

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА:

Фармакодинамика. Сальбутамол является селективным агонистом β_2 -адренорецепторов. В терапевтических дозах действует на β_2 -адренорецепторы бронхиальных мышц с минимальным или полным отсутствием действия на β_1 -адренорецепторы сердца.

Фармакокинетика После ингаляционного применения от 10 до 20% введенной дозы достигает нижних дыхательных путей.

Остальное остается в транспортной системе или в ротоглотке, откуда проглатывается. Часть дозы, которая достигла дыхательных путей, абсорбируется в ткани легких и попадает в кровоток, но не метаболизируется в легких.

Начало действия препарата приходится на 4–5-ю минуту после ингаляции, продолжительность действия составляет 4–6 ч.

После попадания в системный кровоток препарат метаболизируется в печени, выделяется преимущественно почками в неизменном виде и в виде фенолсульфатного метаболита.

Доза препарата, которая из носоглотки попадает в пищеварительную систему, всасывается в ЖКТ, проходит первый этап метаболизма в печени до фенолсульфатного соединения, затем выделяется почками.

ПОКАЗАНИЯ:

препарат показан для купирования приступов БА, а также для лечения пациентов с ХОБЛ.

ПРИМЕНЕНИЕ:

препарат Небутамол предназначен для ингаляционного применения путем вдыхания через рот с помощью небулайзера и применяется под контролем врача.

Р-р не вводить путем инъекции и не глотать.

Взрослые (в том числе пациенты пожилого возраста)

Обычная начальная доза сальбутамола путем ингаляции составляет 2–2,5 мг. Она может быть повышена до 4–5 мг. Повторять ингаляцию можно 4 раза в сутки.

Для лечения взрослых больных с тяжелой обструкцией дыхательных путей доза может быть повышена до 40 мг/сут, однако такое лечение следует проводить в стационарных условиях под наблюдением врача.

Дети

Обычная начальная доза сальбутамола путем ингаляции составляет 2–2,5 мг. Она может быть повышена до 4–5 мг. Повторять ингаляцию можно 4 раза в сутки.

Клиническая эффективность применения сальбутамола путем небулизации в возрасте до 18 мес не установлена.

Поскольку возможна транзиторная гипоксемия, следует учесть необходимость проведения дополнительной кислородной терапии.

Небутамол обычно применяют в неразведенном виде. Однако, если ингаляции нужно проводить в течение длительного времени (>10 мин), содержимое контейнера может быть разбавлено стерильным физиологическим р-ром.

Ингаляцию аэрозоля можно проводить с помощью специальной лицевой маски или мундштука. Следует проводить периодическую вентиляцию помещения, где проводится ингаляция. В случае возникновения риска развития гипоксии из-за гиповентиляции, вдыхаемый воздух следует обогатить кислородом.

Повышение дозы и частоты применения препарата может осуществлять только врач, учитывая возможность возникновения побочных эффектов при превышении дозы.

Инструкция по применению препарата Небутамол.

1. Подготовить к использованию небулайзер.
2. Открыть полимерный пакет и извлечь однодозовый контейнер. Не извлекать контейнер из пакета, если в этом нет необходимости.
3. Встряхнуть контейнер. Другие контейнеры оставить в полимерном пакете и поместить их в картонную коробку.
4. Держа контейнер за верхний край, повернуть другой край, чтобы открыть контейнер.
5. Вставить контейнер в небулайзер открытым краем вниз и легонько нажать. Убедитесь, что весь препарат перетек в небулайзер.
6. Собрать небулайзер и использовать по назначению.

После использования промыть небулайзер, остатки препарата утилизировать.

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ:

гиперчувствительность в анамнезе к любому компоненту препарата. Хотя сальбутамол в форме р-ра для в/в инъекций и иногда в форме таблеток и суппозиториях применяют при ведении преждевременных родов, сальбутамол в форме аэрозоля для ингаляций при этих показаниях не применяют. Не применяют сальбутамол при угрозе выкидыша.

ПОБОЧНЫЕ ЭФФЕКТЫ:

приведенные ниже, классифицированы по органам и системам и согласно частоте возникновения. Частота возникновения классифицируется как: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$ и $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$ и $< 1/100$), редко ($\geq 1/10000$ и $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$), включая единичные случаи. В общем очень частые и частые побочные эффекты определяются по данным клинических исследований, тогда как редкие и очень редкие — по данным спонтанных сообщений.

Со стороны иммунной системы : очень редко — реакции гиперчувствительности, включая ангионевротический отек, крапивницу, бронхоспазм, гипотензию и коллапс.

Метаболические нарушения: редко — гипокалиемия. Потенциально тяжелая гипокалиемия может быть результатом лечения агонистами β_2 -адренорецепторов; очень редко — лактоацидоз. У больных БА в стадии обострения, которые лечатся сальбутамолом, вводимым в/в или через небулайзер, в очень редких случаях может возникнуть лактоацидоз.

Со стороны нервной системы : часто — тремор, головная боль, очень редко — гиперактивность.

Со стороны сердечно-сосудистой системы : часто — тахикардия; нечасто — усиленное сердцебиение; очень редко — нарушения сердечного ритма, включая фибрилляцию желудочков, суправентрикулярная тахикардия и экстрасистолия, периферическая вазодилатация, частота не определена — ишемия миокарда.

Со стороны дыхательной системы : очень редко — парадоксальный бронхоспазм.

Как и при применении других ингаляционных лекарственных средств, возможен парадоксальный бронхоспазм с усилением удушья. В этом случае необходимо немедленно назначить альтернативные формы препарата или другие быстродействующие ингаляционные бронходилататоры. Небутамол следует немедленно отменить, оценить состояние пациента и, при необходимости, начать альтернативную терапию.

Со стороны пищеварительного тракта: нечасто — раздражение слизистой оболочки полости рта и глотки.

Со стороны костно-мышечной системы: нечасто — мышечные судороги.

ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ:

Небутамол требуется использовать путем ингаляции через рот и не следует вводить путем инъекции или глотать.

Лечение при БА необходимо проводить согласно поэтапной программе, состояние пациента требуется оценивать клинически и с помощью функциональных легочных тестов.

Повышение частоты использования ингаляционных агонистов β_2 -адренорецепторов свидетельствует об ухудшении контроля над

БА. В таком случае терапию больного необходимо пересмотреть, потому что ухудшение течения БА является опасным для жизни состоянием, которое требует начала или увеличения применения ГКС. Пациентам группы риска рекомендуется ежедневно проводить контроль максимальной скорости выдоха.

Больных, получающих препарат Небутамол в домашних условиях, требуется предупредить о следующем: если эффективная доза препарата не приносит облегчения от лечения или уменьшается продолжительность этого облегчения, следует обратиться к врачу, а не повышать дозу или частоту его применения самостоятельно.

Небутамол с осторожностью применяют для лечения у больных, применяющих другие симпатомиметики в высоких дозах.

Применение симпатомиметиков, включая сальбутамол, оказывает влияние на сердечно-сосудистую систему. По данным постлицензионного применения и опубликованным данным литературы, существуют свидетельства о редких случаях возникновения ишемии миокарда, ассоциированной с применением сальбутамола. Пациентам с заболеваниями сердца (например ИБС, аритмия или тяжелая сердечная недостаточность), получающим сальбутамол, в случае возникновения боли в груди или других симптомов, свидетельствующих об обострении болезни сердца, следует обратиться за медицинской помощью. Внимание следует обратить на оценку таких симптомов, как одышка и боль в груди, которые могут быть следствием как заболевания сердца, так и заболевания дыхательной системы.

С осторожностью сальбутамол назначают больным тиреотоксикозом.

При лечении больных комбинацией сальбутамола в небулах и ипратропиума бромида иногда наблюдались случаи развития острой закрытоугольной глаукомы. Поэтому комбинацию сальбутамола в небулах с антихолинэргическими препаратами, которые вводятся путем небулизации, следует применять с осторожностью. Больным требуется дать надлежащие инструкции относительно правильного применения препарата и предупредить о том, что следует избегать попадания распыляемого аэрозоля в глаза.

Результатом лечения агонистами β_2 -адренорецепторов может быть тяжелая гипокалиемия, которая главным образом наблюдается при применении парентеральных форм или небулайзера. Особое внимание уделяют больным острой тяжелой БА, потому что гипокалиемия может потенцироваться сопутствующим применением дериватов ксантинов, стероидов, диуретиков и гипоксией. В этой ситуации рекомендуется проверять уровень калия в плазме крови.

Как и другие агонисты β_2 -адренорецепторов, Небутамол может приводить к обратимым метаболическим изменениям, например к повышению уровня глюкозы в крови.

Компенсация таких изменений у больных сахарным диабетом не всегда возможна, поэтому имеются отдельные сообщения о развитии кетоацидоза у этих больных. Одновременное применение ГКС может обострить это состояние.

Очень редко у больных БА в стадии обострения, которые лечились сальбутамолом в высоких дозах, применявшимся в/в или через небулайзер, сообщалось о случаях развития лактоацидоза. Повышение уровня лактата в крови может вызывать развитие удушья и компенсаторной гипервентиляции легких, может ошибочно быть расценено как недостаточная эффективность противоастматического лечения и, в свою очередь, привести к неуместной интенсификации лечения короткодействующими агонистами β_2 -адренорецепторов. Поэтому рекомендуется контролировать уровень лактата в плазме крови таких больных и, соответственно, наличие у них метаболического ацидоза.

Применение в период беременности и кормления грудью. Сальбутамол в период беременности назначают только тогда, когда ожидаемая польза для матери выше возможного риска для плода.

Поскольку сальбутамол может выделяться с грудным молоком, назначать его в период кормления грудью не рекомендуется, за исключением ситуации, когда ожидаемая польза для матери превышает возможный риск для ребенка.

Дети. Клиническая эффективность применения сальбутамола путем небулизации в возрасте до 18 мес не установлена, поэтому применение препарата не рекомендуется.

Способность влиять на скорость реакции при управлении транспортными средствами или работе с другими механизмами.

Данных о влиянии нет, в случае появления побочных действий со стороны нервной системы (тремор) управление транспортными средствами или работу с механизмами необходимо ограничить.

ВЗАИМОДЕЙСТВИЯ:

сальбутамол не назначают одновременно с таким неселективным блокатором β -адренорецепторов, как пропранолол.

Сальбутамол не противопоказан для применения больным, применяющим ингибиторы MAO.

ПЕРЕДОЗИРОВКА:

наиболее распространенными признаками и симптомами передозировки Небутамола являются транзиторные изменения, фармакологически индуцированные бета-агонистами (например тахикардия, тремор, головная боль).

В результате передозировки сальбутамола может возникнуть гипокалиемия, поэтому необходимо контролировать уровень калия в плазме крови.

Лечение заключается в прекращении приема сальбутамола и назначении соответствующей симптоматической терапии, такой как кардиоселективные блокаторы β -адренорецепторов для лечения пациентов с сердечной симптоматикой (например тахикардией).

Препараты группы блокаторов β -адренорецепторов следует назначать с осторожностью больным с бронхоспазмом в анамнезе.

УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ:

при температуре не выше 25 °С. Не допускать замораживания и воздействия прямого солнечного света.