8 л/мин, почечный клиренс - 0,27 л/мин. Суммарная почечная экскреция (в течение 2 дней) меченой изотопом дозы (включая исходное соединение и все метаболиты) составляла после внутривенного введения 65%. Общая меченая изотопом доза, выделявшаяся через кишечник, составляла после внутривенного введения 14,8%, после приема внутрь - 40,2% в течение 48 часов. Общая меченая изотопом доза, выделявшаяся через почки, составляла после приема внутрь около 39%. Ипратропия бромид Суммарная почечная экскреция (в течение 24 часов) исходного соединения составляет примерно 46% от величины внутривенно вводимой дозы, менее 1% от величины дозы, применяемой внутрь, и примерно 3-13% от величины ингаляционной дозы препарата. Исходя из этих данных, рассчитано, что общая системная биодоступность ипратропия бромида, применяемого внутрь и ингаляционно, составляет 2% и 7-28% соответственно. Таким образом, влияние проглатываемой части ипратропия бромида на системное воздействие незначительно. Кинетические параметры, описывающие распределение ипратропия бромида, вычислялись на основании его концентраций в плазме после внутривенного введения. Наблюдается быстрое двухфазное снижение концентрации в плазме. Кажущийся объем распределения в равновесном состоянии (Vdss) составляет

примерно 176 л (~ 2,4 л/кг). Препарат связывается с белками плазмы в минимальной степени (менее чем на 20%). Доклинические исследования показали, что ипратропия бромид, являющийся четвертичным производным аммония, не проникает через гематоэнцефалический барьер. Период полувыведения в конечной фазе составляет примерно 1,6 часа. Общий клиренс ипратропия бромида составляет 2,3 л/мин, а почечный клиренс - 0,9 л/мин. После внутривенного введения примерно 60% дозы метаболизируется путем окисления, главным образом в печени. Суммарная почечная экскреция (в течение 6 дней) меченой изотопом дозы (включая исходное соединение и все метаболиты) составляла после внутривенного введения 72,1%, после приема внутрь - 9,3%, а после ингаляционного применения - 3,2%. Общая меченая изотопом доза, выделявшаяся через кишечник, составляла после внутривенного введения 6,3%, после приема внутрь - 88,5%, а после ингаляционного применения - 69,4%. Таким образом, экскреция меченой изотопом дозы после внутривенного введения осуществляется, в основном, через почки. Период полувыведения исходного соединения и метаболитов составляет 3,6 часа. Основные метаболиты, выводящиеся с мочой, связываются с мускариновыми рецепторами слабо и считаются неактивными.

Показания

Симптоматическое лечение хронических обструктивных заболеваний дыхательных путей с обратимой обструкцией дыхательных путей, таких как бронхиальная астма и, особенно, хроническая обструктивная болезнь легких, хронический обструктивный бронхит с наличием эмфиземы легких или без нее.

Способ применения и дозы

Лечение должно проводиться под медицинским наблюдением (например, в условиях стационара). Лечение в домашних условиях возможно только после консультации с врачом в тех случаях, когда быстродействующий &beta,-агонист в низкой дозе недостаточно эффективен. Также раствор для ингаляций может быть рекомендован пациентам в случае, когда аэрозоль для ингаляций не может использоваться или при необходимости применения более высоких доз. Доза должна подбираться индивидуально, в зависимости от остроты приступа. Лечение обычно должно начинаться с наименьшей рекомендуемой дозы и прекращаться после того, как достигнуто достаточное уменьшение симптомов. Одно нажатие на диспенсер флакона соответствует 0,1 мл (2 капли): 5 нажатий - 0,5 мл (10 капель), 10 нажатий - 1 мл (20 капель), 20 нажатий - 2 мл (40 капель). Рекомендуются следующие дозы: У взрослых (включая пожилых людей) и подростков старше 12 лет Острые приступы бронхоспазма В зависимости от тяжести приступа дозы могут варьировать от 1 мл до 2,5 мл. В особо тяжелых случаях возможно применение доз, достигающих 4 мл. У

детей в возрасте 6-12 лет Острые приступы бронхиальной астмы В зависимости от тяжести приступа дозы могут варьировать от 0,5 мл до 2 мл. У детей в возрасте младше 6 лет (масса тела которых составляет менее 22 кг) В связи с тем, что информация о применении препарата в этой возрастной группе ограничена, рекомендуется использование следующей дозы (только при условии медицинского наблюдения): 0,1 мл на кг массы тела, но не более 0,5 мл. Учитывая отсутствие полной информации, препарат у детей следует применять только по назначению врача и под наблюдением взрослых. Раствор для ингаляций следует использовать только для ингаляций (с подходящим небулайзером) и не применять перорально. Лечение следует обычно начинать с наименьшей рекомендуемой дозы. Рекомендуемая доза должна разводиться 0,9% раствором натрия хлорида до конечного объема, составляющего 3-4 мл, и применяться (полностью) с помощью небулайзера. Раствор препарата Астмасол, бронхо для ингаляций не должен разводиться дистиллированной водой. Разведение раствора должно осуществляться каждый раз перед применением, остатки разведенного раствора следует уничтожать. Разведенный раствор следует использовать сразу после приготовления. Краткое описание действий по применению препарата во флаконе: 1. Подготовить небулайзер для использования. 2. Поместить содержимое флакона в резервуар небулайзера в необходимой дозе, назначенной врачом. При этом держать флакон в вертикально перевернутом положении (Рис. 1). 3. Добавить растворитель (0,9 % раствор натрия хлорида) в резервуар небулайзера до конечного объема 3-4 мл. 4. Далее следовать инструкции по применению небулайзера. Краткое описание действий по применению тюбик-капельницы А (препарат) и ампулы Б (растворитель): 1. Подготовьте небулайзер для использования. 2. Отделить тюбик-капельницу А (препарат) (Рис. 1). 3. Убедившись, что раствор находится в нижней части тюбик-капельницы А (препарат), вскрыть тюбик-капельницу, вращающими движениями повернув и отделив клапан (Рис. 2). 4. Поместить содержимое тюбик- капельницы А (препарат) в резервуар небулайзера в необходимой дозе, назначенной врачом (Рис. 3). 5. Отделить ампулу Б (растворитель - 0,9 % раствор натрия хлорида) (Рис. 1). Убедившись, что раствор находится в нижней части ампулы Б (растворитель - 0,9 % раствор натрия хлорида), вскрыть ампулу, вращающими движениями повернув и отделив клапан (Рис. 2). 7. Добавить содержимое ампулы Б (растворитель - 0,9 % раствор натрия хлорида) в резервуар небулайзера до конечного объема 3-4 мл. 8. Далее следовать инструкции по применению небулайзера. Длительность ингаляции может контролироваться по расходованию разведенного раствора. Раствор препарата для ингаляций может применяться с использованием различных коммерческих моделей небулайзеров. Доза, достигающая легких, и системная доза зависят от типа используемого небулайзера и могут быть выше, чем соответствующие дозы при использовании дозированного аэрозоля (что зависит от типа ингалятора). В тех случаях, когда

имеется настенный кислород, раствор лучше всего применять при скорости потока 6-8 литров в минуту. Необходимо следовать инструкции по применению, обслуживанию и чистке небулайзера.

Противопоказания

Гиперчувствительность к фенотеролу или атропиноподобным препаратам, или другим компонентам препарата. Гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия. Тахиаритмия. I триместр беременности.

Применение при беременности и кормлении грудью

Данные доклинических исследований и опыт применения комбинации ипратропия бромида и фенотерола показывают, что компоненты лекарственного препарата не оказывают негативного влияния при беременности. Следует учитывать возможность ингибирующего эффекта фенотерола на сократительную активность матки. Препарат противопоказан в I триместре беременности. Следует с осторожностью применять препарат во II и III триместрах беременности. Фенотерол проникает в грудное молоко. Данных, подтверждающих, что ипратропия бромид проникает в грудное молоко, не получено. Однако препарат следует с осторожностью назначать кормящим матерям. Отсутствуют клинические данные о влиянии фенотерола, ипратропия бромида или их комбинации на фертильность. Доклинические исследования не показали влияния ипратропия бромида и фенотерола не фертильность.

Побочные действия

Многие из перечисленных нежелательных эффектов могут быть следствием антихолинергических и &beta,-адренергических свойств препарата. Астмасол, бронхо, как и любая ингаляционная терапия, может вызывать местное раздражение. Самыми частыми побочными эффектами, о которых сообщалось в клинических исследованиях, были кашель, сухость во рту, головная боль, тремор, фарингит, тошнота, головокружение, дисфония, тахикардия, ощущение сердцебиения, рвота, повышение систолического артериального давления и нервозность. Частота побочных реакций, которые могут возникать во время терапии, приведена в виде следующей градации: очень часто (≥ 1/10), часто (≥ 1/100, Нарушения со стороны иммунной системы Редко*: анафилактическая реакция, гиперчувствительность. Нарушения со стороны обмена веществ и питания Редко*: гипокалиемия. Очень редко: повышение глюкозы в сыворотке крови. Нарушения психики Нечасто: нервозность. Редко: возбуждения, ментальные нарушения. Нарушения со стороны нервной системы Нечасто: головная боль, тремор, головокружение. Частота неизвестна: гиперактивность. Нарушения со стороны органа зрения Редко*: глаукома, увеличение внутриглазного давления, нарушения аккомодации, мидриаз, нечеткое зрение, боль в глазах, отек роговицы, гиперемия конъюнктивы, появление ореола вокруг предметов. Нарушения со стороны сердечно-сосудистой системы Нечасто: тахикардия, ощущение сердцебиения. Редко: аритмия, фибрилляция предсердий, наджелудочковая тахикардия*, ишемия миокарда*. Нарушения со стороны органов дыхания, грудной клетки и средостения Часто: кашель. Нечасто: фарингит, дисфония. Редко: бронхоспазм, раздражение глотки, отек глотки, ларингоспазм*, парадоксальный бронхоспазм*, сухость глотки*. Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта Нечасто: рвота, тошнота, сухость во рту. Редко: стоматит, глоссит, нарушения моторики желудочно-кишечного тракта, диарея, запор*, отек полости рта*, изжога. Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей Редко: крапивница, зуд, ангионевротический отек*, гипергидроз*, сыпь, петехии. Нарушения со стороны скелетно-мышечной и соединительной ткани Редко: мышечная слабость, спазм мышц, миалгия. Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей Редко: задержка мочи. Лабораторные и инструментальные данные Нечасто: повышение систолического артериального давления. Редко: повышение диастолического артериального давления. * оценка проведена на основании верхней границы 95% доверительного интервала, рассчитанного по общей популяции пациентов.

Передозировка

Симптомы передозировки обычно связаны преимущественно с действием фенотерола. Возможно появление симптомов, связанных с избыточной стимуляцией &beta,-адренорецепторов. Наиболее вероятно появление тахикардии, сердцебиения, тремора, повышения артериального давления, понижения артериального давления, увеличение различия между систолическим и диастолическим артериальным давлением, стенокардии, аритмии и чувства "приливов" крови к лицу, чувство тяжести за грудиной, усиление бронхообструкции. Также наблюдались метаболический ацидоз и гипокалиемия. Возможные симптомы передозировки, обусловленные ипратропия бромидом (такие как сухость во рту, нарушения аккомодации), выражены слабо и транзиторны, что объясняется его местным применением. Лечение Необходимо прекратить прием препарата. Следует учитывать данные мониторирования кислотно-щелочного баланса крови. Рекомендуется назначение седативных средств, анксиолитических лекарственных средств (транквилизаторов), в тяжелых случаях - интенсивная терапия. В качестве специфического антидота возможно применение &beta,-адреноблокаторов, предпочтительнее селективных &beta,1-адреноблокаторов. Однако у пациентов с бронхиальной астмой или хронической обструктивной болезнью легких следует учитывать возможность усиления бронхиальной обструкции, которая может привести к летальному исходу, под влиянием &beta,-адреноблокаторов и тщательно подбирать их дозу.

Взаимодействие с другими препаратами

Длительное одновременное применение препарата с другими антихолинергическими препаратами не рекомендуется ввиду отсутствия данных. Одновременное применение других &beta,-адреномиметических средств, антихолинергических препаратов системного действия и ксантиновых производных (например, теофиллина) может повышать бронхорасширяющее действие препарата и приводить к усилению побочных эффектов. Возможно значительное ослабление бронхорасширяющего действия препарата при одновременном назначении &beta,-адреноблокаторов. Гипокалиемия, связанная с применением &beta,-адреномиметиков, может быть усилена одновременным назначением ксантиновых производных, глюкокортикостероидов и диуретиков. Этому факту следует уделять особое внимание при лечении пациентов с тяжелыми формами обструктивных заболеваний дыхательных путей. Гипокалиемия может приводить к повышению риска возникновения аритмий у пациентов, получающих дигоксин. Кроме того, гипоксия может усиливать негативное влияние гипокалиемии на сердечный ритм. В подобных случаях рекомендуется проводить мониторирование уровня калия в сыворотке крови. Следует с осторожностью назначать &beta,2-адренергические средства пациентам, получавшим ингибиторы моноаминооксидазы и трициклические антидепрессанты, так как эти препараты способны усиливать действие &beta,-адренергических средств. Ингаляции средств для общей анестезии галогенизированных углеводородных анестетиков, например, галотана, трихлорэтилена или энфлурана, могут усилить влияние &beta,-адренергических средств на сердечно-сосудистую систему. Совместное применение препарата с кромоглициевой кислотой и/или глюкокортикостероидами увеличивает эффективность терапии.

Особые указания

Одышка В случае неожиданного быстрого усиления одышки (затруднений дыхания) следует без промедления обратиться к врачу. Гиперчувствительность После применения препарата могут возникнуть реакции немедленной гиперчувствительности, признаками которой, в редких случаях, могут быть: крапивница, ангионевротический отек, сыпь, бронхоспазм, отек ротоглотки, анафилактический шок. Парадоксальный бронхоспазм Препарат Астмасол, бронхо, как и другие ингаляционные препараты, способен вызвать парадоксальный бронхоспазм, который может угрожать жизни. В случае развития парадоксального бронхоспазма применение препарата следует немедленно прекратить и перейти на альтернативную терапию. Длительное применение У пациентов, страдающих бронхиальной астмой, препарат должен применяться только по мере необходимости. У пациентов с легкой формой хронической обструктивной болезни легких

симптоматическое лечение может оказаться предпочтительнее регулярного применения. У пациентов с бронхиальной астмой следует помнить о необходимости проведения или усиления противовоспалительной терапии для контроля воспалительного процесса дыхательных путей и течения заболевания. Регулярное использование возрастающих доз препаратов, содержащих &beta,2-адреномиметики, таких как Астмасол, бронхо, для купирования бронхиальной обструкции может вызвать неконтролируемое ухудшение течения заболевания. В случае усиления бронхиальной обструкции увеличение дозы &beta,2-агонистов, в том числе препарата Астмасол, бронхо, больше рекомендуемой в течение длительного времени не только не оправдано, но и опасно. Для предотвращения угрожающего жизни ухудшения течения заболевания следует рассмотреть вопрос о пересмотре плана лечения пациента и адекватной противовоспалительной терапии ингаляционными глюкокортикостероидами. Другие симпатомиметические бронходилататоры следует назначать одновременно с препаратом Астмасол, бронхо только под медицинским наблюдением. Нарушение со стороны желудочно-кишечного тракта (ЖКТ) У пациентов, имеющих в анамнезе муковисцидоз, возможны нарушения моторики ЖКТ. Нарушения со стороны органов зрения Астмасол, бронхо должен использоваться с осторожностью у пациентов, предрасположенных к остроугольной глаукоме. Известны отдельные сообщения об осложнениях со стороны органа зрения (например, повышение внутриглазного давления, мидриаз, закрытоугольная глаукома, боль в глазах), развившихся при попадании ингаляционного ипратропия бромида (или ипратропия бромида в сочетании с агонистами &beta,2-адренорецепторов) в глаза. Симптомами острой закрытоугольной глаукомы могут быть боль или дискомфорт в глазах, затуманивание зрения, появление ореола у предметов и цветных пятен перед глазами в сочетании с отеком роговицы и покраснением глаз вследствие конъюнктивальной инъекции сосудов. Если развивается любая композиция этих симптомов, показано применение глазных капель, снижающих внутриглазное давление, и немедленная консультация специалиста. Пациенты должны быть проинструктированы о правильном применении ингаляционного раствора препарата Астмасол, бронхо. Для предупреждения попадания раствора в глаза рекомендуется, чтобы раствор, используемый с помощью небулайзера, вдыхался через мундштук. При отсутствии мундштука должна использоваться плотно прилегающая к лицу маска. Особенно тщательно должны заботиться о защите глаз пациенты, предрасположенные к развитию глаукомы. Системные эффекты При следующих заболеваниях: недавно перенесенном инфаркте миокарда, сахарном диабете с неадекватным гликемическим контролем, тяжело протекающих органических заболеваниях сердца и сосудов, гипертиреоз, феохромоцитома или обструкция мочеиспускательных путей (например, при гиперплазии предстательной железы или обструкции шейки мочевого пузыря) Астмасол, бронхо должен применяться только после тщательной оценки риск/польза,

особенно при использовании доз, превышающих рекомендуемые. Влияние на сердечно-сосудистую систему В постмаркетинговых исследованиях отмечались редкие случаи возникновения ишемии миокарда при приеме &beta,-агонистов. Пациентов с сопутствующими серьезными заболеваниями сердца (например, ишемической болезнью сердца, аритмиями или выраженной сердечной недостаточностью), получающих Астмасол, бронхо, следует предупреждать о необходимости обращения к врачу в случае появления болей в сердце или других симптомов, указывающих на ухудшение заболевания сердца. Необходимо обращать внимание на такие симптомы как одышка и боль в груди, так как они могут быть как сердечной, так и легочной этиологии. Гипокалиемия При применении &beta,2-агонистов может возникать гипокалиемия (см. раздел "Передозировка"). У спортсменов применение препарата Астмасол, бронхо в связи с наличием в его составе фенотерола может приводить к положительным результатам тестов на допинг. Вспомогательные вещества Препарат содержит стабилизатор - динатрия эдетата дигидрат. Во время ингаляции этот компонент может вызывать бронхоспазм у чувствительных пациентов с гиперреактивностью дыхательных путей.Влияние на способность управлять трансп. ср. и мех.:Исследования по изучению влияния препарата на способность управлять транспортными средствами и механизмами не проводились. Следует соблюдать осторожность при выполнении данных видов деятельности, так как возможно развитие головокружения, тремора, нарушения аккомодации глаз, мидриаза и нечеткого зрения. При возникновении указанных выше нежелательных ощущений следует воздержаться от таких потенциально опасных действий, как управление транспортными средствами и механизмами.

Условия хранения

При температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.