ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Фенотэйр®

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Фенотэйр®

Международное непатентованное или группировочное наименование: фенотерол

Лекарственная форма: аэрозоль для ингаляций дозированный

Состав на одну дозу

Действующее вещество:	
Фенотерола гидробромид	0,100 мг
Вспомогательные вещества:	
Этанол	15,597 мг
Вода очищенная	1,040 мг
Лимонная кислота безводная	0,001 мг
Норфлуран	35,252 мг

Описание

Препарат представляет собой бесцветный или светло-желтый, или светло-коричневый, или с коричневато-желтоватым оттенком прозрачный раствор с запахом этанола, находящийся под давлением в баллоне металлическом моноблочном с дозирующим клапаном, снабженным насадкой-ингалятором с защитным колпачком; препарат при выходе из баллона распыляется в виде аэрозольного облака.

Фармакотерапевтическая группа

Бронходилатирующее средство – β_2-адреномиметик селективный.

Код АТХ: R03AC04

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

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

Фенотерол является селективным стимулятором β_2-адренорецепторов в терапевтическом

144950

диапазоне доз. Стимуляция β_1-адренорецепторов происходит при применении более высоких доз препарата. Связывание с β_2-адренорецепторами активирует аденилатциклазу 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.

Фенотерол расслабляет гладкую мускулатуру бронхов и сосудов и защищает от бронхоконстрикторных стимулов, таких как гистамин, метахолин, холодный воздух и аллергены (ранний ответ). Кроме того, фенотерол тормозит высвобождение из тучных клеток бронхоконстрикторных и противоспалительных медиаторов. Усиление мукоцилиарного клиренса продемонстрировано после применения фенотерола (в дозе 0,6 мг).

За счет стимулирующего влияния на β_1-адренорецепторы, фенотерол может оказывать действие на миокард (особенно в дозах, превышающих терапевтические), вызывая учащение и усиление сердечных сокращений.

Фенотерол быстро купирует бронхоспазм различного генеза. Бронходилатация развивается в течение нескольких минут после ингаляции и продолжается 3–5 часов. Также фенотерол защищает от бронхоконстрикции, которая возникает под воздействием различных стимулов, таких как физическая нагрузка, холодный воздух и аллергены (ранний ответ).

Фармакокинетика

Всасывание

После ингаляции 10–30 % активного вещества, высвобождаемого из аэрозольного препарата, достигает нижних дыхательных путей в зависимости от техники ингаляции и используемой ингаляционной системы. Остальная часть оседает в верхних дыхательных путях и во рту, а затем проглатывается.

Абсолютная биодоступность фенотерола после ингаляции дозированного аэрозоля составляет 18,7 %. Абсорбция фенотерола из легких двухфазная: 30 % дозы абсорбируется быстро (время полувыведения 11 мин), а 70 % – медленно (время полувыведения 120 мин). Максимальная концентрация в плазме после ингаляции 200 мкг фенотерола составляет 66,9 пг/мл (t_{max} = 15 мин). После перорального введения абсорбируется приблизительно 60 % дозы фенотерола гидробромида. Абсорбировавшееся количество

подвергается экстенсивной первой фазе метаболизма в печени, в итоге пероральная биодоступность составляет приблизительно 1,5 %, и ее вклад в концентрацию фенотерола в плазме после ингаляции является небольшим.

Распределение

Распределение фенотерола в плазме после внутривенного введения адекватно описывает 3-х компонентная фармакокинетическая модель (время полувыведения составляет t_α = 0,42 мин, t_β = 14,3 мин и t_γ = 3,2 ч). Объем распределения фенотерола при постоянной концентрации после внутривенного введения составляет 1,9–2,7 л/кг, связывание с белками плазмы – от 40 до 55 %. Фенотерола гидробромид может в неизмененном виде проникать через плацентарный барьер и попадать в грудное молоко.

Метаболизм

Фенотерол подвергается интенсивному метаболизму в печени путем конъюгации до глюкуронидов и сульфатов. Проглоченная часть дозы фенотерола метаболизируется преимущественно путем сульфатирования. Эта метаболическая инактивация исходного вещества начинается уже в стенке кишечника.

Выведение

Фенотерол выводится почками и с желчью в виде неактивных сульфатных конъюгатов. Биотрансформации, включая выделение с желчью, подвергается основная часть – приблизительно 85 %. Выделение фенотерола с мочой (0,27 л/мин) соответствует приблизительно 15 % от среднего общего клиренса системно доступной дозы. Объем почечного клиренса свидетельствует о канальцевой секреции фенотерола дополнительно к гломерулярной фильтрации. После ингаляции 2 % дозы выделяется через почки в неизмененном виде в течение 24 часов.

Показания к применению

- Приступы бронхиальной астмы или иные состояния с обратимой обструкцией дыхательных путей, хронический бронхит, хроническая обструктивная болезнь легких.
- Профилактика приступов бронхиальной астмы вследствие физического напряжения.

Противопоказания

Гиперчувствительность к фенотеролу или к любому из вспомогательных веществ препарата.

Гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия.

Тахиаритмия.

Детский возраст до 4 лет.

С осторожностью

При следующих состояниях Фенотэйр® следует использовать только после тщательной оценки пользы/риска лечения, особенно если применяются максимальные рекомендованные дозы: гипертиреоз, гипокалиемия, недостаточно контролируемый сахарный диабет, недавно перенесенный инфаркт миокарда (в течение последних 3-х месяцев), тяжелые органические заболевания сердца и сосудов, такие как хроническая сердечная недостаточность, ишемическая болезнь сердца, заболевания коронарных артерий, пороки сердца (в том числе аортальный стеноз), выраженные поражения церебральных и периферических артерий, феохромоцитома.

Так как информация о применении препарата у детей в возрасте до 6 лет ограничена, лечение проводят с осторожностью, только под наблюдением врача.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Результаты доклинических исследований в сочетании с имеющимся опытом клинического применения препарата не выявили никаких нежелательных явлений во время беременности. Тем не менее, следует с осторожностью применять препарат при беременности, особенно в первом триместре, в том случае, если потенциальная польза для матери превышает потенциальный риск для плода. Следует учитывать возможность ингибирующего эффекта фенотерола на сократительную активность матки.

Доклинические исследования показали, что фенотерол проникает в грудное молоко. Безопасность препарата в период грудного вскармливания не изучена. Следует соблюдать осторожность при применении препарата в период грудного вскармливания. Клинические данные о воздействии фенотерола на фертильность отсутствуют. Доклинические исследования фенотерола не показали неблагоприятного воздействия на фертильность.

Способ применения и дозы

Дозы для взрослых и детей старше 6 лет

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

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 ингаляционных доз и требуются

дополнительные ингаляции, следует без промедления обратиться за медицинской помощью. Максимальная допустимая доза в течение суток – 8 ингаляционных доз.

Профилактика приступов бронхиальной астмы вследствие физического напряжения

1–2 ингаляционные дозы до физической нагрузки, до 8 ингаляционных доз в день.

У детей в возрасте от 6 до 12 лет препарат Фенотэйр® должен применяться только после консультации с врачом и под наблюдением взрослых.

Дозы для детей от 4 до 6 лет

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

Для купирования бронхоспазма достаточно одной ингаляционной дозы.

Если эффект отсутствует, следует без промедления обратиться за медицинской помощью.

Профилактика приступов бронхиальной астмы вследствие физического напряжения

1 ингаляционная доза до физической нагрузки, до 4 ингаляционных доз в день.

У детей в возрасте от 4 до 6 лет, препарат должен применяться только после консультации с врачом и под наблюдением взрослых.

Способ применения

Ингаляционно.

Для достижения максимального эффекта необходимо правильно использовать дозированный аэрозоль.

Инструкция по проведению ингаляций

Препарат предназначен только для ингаляционного применения.

Перед первым использованием ингалятора или если ингалятором не пользовались более трех дней, проверьте его работу. Для этого снимите защитный колпачок с насадки-ингалятора, поверните ингалятор донцем вверх и сделайте два впрыска в воздух (дважды нажмите на дно баллончика).

Каждый раз при использовании ингалятора необходимо соблюдать следующие правила:

1. Снять защитный колпачок с насадки-ингалятора.
2. Сделать полный выдох.
3. Удерживая баллончик, как показано на рис. 1, плотно обхватить губами мундштук. При этом дно ингалятора обращено вверх.

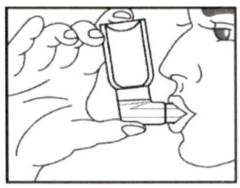

Рис. 1

4. Производя максимально глубокий вдох, одновременно сильно нажать на дно баллончика, чтобы высвободить ингаляционную дозу. На несколько секунд задержать дыхание, затем вынуть мундштук изо рта и медленно выдохнуть.

Если потребуется повторная ингаляция, повторить те же действия (пункты 2–4).

5. Надеть защитный колпачок.

6. Если ингалятор не использовался более трех дней, перед применением следует двукратно нажать на дно баллончика.

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

Баллон непрозрачен, поэтому количество препарата в баллончике можно определить только следующим способом: сняв насадку-ингалятор с защитным колпачком, баллончик погружают в емкость, наполненную водой. Количество препарата определяют в зависимости от позиции баллончика в воде (см. рис. 2).

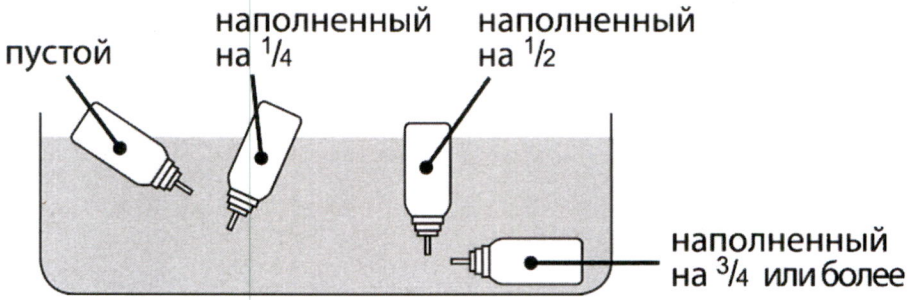

Рис. 2

Ингалятор следует очищать не менее одного раза в неделю.

Важно содержать мундштук вашего ингалятора чистым, чтобы лекарство не накопилось и не блокировало распыление.

Для очистки снимите защитный колпачок и выньте баллончик из насадки-ингалятора. Промойте корпус насадки-ингалятора теплой водой для удаления накопившегося

лекарства или видимых загрязнений (см. рис. 3).

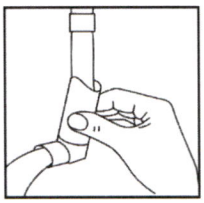

Рис. 3

После очистки встряхните насадку-ингалятор и дайте ей высохнуть на воздухе без использования нагревающих устройств. Когда насадка-ингалятор высохнет, возвратите на место баллончик и защитный колпачок (см. рис. 4).

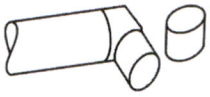

Рис. 4

ПРЕДУПРЕЖДЕНИЕ: насадка-ингалятор для рта разработан специально для препарата Фенотэйр® и служит для точного дозирования препарата.

Насадка-ингалятор не должна быть использована с другими дозированными аэрозолями. Также нельзя использовать препарат Фенотэйр® с какими-либо другими адаптерами, кроме насадки-ингалятора, поставляемой вместе с препаратом.

Содержимое баллона находится под давлением. Баллон нельзя вскрывать и подвергать нагреванию выше 50 °С.

Побочное действие

Как и все другие виды ингаляционного лечения, препарат Фенотэйр® может вызывать симптомы местного раздражающего действия.

Частота нежелательных реакций, которые могут возникать во время терапии, приведена в виде следующей градации: очень часто (≥ 1/10); часто (≥ 1/100, < 1/10); нечасто (≥ 1/1 000, < 1/100); редко (≥ 1/10 000, < 1/1 000); очень редко (< 1/10 000); частота неизвестна (частота не может быть оценена по доступным данным).

Нарушения со стороны иммунной системы

Частота неизвестна: гиперчувствительность.

Нарушения метаболизма и питания

Нечасто: гипокалиемия, включая тяжелую гипокалиемию.

Психические нарушения

Нечасто: возбуждение.

Частота неизвестна: нервозность.

Нарушения со стороны нервной системы

Часто: тремор.

Частота неизвестна: головная боль, головокружение.

Нарушения со стороны сердца

Нечасто: аритмия.

Частота неизвестна: ишемия миокарда, тахикардия, ощущение сердцебиения.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения

Часто: кашель.

Нечасто: парадоксальный бронхоспазм.

Частота неизвестна: раздражение гортани и глотки.

Желудочно-кишечные нарушения

Нечасто: тошнота, рвота.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей

Нечасто: зуд.

Частота неизвестна: гипергидроз, кожные реакции, такие как сыпь, крапивница.

Нарушения со стороны мышечной, скелетной и соединительной ткани

Частота неизвестна: спазм мышц, миалгия, мышечная слабость.

Лабораторные и инструментальные данные

Частота неизвестна: повышение систолического артериального давления, снижение диастолического артериального давления.

Передозировка

Симптомы:

При передозировке ожидаемыми симптомами являются симптомы, вызванные чрезмерной бета-адренергической стимуляцией. Наиболее выраженными являются тахикардия, ощущение сердцебиения, тремор, снижение или повышение артериального давления, увеличение пульсового давления, стенокардия, аритмии, гиперемия лица. Метаболический ацидоз и гипокалиемия также наблюдались при применении фенотерола в дозах, превышающих рекомендованные дозы для утвержденных показаний.

Лечение:

Лечение препаратом Фенотэйр® должно быть прекращено. Следует провести мониторинг

кислотно-щелочного баланса и баланса электролитов.

Для лечения применяются седативные средства; в тяжелых случаях проводят интенсивную симптоматическую терапию. В качестве специфических антидотов можно назначать β-адреноблокаторы (предпочтительно селективные β_1-адреноблокаторы); в то же время следует учитывать возможность усиления обструкции бронхов и осторожно подбирать дозы этих препаратов у пациентов с бронхиальной астмой.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

β-адренергические препараты, антихолинергические средства, производные ксантина (такие, как теофиллин), кромоглициевая кислота, глюкокортикостероиды и диуретики могут усиливать действие и побочные эффекты фенотерола.

Гипокалиемия, вызванная β_2-агонистами, может быть усилена сопутствующей терапией производными ксантина, глюкокортикостероидами и диуретиками. Это особенно следует принимать во внимание у пациентов с тяжелой обструкцией дыхательных путей (см. раздел "Особые указания").

Значительное снижение бронходилатации при одновременном применении фенотерола и β-адреноблокаторов.

Агонисты β-адренорецепторов следует с осторожностью назначать пациентам, получающим ингибиторы моноаминооксидазы или трициклические антидепрессанты, которые способны усиливать действие агонистов β-адренорецепторов.

Ингаляция средств для общей анестезии, таких как галотан, трихлорэтилен и энфлуран, повышает вероятность воздействия агонистов β-адренорецепторов на сердечно-сосудистую систему.

Особые указания

Парадоксальный бронхоспазм

Как и другие ингаляционные препараты, Фенотэйр® может вызвать парадоксальный бронхоспазм, который может угрожать жизни. При возникновении парадоксального бронхоспазма препарат должен быть немедленно отменен и заменен альтернативной терапией.

Эффекты со стороны сердечно-сосудистой системы

Эффекты со стороны сердечно-сосудистой системы могут наблюдаться при применении симпатомиметических препаратов, включая препарат Фенотэйр®. Имеются данные пострегистрационных исследований и публикации в литературе о редких случаях

развития ишемии миокарда, ассоциированной с применением бета-агонистов.

Пациенты с фоновым тяжелым заболеванием сердца (например, ишемическая болезнь сердца, аритмия или тяжелая сердечная недостаточность), получающие препарат Фенотэйр®, должны быть предупреждены о необходимости обратиться за медицинской помощью при возникновении болей в груди или ухудшении течения заболевания сердца. Следует уделить внимание оценке таких симптомов, как одышка и боль в груди, поскольку они могут носить как респираторный, так и кардиальный характер.

Гипокалиемия

Потенциально серьезная гипокалиемия может развиться вследствие терапии β_2-агонистами. Рекомендуется соблюдать особую осторожность при тяжелой бронхиальной астме, поскольку гипокалиемия может потенцироваться сопутствующей терапией производными ксантина, глюкокортикостероидами и диуретиками. К тому же гипоксия может усилить влияние гипокалиемии на сердечный ритм. Гипокалиемия может привести к повышенной предрасположенности к аритмиям у пациентов, получающих дигоксин.

В таких ситуациях рекомендуется контролировать уровень калия в сыворотке.

Острая прогрессирующая одышка

Пациентам следует рекомендовать немедленно обратиться к врачу в случае острой, быстро усиливающейся одышки.

Регулярное применение

- Купирование приступов бронхиальной астмы (симптоматическое лечение) может быть предпочтительнее регулярного применения препарата;
- Пациентов необходимо обследовать для выявления необходимости в назначении или усилении противовоспалительного лечения (например, ингаляционными глюкокортикостероидами) с целью контроля воспаления дыхательных путей и предупреждения отсроченного повреждения легких.

В случае усиления бронхиальной обструкции неприемлемо и может быть рискованным увеличение кратности приема агонистов β_2-адренорецепторов, таких как препарат Фенотэйр®, сверх рекомендуемых доз и на протяжении длительного времени. Использование повышенных доз β_2-агонистов, таких как препарат Фенотэйр®, на регулярной основе для контроля симптомов бронхиальной обструкции может свидетельствовать об ухудшении контроля заболевания. В такой ситуации следует

пересмотреть план лечения и особенно адекватность противовоспалительной терапии, чтобы предотвратить потенциально опасное для жизни ухудшение контроля заболевания.

Совместное использование с симпатомиметическими и антихолинергическими бронходилататорами.

Другие симпатомиметические бронходилататоры должны применяться совместно с препаратом Фенотэйр® только под наблюдением врача. Антихолинергические бронходилататоры могут применяться одновременно с препаратом Фенотэйр®.

Влияние на результаты лабораторных исследований

Применение препарата Фенотэйр® может приводить к положительным результатам тестов на наличие фенотерола в исследованиях на злоупотребление препаратами по немедицинским показаниям, например, в связи с усилением физических возможностей у спортсменов (допинг).

Следует учитывать, что препарат содержит небольшое количество этанола (15,597 мг в одной дозе).

Меры предосторожности при применении

Хранить вдали от отопительной системы и прямых солнечных лучей.

Баллон не вскрывать. Предохранять от падений и ударов. Не бросать в огонь даже пустой баллон.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и механизмами

Исследований влияний препарата на способность к управлению автотранспортом и использованию механизмов не проводилось.

Однако пациентам нужно сообщать, что в ходе проведенных клинических исследований наблюдались такие симптомы, как головокружение. Поэтому рекомендуется соблюдать осторожность во время управления транспортными средствами или работы с механизмами.

Форма выпуска

Аэрозоль для ингаляций дозированный, 100 мкг/доза.

По 200 доз в баллоны металлические моноблочные без внутреннего покрытия. Баллоны герметизируют дозирующим клапаном и снабжают насадкой-ингалятором с защитным колпачком. На баллон наклеивают самоклеящуюся этикетку.

Каждый баллон вместе с насадкой-ингалятором и защитным колпачком, а также инструкцией по медицинскому применению помещают в пачку картонную.

Условия хранения

При температуре не выше 25 °С. Не замораживать. Защищать от воздействия прямых солнечных лучей.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

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

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Производитель/организация, принимающая претензии потребителей

АО «Биннофарм», Россия.

г. Москва, г. Зеленоград, ул. Конструктора Гуськова, д. 3, стр. 1.

Телефон: +7 (495) 646-28-68

e-mail: info@binnopharmgroup.ru

ФГБУ НЦЭСМП МЗ РФ ЭКСПЕРТНЫЙ ОТЧЕТ ДЕЙСТВИТЕЛЕН ДЛЯ ДАННОЙ ВЕРСИИ ДОКУМЕНТА 0000000000011

АКЦИОНЕРНОЕ ОБЩЕСТВО "Биннофарм" Для документов МОСКВА

144950