

МИНЗДРАВ РОССИИ
М-003013-010420
СОГЛАСОВАНО

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ
ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

САЛЬБУТАМОЛ АВ

Регистрационный номер:

Торговое наименование:

Сальбутамол АВ.

Международное непатентованное или группировочное наименование:

Сальбутамол.

Химическое наименование: альфа1-[[[(1,1-Диметилэтил)амино]метил]-4-гидрокси-1,3-бензолдиметанол (в виде сульфата).

Лекарственная форма: аэрозоль для ингаляций дозированных.

Состав на одну дозу

Действующее вещество:

сальбутамола сульфат – 120 мкг

эквивалентный сальбутамолу – 100 мкг

Вспомогательные вещества:

этанол (спирт этиловый 96 %) – 2327 мкг

олеиновая кислота – 44 мкг

тетрафторэтан (HFA-134a) – 25509 мкг

Описание

Белая или белая с желтоватым оттенком суспензия, находящаяся под давлением в баллоне алюминиевом моноблочном с дозирующим клапаном и распылителем. При распылении 5 доз препарата на стекло оставляет пятно белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа

Бронходилатирующее средство – бета2-адреномиметик селективный.

Код АТХ: R03AC02.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Бронходилатирующее средство. В терапевтических дозах оказывает выраженное стимулирующее действие на бета₂-адренорецепторы бронхов, кровеносных сосудов и миометрия. Практически не оказывает действия на бета₁-адренорецепторы миокарда.

Оказывает выраженный бронхолитический эффект, предупреждая или купируя спазм бронхов, снижает сопротивление в дыхательных путях, увеличивает жизненную емкость легких. Увеличивает мукоцилиарный клиренс (при хроническом бронхите до 36 %), стимулирует секрецию слизи, активизирует функцию мерцательного эпителия. Может приводить к снижению числа бета-адренорецепторов, в том числе на лимфоцитах.

Обладает рядом метаболических эффектов: снижает концентрацию калия в плазме, влияет на гликогенолиз и выделение инсулина, оказывает гипергликемический (особенно у пациентов с бронхиальной астмой) и липолитический эффект, увеличивает риск развития ацидоза.

В рекомендуемых терапевтических дозах не оказывает отрицательного влияния на сердечно-сосудистую систему, не вызывает повышения артериального давления. В меньшей степени, по сравнению с лекарственными средствами этой группы, оказывает положительное хроно- и инотропное действие. Вызывает расширение коронарных артерий.

После применения ингаляционных форм действие развивается быстро, начало эффекта – через 5 минут, максимум – через 30-90 минут (75 % максимального эффекта достигается в течение 5 минут), продолжительность действия – 3-6 часов.

Фармакокинетика

Всасывание

После проведения ингаляции 10-20 % дозы сальбутамола достигает нижних дыхательных путей. Остальная часть дозы остается в ингаляторе или

откадывается в ротоглотке и затем проглатывается. Фракция, отложившаяся в дыхательных путях, абсорбируется в легочные ткани и кровь, но не метаболизируется в легких.

Распределение

Степень связывания сальбутамола с белками плазмы составляет 10 %.

Метаболизм

При попадании в системный кровоток сальбутамол подвергается печеночному метаболизму и экскретируется преимущественно почками в неизменном виде или в виде фенольного сульфата. Проглоченная часть ингаляционной дозы абсорбируется из желудочно-кишечного тракта и подвергается значительному метаболизму при «первом прохождении» через печень, превращаясь в фенольный сульфат. Неизмененный сальбутамол и конъюгат экскретируются преимущественно почками.

Выведение

Введенный внутривенно сальбутамол имеет период полувыведения 4-6 часов. Выводится частично почками и частично в результате метаболизма до неактивного 4'-О-сульфата (фенольный сульфат), который также выводится преимущественно почками. Через кишечник экскретируется лишь незначительная часть введенной дозы сальбутамола. Большая часть дозы сальбутамола, введенной в организм внутривенным, пероральным или ингаляционным путем, экскретируется в течение 72 часов.

Показания к применению

1. Бронхиальная астма:

- купирование приступов бронхиальной астмы, в том числе при обострении бронхиальной астмы тяжелого течения;
- предотвращение приступов бронхоспазма, связанных с воздействием аллергена или вызванных физической нагрузкой;
- применение в качестве одного из компонентов при длительной поддерживающей терапии бронхиальной астмы.

2. Хроническая обструктивная болезнь легких (ХОБЛ), сопровождающаяся обратимой обструкцией дыхательных путей, хронический бронхит, эмфизема легких.

Противопоказания

- повышенная чувствительность к любому компоненту препарата;
- детский возраст до 2 лет;
- беременность;
- ведение преждевременных родов;
- угрожающий аборт.

С осторожностью

Применять препарат, если у больных в анамнезе отмечается тахикардия, миокардит, пороки сердца, аортальный стеноз, ишемическая болезнь сердца, тяжелая хроническая сердечная недостаточность, артериальная гипертензия, тиреотоксикоз, феохромоцитома, декомпенсированный сахарный диабет, глаукома, эпилепсия, почечная или печеночная недостаточность, одновременный прием неселективных β -адреноблокаторов, период грудного вскармливания.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Противопоказан во время беременности.

В период грудного вскармливания препарат назначается с осторожностью (неизвестно, проникает ли сальбутамол в грудное молоко) и только в тех случаях, когда ожидаемая польза для матери превышает любой возможный риск для ребенка.

Способ применения и дозы

Только для ингаляционного введения.

Решить вопрос об увеличении дозы или частоты применения препарата может только врач.

Не рекомендуется применять препарат чаще 4 раз в сутки. Потребность в частом применении максимальных доз препарата или во внезапном увеличении дозы свидетельствует об ухудшении течения заболевания.

Взрослым и детям старше 12 лет.

Купирование приступа бронхоспазма: рекомендуемая доза составляет 100-200 мкг (1-2 ингаляции).

Предотвращение приступов бронхоспазма, связанных с воздействием аллергена или вызванных физической нагрузкой: рекомендуемая доза составляет 200 мкг (2 ингаляции) за 10-15 минут до воздействия провоцирующего фактора.

Длительная поддерживающая терапия: рекомендуемая доза составляет до 200 мкг (2 ингаляции) 4 раза в сутки.

Максимальная суточная доза: 1200 мкг (12 ингаляций).

Детям от 2 до 12 лет.

Купирование приступа бронхоспазма: рекомендуемая доза составляет 100-200 мкг (1-2 ингаляции).

Предотвращение приступов бронхоспазма, связанных с воздействием аллергена или вызванных физической нагрузкой: рекомендуемая доза составляет 100-200 мкг (1-2 ингаляции) за 10-15 минут до воздействия провоцирующего фактора.

Длительная поддерживающая терапия: рекомендуемая доза составляет до 200 мкг (2 ингаляции) 4 раза в сутки.

Максимальная суточная доза: 800 мкг (8 ингаляций).

Применение ингалятора

1. Снимают с ингалятора колпачок (необходимо убедиться в отсутствии в выходной трубке пыли и грязи).
2. Перед ингаляционным введением рекомендуется занять положение «стоя» или «сидя».
3. Перед использованием баллон тщательно встряхивают.
4. Делают глубокий выдох.

5. Баллончик с аэрозолем переворачивают клапанно-распылительной головкой вниз, охватывают мундштук губами, делают глубокий вдох и одновременно нажимают на дно баллона. При этом происходит выброс аэрозоля.

6. Задерживают дыхание на несколько секунд и, отведя мундштук ото рта, делают медленный выдох.

Предупреждения. При применении дозированного аэрозоля необходимо четкое выполнение следующих инструкций: встряхивание баллончика с аэрозолем перед каждым использованием, четкая синхронизация вдоха и поступления препарата, максимально глубокий, интенсивный и достаточно продолжительный вдох, задержка дыхания после ингаляции препарата на 10 секунд.

Рекомендуется перед применением препарата прополоскать рот водой.

Чистка ингалятора

Насадку ингалятора следует чистить не реже одного раза в неделю.

1. Снять защитный колпачок с распылительной насадки, а распылительную насадку – с баллона.

2. Тщательно промыть и высушить распылительную насадку и защитный колпачок под теплой проточной водой. При высушивании не пользуйтесь нагревательными устройствами.

3. Надеть распылительную насадку на баллон и шток клапана, закрыть отверстие насадки защитным колпачком.

Не помещать баллон в воду!

Побочное действие

Нежелательные реакции, представленные ниже, перечислены в соответствии с поражением органов и систем органов и частотой встречаемости. Частота встречаемости определяется следующим образом: *очень часто* ($\geq 1/10$), *часто* ($\geq 1/100$ и $< 1/10$), *нечасто* ($\geq 1/1\ 000$ и $< 1/100$), *редко* ($\geq 1/10\ 000$ и $< 1/1\ 000$), *очень редко* ($< 1/10\ 000$, включая отдельные случаи). Категории частоты были

сформированы на основании клинических исследований препарата и пострегистрационного наблюдения.

Частота встречаемости нежелательных реакций

Нарушения со стороны иммунной системы: очень редко – реакции гиперчувствительности, включая ангионевротический отек, крапивницу, бронхоспазм, снижение артериального давления и коллапс.

Нарушения со стороны обмена веществ и питания: редко – гипокалиемия.

Терапия бета₂-агонистами может приводить к клинически значимой гипокалиемии.

Нарушения со стороны нервной системы: часто – тремор, головная боль; очень редко – гиперактивность.

Нарушения со стороны сердца: часто – тахикардия; нечасто – ощущение сердцебиения; очень редко – аритмии, включая мерцательную аритмию; суправентрикулярная тахикардия и экстрасистолия.

Нарушения со стороны сосудов: редко – периферическая вазодилатация.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: очень редко – парадоксальный бронхоспазм.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: нечасто – раздражение слизистой оболочки полости рта и глотки.

Нарушения со стороны скелетно-мышечной и соединительной ткани: нечасто – мышечные судороги.

Передозировка

Признаками и симптомами передозировки сальбутамола являются преходящие явления, фармакологически опосредованные стимуляцией бета-адренергических рецепторов (см. разделы «Особые указания» и «Побочное действие»), такие как снижение артериального давления, тахикардия, мышечный тремор, тошнота, рвота. Применение больших доз сальбутамола может вызвать метаболические изменения, включая гипокалиемию, необходимо контролировать концентрацию калия в сыворотке крови.

При применении высоких доз, а также при передозировке бета-агонистов короткого действия наблюдалось развитие лактатацидоза, поэтому при передозировке может быть показан контроль над повышением сывороточного лактата и возможностью развития метаболического ацидоза (особенно при сохранении или ухудшении тахипноэ, несмотря на устранение других признаков бронхоспазма, таких как свистящее дыхание).

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

Не рекомендуется одновременно применять сальбутамол и неселективные блокаторы бета-адренорецепторов, такие как пропранолол.

Сальбутамол не противопоказан у пациентов, получающих лечение ингибиторами моноаминоксидазы (иМАО).

У больных с тиреотоксикозом усиливает действие стимуляторов центральной нервной системы, тахикардию.

Теofilлин и другие ксантины при одновременном применении повышают вероятность развития тахикардий. Одновременное назначение с антихолинергическими средствами (в т. ч. ингаляционными) может способствовать повышению внутриглазного давления.

Диуретики и глюкокортикостероиды усиливают гипокалиемическое действие сальбутамола.

Особые указания

Частое применение сальбутамола может привести к усилению бронхоспазма, внезапной смерти, в связи с чем между приемами очередных доз препарата необходимо делать перерывы в несколько часов (6 часов). Сокращение этих интервалов может иметь место только в исключительных случаях.

При применении дозированного аэрозоля необходимо четкое выполнение следующих инструкций: встряхивание баллончика с аэрозолем перед каждым использованием, четкая синхронизация вдоха и поступления препарата, максимально глубокий, интенсивный и достаточно продолжительный вдох, задержка дыхания после ингаляции препарата на 10 секунд. Пациентам (в том

числе детям младшего возраста), которым трудно выполнить правильно дыхательный маневр, рекомендуется использовать для ингаляции препарата специальное приспособление (спейсер), увеличивающий дыхательный объем и сглаживающий неточности асинхронного вдоха.

Как и при применении других ингаляционных препаратов, терапевтический эффект может уменьшаться при охлаждении баллона. Поэтому перед применением баллон с препаратом должен быть подогрет до комнатной температуры (согреть баллон руками на протяжении нескольких минут, нельзя применять другие способы!).

Содержимое баллонов находится под давлением, поэтому их нельзя нагревать, разбирать, протыкать или сжигать, даже когда они будут пустыми.

В случае возникновения неприятных ощущений во рту и першения в горле после ингаляции рот следует прополоскать водой.

Бронходилататоры не должны являться единственным или основным компонентом терапии бронхиальной астмы нестабильного или тяжелого течения.

Если действие обычной дозы препарата становится менее эффективным или менее продолжительным (действие препарата должно сохраняться не менее 3 часов), пациенту следует обратиться к врачу. Повышение потребности в применении ингаляционных агонистов бета₂-адренорецепторов с короткой продолжительностью действия для лечения бронхиальной астмы свидетельствует об обострении заболевания. В таких случаях следует пересмотреть план лечения пациента. Прием высоких доз салбутамола при обострении астмы может вызывать синдром «рикошета» (каждый следующий приступ становится интенсивнее). При тяжелом приступе удушья перерыв между ингаляциями должен быть не менее 20 минут.

Риск осложнений повышается как при значительной длительности лечения, так и при резкой отмене препарата. Длительное применение салбутамола должно

сопровождаться использованием противовоспалительных лекарственных средств для базисной терапии.

Внезапное и прогрессирующее ухудшение бронхиальной астмы может представлять угрозу для жизни пациента, поэтому в подобных случаях необходимо срочно решать вопрос о назначении или увеличении дозы глюкокортикостероидов. У таких пациентов рекомендуется проводить ежедневный мониторинг пиковой скорости выдоха.

Необходимо применять препарат с осторожностью у пациентов с тиреотоксикозом.

Терапия агонистами β_2 -адренорецепторов может приводить к гипокалиемии. Особую осторожность рекомендуется проявлять при лечении тяжелых приступов бронхиальной астмы, поскольку в этих случаях гипокалиемия может усиливаться в результате одновременного применения производных ксантина, глюкокортикостероидов, диуретиков, а также вследствие гипоксии. В таких случаях необходимо контролировать уровень калия в сыворотке крови.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

В случае возникновения побочных реакций, пациентам следует воздержаться от управления автомобилем и другими механизмами, а также соблюдать осторожность при занятии видами деятельности, требующей повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Аэрозоль для ингаляций дозированных, 100 мкг/доза.

По 7 г (200 доз) или по 11 г (300 доз) в алюминиевые аэрозольные баллоны, снабженные клапанами нажимными дозирующими и распылительными насадками с защитными колпачками.

Каждый баллон с распылительной насадкой и инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 30 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года. Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Владелец регистрационного удостоверения/производитель/организация, принимающая претензии потребителей:

ЗАО «Алтайвитамины»

Адрес: 659325, Россия, Алтайский край, г. Бийск, ул. Заводская, 69

Тел.: (3854) 326-948, 338-719

Факс (3854) 326-943

/ Генеральный директор
ЗАО «Алтайвитамины»



Ю.А. Кошелев