

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению препарата

БЕРОТЕК® Н

Регистрационный номер: П №011310/01 от 26.10.04

Торговое название: Беротек® Н

Международное название: фенотерол

Лекарственная форма: аэрозоль для ингаляций дозированных

Состав:

в 1 ингаляционной дозе содержится: фенотерол а гидробромида 100 мкг (0,100 мг)

Вспомогательные вещества: лимонная кислота безводная, вода очищенная, этанол абсолютный.

Пропеллент: 1,1,1,2 - тетрафторэтан (HFA 134a)

Описание:

Прозрачная бесцветная или слегка желтоватого или слегка коричневатого цвета жидкость, свободная от суспендированных частиц, помещенная под давлением в цельный баллончик из нержавеющей стали объемом 17 мл, с дозирующим клапаном 50 мкл

Фармакотерапевтическая группа: бета2-адреномиметик селективный АТХ: R03AC04

Фармакологические свойства

Фенотерола гидробромид - селективный стимулятор бета2-адренорецепторов. Активирует аденилатциклазу через стимуляторный GS-белок с последующим увеличением образования цАМФ, который в свою очередь активирует протеинкиназу А. Последняя фосфорилирует белки-мишени в клетках гладких мышц. Это в свою очередь приводит к фосфорилированию киназы легкой цепи миозина, ингибированию гидролиза фосфоинозина и открытию кальцийактивируемых быстрых калиевых каналов.

Таким образом, фенотерол расслабляет гладкую мускулатуру бронхов и сосудов, а также предупреждает развитие бронхоспазма, обусловленного воздействием таких бронхоконстрикторных факторов, как гистамин, метахолин, холодный воздух и аллергены (реакция немедленного типа). После приема препарата ингибируется высвобождение из тучных клеток медиаторов воспаления. Кроме того, после приема фенотерола в высоких дозах наблюдается усиление мукоцилиарного транспорта.

Более высокие концентрации препарата в плазме крови, достигаемые после перорального или чаще, после внутривенного введения, ингибируют сократительную способность матки. При приеме высоких доз препарата наблюдаются эффекты на уровне обмена веществ: липолиз, гликогенолиз, гипергликемия и гипокалиемия (последняя бывает обусловлена повышенным поглощением К⁺скелетной мускулатурой).

Бета-адренергические эффекты препарата на уровне сердечной мышцы, такие как увеличение частоты сердечных сокращений и усиление сократимости миокарда, объясняются действием фенотерола на сосуды, стимуляцией β2-адренорецепторов сердца, а при приеме препарата в дозах, превышающих терапевтические, стимуляцией β1-адренорецепторов. Часто наблюдаемым эффектом агонистов β-адренорецепторов является тремор. В отличие от действия на гладкую мускулатуру бронхов системные эффекты агонистов β-адренорецепторов ассоциируются с развитием толерантности. Фенотерол предупреждает и быстро купирует бронхоспазм различного генеза (физическая нагрузка, холодный воздух, ранний ответ на воздействие аллергена).

Начало действия после ингаляции - через 5 мин., продолжительность действия - 3-5 час.

Фармакокинетика

В зависимости от метода ингаляции и используемой ингаляционной системы около 10-30% активного вещества, освобождаемого из аэрозольного препарата после ингаляции, достигает нижних дыхательных путей, а остальная часть депонируется в верхних дыхательных путях и во рту. В результате некоторое количество ингалируемого фенотерола попадает в желудочно-кишечный тракт. После ингаляции одной дозы препарата Беротека Н степень всасывания составляет 17% от введенной дозы. Всасывание носит двухфазный характер - 30% фенотерола гидробромида быстро всасывается с периодом полувыведения 11 мин, и 70% всасывается медленно с периодом полувыведения 120 мин.

Не существует корреляции между концентрациями фенотерола в плазме крови, достигаемыми после ингаляции, и фармакодинамической кривой «время - эффект». Длительный (3-5 час) бронхорасширяющий эффект препарата после ингаляции, сравнимый с соответствующим эффектом, достигаемым после внутривенного введения, не поддерживается высокими концентрациями активного вещества в системном кровотоке.

После приема внутрь всасывается около 60% фенотерола гидробромида. Эта часть действующего вещества подвергается биотрансформации вследствие «эффекта первичного прохождения» через печень. В результате биодоступность препарата после введения внутрь падает приблизительно до 1,5%. Этим объясняется тот факт, что проглоченное количество препарата практически никак не сказывается на уровне активного вещества в плазме крови, достигаемом после ингаляции.

При парентеральном введении фенотерола гидробромид выводится соответственно трехфазной модели с периодами полувыведения - 0,42 мин, 14,3 мин и 3,2 ч. Биотрансформация фенотерола гидробромида у человека протекает исключительно путем конъюгации с сульфатами преимущественно в стенке кишечника.

В неизменном виде фенотерола гидробромид может проникать через плацентарный барьер и попадать в грудное молоко.

Показания

- Купирование приступов удушья бронхиальной астмы;
- Профилактика приступов бронхиальной астмы вследствие физического напряжения;
- Симптоматическое лечение бронхиальной астмы или иных состояний с обратимым сужением воздухоносных путей (например, хронический обструктивный бронхит). У больных с бронхиальной астмой и хронической обструктивной болезнью легких, отвечающих на стероиды, следует рассматривать необходимость сопутствующей противовоспалительной терапии.

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к фенотерола гидробромиду или любому другому компоненту препарата;
- Гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия;
- Тахикардии;
- Детский возраст до 4-х лет.

С осторожностью

Декомпенсированный сахарный диабет, недавно перенесенный инфаркт миокарда, тяжелые заболевания сердечно-сосудистой системы, неконтролируемая артериальная гипертензия, гипертиреоз, феохромоцитома.

Беременность и лактация

Не было выявлено отрицательного влияния препарата на течение беременности. Тем не менее, беременным женщинам (особенно в I триместре) препарат назначается только в тех случаях, когда ожидаемая польза для матери превышает любой возможный риск для плода.

Следует помнить об угнетающем действии фенотерола на сократительную активность матки. Известно, что фенотерол проникает в грудное молоко. Безопасность применения препарата в период лактации не установлена. Применение препарата во время кормления грудью возможно только в случаях, когда ожидаемая польза для матери превосходит возможный риск для ребенка.

Способ применения и дозы

Дозы для взрослых и детей старше 6 лет

Острый приступ бронхиальной астмы

В большинстве случаев для купирования бронхоспазма достаточно одной ингаляционной дозы; если в течение 5 мин облегчения дыхания не наступило, можно повторить ингаляцию.

Если эффект отсутствует после двух ингаляций, и требуются дополнительные ингаляции, следует без промедления обратиться за медицинской помощью в ближайшую больницу.

Профилактика астмы физического усилия

1-2 ингаляционные дозы на один прием, до 8 ингаляций в день.

Бронхиальная астма и другие состояния, сопровождающиеся обратимым сужением дыхательных путей

1-2 ингаляционные дозы на один прием, если требуются повторные ингаляции, то не более 8 ингаляций в день.

Дозы для детей от 4 до 6 лет

Острый приступ бронхиальной астмы

1 ингаляционная доза Беротек Н.

Профилактика астмы физического усилия

1 ингаляционная доза на один прием.

Бронхиальная астма и другие состояния, сопровождающиеся обратимым сужением дыхательных путей

1 ингаляционная доза Беротек Н до 4 раз в день. Интервал между ингаляциями не менее 3 час. Максимальная суточная доза - 4 ингаляции. Не более 2 ингаляций на один прием, т.к. более высокие дозы не увеличивают терапевтический эффект, но могут вызвать развитие побочных эффектов.

Дозированный аэрозоль не удобен для применения у детей до 4 лет.

Способ применения

Для достижения максимального эффекта необходимо правильно использовать дозированный аэрозоль.

Перед использованием дозированного аэрозоля в первый раз дважды нажмите на дно баллончика.

Каждый раз при использовании дозированного аэрозоля необходимо соблюдать следующие правила:

1. Снять защитный колпачок.
2. Сделать медленный полный выдох.
3. Удерживая баллончик как показано на рис. 1, плотно обхватить губами мундштук. Баллончик должен быть направлен дном кверху.

Рис. 1

4. Производя максимально глубокий вдох, одновременно быстро нажать на дно баллончика до высвобождения ингаляционной дозы. На несколько секунд задержать дыхание, затем вынуть мундштук изо рта и медленно выдохнуть.
5. Надеть защитный колпачок.

Если аэрозольный баллончик не использовался более трех дней, перед применением следует однократно нажать на дно баллончика.

Баллон рассчитан на 200 ингаляций. После этого баллон следует заменить. Несмотря на то, что в баллоне может оставаться некоторое количество препарата, количество лекарственного вещества, высвобождающегося при ингаляции, может быть уменьшено.

Баллон непрозрачен, поэтому количество препарата в баллоне можно определить только следующим способом: сняв защитный колпачок, баллон погружают в емкость, наполненную водой. Количество препарата определяют в зависимости от позиции баллона в воде (см. рис.2).

Рис. 2

Мундштук следует содержать в чистоте, при необходимости его можно промывать в теплой воде. После использования мыла или моющего средства, следует тщательно промывать мундштук чистой водой.

ПРЕДУПРЕЖДЕНИЕ: пластиковый мундштук для рта разработан специально для Беротека Н и служит для точного дозирования препарата. Мундштук не должен быть использован с другими дозированными аэрозолями. Также нельзя использовать Беротек Н с какими-либо другими адаптерами, кроме мундштука, поставляемого вместе с препаратом. Содержимое баллона находится под давлением. Баллон нельзя вскрывать и подвергать нагреванию выше 50°C.

Побочные эффекты

Наиболее частыми нежелательными эффектами Беротека Н являются мелкий тремор скелетных мышц, нервозность, головная боль, головокружение, тахикардия и сердцебиение. Возможно развитие серьезной гипокалиемии.

В некоторых случаях наблюдается возникновение кашля, местного раздражения, редко парадоксальных бронхоспастических реакций. Беротек Н может вызвать тошноту, рвоту, потливость, слабость, мышечные боли, судороги, гипергликемию.

В редких случаях, обычно при использовании высоких доз, отмечаются стенокардия, снижение диастолического давления, повышение систолического давления, аритмии.

Редко возникают местные воспалительные и аллергические реакции, особенно у пациентов с гиперчувствительностью. В отдельных случаях сообщалось о развитии изменений психики под влиянием ингаляционной терапии бета-адреномиметиками.

Передозировка

Симптомы

Возможно появление симптомов, связанных с избыточной стимуляцией бета-адренорецепторов. Наиболее вероятно развитие тахикардии, сердцебиения, тремора, гипертензии, гипотензии, увеличения пульсового давления, стенокардии, аритмии, гиперемии лица.

Лечение

Назначение седативных средств, транквилизаторов, в тяжелых случаях показана интенсивная симптоматическая терапия. В качестве специфических антидотов рекомендуются β -адреноблокаторы, особенно β_1 -селективные (атенолол и др.). Однако необходимо учитывать возможность усиления бронхиальной обструкции и осторожно подбирать дозу этих препаратов пациентам, страдающим бронхиальной астмой.

Лекарственные взаимодействия

Бета-адренергические, антихолинергические средства, ксантиновые производные (например, теofilлин), кромоглициевая кислота, глюкокортикостероиды могут усиливать действие фенотерола. Одновременное назначение с Беротеком Н других бета-адреномиметиков, антихолинергических средств, ксантиновых производных (например, теofilлина), глюкокортикостероидов, диуретиков, попадающих в системный кровоток, может усилить побочные эффекты.

Возможно значительное снижение бронхорасширяющего действия Беротека Н при одновременном назначении бета-адреноблокаторов.

Гипокалиемия, связанная с применением бета-адреномиметиков, может быть усилена одновременным назначением ксантиновых производных, стероидов и диуретиков.

Следует с осторожностью назначать бета-адренергические средства пациентам, получающим ингибиторы моноаминоксидазы, трициклические антидепрессанты, так как эти препараты способны усиливать действие фенотерола.

Ингаляции галогенизированных углеводородных анестетиков, например галотана, фторотана, трихлорэтилена или энфлурана, сенсibiliзируют миокард к действию фенотерола, что способствует развитию аритмии.

Особые указания

При первом использовании дозированного аэрозоля Беротек Н пациенты могут отмечать, что новый аэрозоль имеет несколько иной вкус по сравнению с прежним аэрозолем, содержащим фреон. Следует предупреждать пациентов об этом при переходе от одной формулы препарата к другой. Пациентам необходимо знать, что обе формулы препарата полностью взаимозаменяемы, и изменение вкуса не оказывает влияния на эффективность и безопасность новой формулы аэрозоля. Другие симпатомиметические бронходилататоры можно назначать одновременно с Беротек Н только под медицинским наблюдением. Возможно одновременное применение фенотерола и антихолинэргических бронходилататоров.

В случае внезапного развития и быстрого прогрессирования одышки необходимо без промедления обратиться к врачу.

Длительное применение препарата:

- лечение по потребности (ориентированное на симптомы) предпочтительнее регулярного применения препарата;
- необходимо проводить регулярное обследование пациентов с целью определения необходимости дополнительного или более интенсивного противовоспалительного лечения (например, ингаляций кортикостероидов).

Регулярное использование возрастающих доз препаратов, содержащих бета₂-адреномиметики, таких как Беротек Н, для купирования бронхиальной обструкции может вызвать неконтролируемое ухудшение течения заболевания. В случае усиления бронхиальной обструкции простое увеличение дозы бета₂-адреномиметиков, в том числе Беротека Н, 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 кортикостероидами.

При назначении бета2-адреномиметиков возможно развитие серьезной гипокалиемии. В связи с этим особая осторожность требуется при тяжелой астме, так как в этом случае гипокалиемия может возникнуть в результате одновременного назначения бета2-адреномиметиков, ксантиновых производных, глюкокортикоидов и диуретиков. Кроме того, при гипоксии возможно усиление влияния гипокалиемии на сердечный ритм. Рекомендуется проводить мониторинг уровня калия в плазме крови.

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

Влияние на способность управлять автомобилем и машинным оборудованием

Не установлено.

Форма выпуска

По 10 мл в баллончик из нержавеющей стали с дозирующим клапаном. Каждый баллончик с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения

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

Срок годности

3 года.

Не использовать препарат после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек

Отпускается по рецепту врача

Производитель

«Берингер Ингельхайм Фарма ГмБХ и Ко.КГ», Германия Германия, 55216, Ингельхайм-на-Рейне, Бингерштрассе 173