

САЛЬБУТАМОЛ

1. Сальбутамол

2. Асталин, Вентолин, Вентолин Небулы, Саламол, Саламол легкое дыхание, Саламол Эко, Сальбен, Сальбутамол, Сальбутамол гемисукцинат, Сальгим, Сальтос, Стеринеб Саламол, Эйромир.
3. Средства, влияющие на органы дыхания (Противоастматические средства).
4. Предупреждает развитие индуцированного аллергеном бронхоспазма.
5. Уровень убедительности доказательств А. Многочисленные клинические исследования показали, что препарат быстро и эффективно купирует симптомы бронхоспазма.
6. Цена за 1 баллончик аэрозольный (100 мкг/доза, 90 доз) – 50,2 руб.[1]; за 1 баллончик аэрозольный (100 мкг/доза, 200 доз) от 41,81 до 309,26 руб.[2]; 131,30 руб.[3].

Полноценное лечение бронхиальной астмы является экономически эффективным (GRASSIC), оптимизация диагностики и амбулаторного лечения бронхиальной астмы в детском возрасте приводит к снижению стоимости стационарного лечения.

7. Агонист β_2 -адренорецепторов, высокоселективно стимулирует β_2 -адренорецепторы, активирует внутриклеточную аденилатциклазу, оказывает выраженный бронхолитический эффект за счет расслабления гладкой мускулатуры бронхов, предупреждает и купирует бронхоспазм, снижает сопротивление в дыхательных путях, увеличивает жизненную емкость легких. Ингибирует освобождение из тучных клеток гистамина, лейкотриенов и простагландина D₂, медленно реагирующей субстанции и факторов хемотаксиса нейтрофилов и другие биологически активных веществ в течение длительного времени. Подавляет раннюю и позднюю реактивность бронхов. Положительно влияет на мукоцилиарный клиренс (при хроническом бронхите увеличивает его на 36%), стимулирует секрецию слизи, активирует функцию мерцательного эпителия. По сравнению с другими препаратами этой группы оказывает менее выраженное положительное хроно- и инотропное влияние на миокард. Вызывает расширение коронарных артерий, в терапевтических дозах практически не вызывает тахикардии и изменений артериального давления. Оказывает токолитическое действие: понижает тонус и сократительную активность миомеритрия, предупреждая преждевременные роды. Обладает рядом метаболических эффектов: снижает содержание K⁺ в плазме, влияет на гликогенолиз и выделение инсулина, оказывает гипергликемический (особенно у пациентов с бронхиальной астмой) и липолитический эффект, увеличивает риск развития ацидоза. Действие развивается быстро, начало эффекта - через 5 мин, максимум - через 30-40 мин, продолжительность - до 6 ч. Пролонгированные формы препарата, за счет постепенного высвобождения активного вещества через оболочку таблетки, обеспечивают необходимую концентрацию в плазме для поддержания терапевтического эффекта в течение 12-14 ч. При приеме внутрь (в т.ч. частичное проглатывание при ингаляции) абсорбция - высокая. C_{max} - 30 нг/мл. T_{1/2} – 3,7-5 ч. Во время ингаляции 10-20% ингалируемой дозы достигает мелких бронхов, остальная часть оседает в верхних отделах дыхательных путей. Связь с белками плазмы - 10%. Подвергается пресистемному метаболизму в печени и в кишечной стенке. Выводится почками, преимущественно, в неизменном виде и в виде неактивного фенолсульфатного метаболита в течение 72 ч и с желчью.

8. Бронхиальная астма, астматическая триада, астма физических нагрузок, хронический бронхит. Внутрь, ингаляционно - бронхоспастический синдром, бронхиальная астма (в т.ч. ночная - пролонгированные формы) - профилактика и купирование, хронические обструктивные болезни легких. В/в (с последующим переходом на прием внутрь) - угрожающие преждевременные роды с появлением сократительной деятельности; истмико-цервикальная недостаточность; брадикардия плода (в зависимости от сокращений матки в периоды раскрытия маточной шейки и изгнания).
9. Гиперчувствительность, коронаросклероз, артериальная гипертензия, сердечная недостаточность, тахикардия, миокардит, пороки сердца, особенно аортальный стеноз, декомпенсированный сахарный диабет, гипертиреоз, тиреотоксикоз, феохромоцитомы, глаукома, стенозы и стриктуры в желудочно-кишечном тракте, печеночная или почечная недостаточность, одновременный прием неселективных в-адреноблокаторов. Для ингаляционного введения: гиперчувствительность. С осторожностью - аритмия, сердечная недостаточность, гипертензия, гипертиреоз, феохромоцитомы. Для в/в введения - инфекции родовых путей, внутриутробная гибель плода, пороки развития плода, кровотечение при предлежании плаценты или преждевременной отслойке плаценты; угрожающий выкидыш (в I-II триместре беременности), детский возраст (до 2 лет).
10. Купирование приступа удушья, улучшение бронхиальной проходимости, отхождение мокроты, уменьшение одышки, улучшение физикальных данных и форсированных экспираторных легочных функциональных тестов после однократного или длительного приема, увеличение пикового объема форсированного выдоха (динамическая пикфлоуметрия).

11. Принципы подбора, изменения дозы и отмены. Внутрь: взрослым и детям старше 12 лет - 2-4 мг 3-4 раза в сутки, при необходимости возможно повышение дозы до 8 мг 4 раза в сутки. Детям 6-12 лет - 2 мг 3-4 раза в сутки, максимальная доза - 24 мг/сут; 2-7 лет - 1-2 мг 3 раза в сутки. Двухслойные таблетки: взрослым и детям - по 8 мг каждые 12 ч; максимальная доза - 32 мг/сут. Таблетки проглатывают целиком, не разжевывая. Ингаляционно: аэрозоль-дозатор (при каждом нажатии дозирующего клапана распыляется 0,1 мг). Для профилактики, взрослые - 0,1-0,2 мг (1-2 ингаляции), 4 раза, равномерно, на протяжении суток; дети старше 12 лет - до 0,1-0,2 мг 4 раза в сутки, при необходимости дозу увеличивают до 2 ингаляций 6-8 раз в сутки. Купирование приступа - 0,1-0,2 мг для детей и взрослых. Профилактика приступа астмы физического напряжения или связанного с воздействием аллергена: 0,2 мг за 15-30 мин до воздействия провоцирующего фактора. Не допускается прием более 12 ингаляций в сутки. Порошок для ингаляций: вводят при помощи дискового ингалятора (циклоалера). Для купирования приступа у взрослых - однократно; для предотвращения бронхоспазма - 3-4 раз в сутки. Разовая доза - 200-400 мкг. Суточная доза - 800-1000 мкг; при необходимости доза может быть увеличена до 1200-1600 мкг. Для профилактики бронхоспазма, вызванного физической нагрузкой - 400 мкг. Детям, для снятия приступа бронхоспазма: разовая доза - 200 мкг; для профилактики - 200 мкг/сут; кратность введения - 3-4 раза. Для предотвращения бронхоспазма, вызванного физической нагрузкой - 200 мкг, перед предполагаемой физической нагрузкой. При возникновении неприятных ощущений во рту и першения в горле, после ингаляции следует прополоскать рот водой. При тяжелом приступе возможно введение ингаляционного раствора с использованием различных конструкций небулайзеров в течение 5-15 мин: начальная доза - 2,5-5 мг 4 раза в сутки. При астматическом статусе доза может быть увеличена до 40 мг/сут. В/в капельно: 2,5-5 мг (1-2 ампулы) растворяют в 500 мл 0,9% раствора натрия хлорида или 5% раствора глюкозы. При угрозе преждевременных родов скорость в/в капельного введения - 20-40 кап/мин, зависит от интенсивности сократительной деятельности матки и от переносимости препарата (пульс беременной не должен быть чаще 120 в 1 мин). Далее проводится поддерживающая терапия приемом внутрь по 2-4 мг 4-5 раз в сутки. Первая таблетка назначается за 15-30 мин до окончания инфузии. Курс лечения - 14 дней. DDD=0,8 мг (ингаляционный аэрозоль, ингаляционный порошок), 10 мг (ингаляционный раствор).

12. Тошнота, рвота, повышенная возбудимость, тахикардия, трепетание желудочков, гипоксемия, ацидоз, гипокалиемия, гипергликемия, мышечный тремор, головная боль, галлюцинации. Лечение: симптоматическая терапия; вводят кардиоселективные бета-адреноблокаторы. При передозировке таблетированных форм препарата - промывание желудка. Тремор кистей рук, тахикардия, головная боль, головокружение, тошнота, рвота. Лечение: симптоматическая терапия; вводят антагонисты кальция типа верапамила.

13. 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 ч). Сокращение этих интервалов может иметь место только в исключительных случаях. Сопутствующая терапия глюкокортикостероидами: лечение препаратом

позволяет уменьшить поддерживающую дозу или отменить глюкокортикостероиды; темп снижения дозы не должен превышать 10% в неделю.

14. У лиц пожилого возраста из-за угрозы побочных эффектов следует избегать назначения сальбутамола перорально. Соблюдать осторожность при назначении пациентам с тиреотоксикозом, стенокардией, аритмией, артериальной гипертензией, сахарным диабетом (особенно в/в). При необходимости назначения препарата в период лактации, грудное вскармливание следует прекратить.

Категория влияния на плод – C (FDA)

(http://www.rxlist.com/cgi/generic/albut2_wcp.htm)

(http://www.rxlist.com/cgi/generic/ventolin_inh.htm)

(http://www.rxlist.com/cgi/generic/ventolin_neb.htm)

(http://www.rxlist.com/cgi/generic/ventolin_sol_wcp.htm)

(http://www.rxlist.com/cgi/generic/ventolin_syr_wcp.htm)

(http://www.rxlist.com/cgi/generic/ventolin_tab_wcp.htm).

15. Аллергические реакции (ангионевротический отек, крапивница, снижение АД, коллапс); першение в горле, кашель, парадоксальный бронхоспазм, напряженность, тревожность, головная боль, головокружение, дистальный тремор, гиперемия кожи лица, нервное напряжение, головокружение, возбуждение, нарушения сна, судороги, тошнота, рвота, сухость во рту, анорексия, задержка мочи, потливость, гипергликемия, увеличение содержания в крови свободных жирных кислот, гипокалиемия, диарея; тахикардия (при беременности - у матери и плода), аритмии, повышение АД, ишемия миокарда, сердечная недостаточность, отек легких, коллапс, развитие психической и физической лекарственной зависимости.

16. Теофиллин и другие ксантины при одновременном применении повышают вероятность развития тахиаритмий; производные ксантина, глюкокортикостероиды, диуретики повышают риск развития гипокалиемии (при тяжелом течении бронхиальной астмы), средства для ингаляционной анестезии, леводопа - тяжелых желудочковых аритмий. Ингибиторы MAO и трициклические антидепрессанты усиливают действие сальбутамола, могут привести к резкому снижению АД. Антихолинергические средства в виде ингаляторов - могут вызвать одну из форм глаукомы. Несовместим с неселективными в-адреноблокаторами. Усиливает действие стимуляторов центральной нервной системы, кардиотропность гормонов щитовидной железы. Повышает вероятность гликозидной интоксикации. Снижает эффективность гипотензивных препаратов, нитратов.

17. Интал-плюс – препарат, содержащий кромоглициевую кислоту 1 мг и сальбутамол 100 мкг в 1 дозе.

Тео-Астахалин (Индия) - препарат, содержащий 2 мг сальбутамола и 100 мг теофиллина.

Комбипэк (Россия) - препарат, содержащий 10 мг сальбутамола и 200 мг теофиллина вместе с полимерным носителем.

18. При применении аэрозоля следует четко выполнять следующие инструкции: встряхивать баллончик с аэрозолем перед каждой ингаляцией, четко синхронизировать вдох и поступление препарата, сделать максимально глубокий, интенсивный, продолжительный вдох, задержать дыхание после ингаляции препарата на 10 секунд, при затруднении выполнения дыхательного маневра использовать спейсер. При тяжелом приступе удушья перерыв между ингаляциями должен быть не менее 20 минут. При отсутствии минимального эффекта от ингаляции или появлении выраженного тремора, тахикардии, нарушении ритма сердца дальнейшее бесконтрольное использование ингалятора противопоказано и необходимо обращение к врачу.

Пациентам, которым трудно выполнить правильно дыхательный маневр, рекомендуется использовать для ингаляции препарата специальное приспособление (спейсер), увеличивающий дыхательный объем и сглаживающий неточности асинхронного вдоха. Для купирования приступов удушья необходимо дополнительно использовать препараты с быстрым бронходилатирующим эффектом; в случае уменьшения эффективности бронходилататора при купировании приступов больным не следует самостоятельно увеличивать дозу препарата.

19. Пациент должен дать согласие на лечение возможных осложнений.

20. Раствор для ингаляций (ампулы) 1 мг/мл-2,5 мл; раствор для ингаляций (флаконы) 5 мг/мл – 15 мл; сироп (флаконы) 2 мг/5 мл-100 мл; таблетки 2 мг, 4 мг; аэрозоль дозированный (баллончики), 100мкг/доза – 200 доз; раствор для ингаляций (небулы) 2,5 – 2,5 мл; таблетки ретард 8 мг, по 30 и 250 шт. в упаковке; раствор для ингаляций (ампулы) 0,1%-2,5 мл.

Фирмы: Cipla Ltd, Индия; Glaxo Wellcome Production, Франция; Glaxo Wellcome SA, Испания; Glaxo Wellcome GmbH & Co, Германия; Norton Healthcare Ltd, Великобритания; Polfa, Warsaw Pharmaceutical Works, Польша; Glaxo-Wellcom Poznan SA, Польша; 3M Medica, Германия.

21. Список Б. Аэрозольные баллоны должны храниться при температуре не выше 25°C, в защищенном от света месте, вдали от огня и источников тепла, не допускать замораживания.