

CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

FENOTEROL TEVA, 50 µg/ml, roztwór do wstrzykiwań i infuzji.

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

1 ml roztworu zawiera 50 mikrogramów fenoterolu bromowodorku (*Fenoteroli hydrobromidum*).

Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz: pkt.6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

roztwór do wstrzykiwań i infuzji

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1 Wskazania do stosowania

- przedwczesna czynność skurczowa macicy (zagrożający poród przedwczesny, zagrażające poronienie);
- zaburzona dynamika skurczów macicy w czasie porodu, zwłaszcza skurczach hipertonicznych w I i II jego fazie.

4.2 Dawkowanie i sposób podawania

Fenoterol zaleca się podawać dożylnie we wlewie kroplowym. Dawkę leku ustala się w zależności od reakcji pacjentki i indywidualnej tolerancji.

Przygotowanie roztworu do wlewu: zawartość ampułki (0,5 mg = 500 mikrogramów) rozpuszcza się w 250 ml 5% roztworu glukozy lub fruktozy i uzyskuje stężenie 0,002 mg

(2 mikrogramy) fenoterolu w 1 ml (20 kropli) roztworu.

Zwykle podaje się od 10 do 30 kropli na minutę, co odpowiada dawce od 0,001 mg do 0,003 mg (od 1 do 3 mikrogramów) fenoterolu na minutę.

W razie potrzeby dawkę zmniejsza się lub zwiększa w granicach od 0,0005 do 0,004 mg na minutę.

Jeżeli w czasie porodu konieczne jest uzyskanie natychmiastowego działania tokolitycznego, można podać dożylnie 250 kropli (12,5 ml) tj. 25 mikrogramów fenoterolu w ciągu 2 do 3 minut.

4.3 Przeciwwskazania

- nadwrażliwość na fenoterol lub którąkolwiek substancję pomocniczą;
- tyreotoksykoza;
- zaburzenia czynności serca z przyspieszaniem rytmu (tachykardia);
- zespół WPW;
- kardiomiopatia przerostowa zaporowa;
- zapalenie mięśnia sercowego;
- wady zastawki dwudzielnej;
- przedzastawkowe zwężenie aorty;
- zawał mięśnia sercowego;
- nadciśnienie płucne;
- zespół ucisku żyły głównej dolnej;
- jaskra;
- niewyrównana cukrzyca;
- hipokaliemia;
- ciężka niewydolność wątroby lub nerek;
- masywne krwawienie z dróg rodnych (przedwczesne odklejanie łożyska o prawidłowym umiejscowieniu, krwawienie z łożyska przoduującego);
- zakażenie śródmacicze.

4.4 Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

Podczas infuzji należy kontrolować czynność serca matki i płodu (czynność serca płodu nie zmienia się lub wykazuje niewielkie wahania, czynność serca matki ulega przyspieszeniu). U matki należy kontrolować także ciśnienie tętnicze, stężenie potasu, a u ciężarnych z cukrzycą - dodatkowo stężenie glukozy w surowicy krwi oraz bilans wodny.

Lek należy stosować ostrożnie w nadciśnieniu i niedociśnieniu tętniczym, zaburzeniach krzepnięcia krwi. Należy unikać jednoczesnego stosowania innych leków pobudzających układ współczulny, a także inhibitorów MAO, metyloksantyn z powodu zwiększonego ryzyka wystąpienia działań niepożądanych w układzie krążenia. Należy również wziąć pod uwagę możliwość wystąpienia hipokaliemii, zwłaszcza podczas jednoczesnego stosowania innych leków, co zwiększa ryzyko zaburzeń rytmu serca.

4.5 Interakcje z innymi lekami i inne rodzaje interakcji

Fenoterol wykazuje działanie synergistyczne z innymi agonistami receptorów

β_2 -adrenergicznych, np. klenbuterol, salbutamol, terbutalina. W działaniu na mięśnie gładkie i mięsień sercowy wykazuje synergizm również z metyloksantynami (np. teofilina, aminofilina, diprofilina). Może zwiększyć się ryzyko wystąpienia działań niepożądanych w układzie krążenia.

U pacjentów leczonych inhibitorami MAO, zastosowanie leku sympatykomimetycznego może być przyczyną nagłego, poważnego wzrostu ciśnienia krwi, nawet o charakterze przełomu nadciśnieniowego.

Działanie rozkurczowe fenoterolu nasilają leki hamujące syntezę prostaglandyn oraz kortykosteroidy, które przełamują zmniejszenie wrażliwości na te leki –tzw. „efekt przyzwalający”. Podane jednocześnie z fenoterolem zwiększają ryzyko wystąpienia obrzęku płuc.

Działanie fenoterolu całkowicie hamują nieselektywne leki β -adrenolityczne, np. propranolol, sotalol, tymolol. Kardioselektywne leki β -adrenolityczne hamują jedynie wpływ fenoterolu na serce.

Leku nie należy podawać z preparatami zawierającymi wapń i witaminę D.

Fenoterol zmniejsza hipoglikemizujące działanie leków przeciwcukrzycowych.

4.6 Cięża i laktacja

Brak odpowiednio liczebnych, kontrolowanych badań u ciężarnych kobiet. Lek może być stosowany w ciąży tylko ze wskazań położniczych. Zaleca się zachowanie szczególnej ostrożności w pierwszych trzech miesiącach ciąży.

Jeżeli poród nastąpi w krótkim czasie po zakończeniu leczenia tokolitycznego, u noworodka wystąpić mogą: tachykardia, hipoglikemia oraz zaburzenia równowagi kwasowo-zasadowej.

Nie zaleca się stosowania fenoterolu w okresie karmienia piersią.

4.7 Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów mechanicznych i obsługiwanie urządzeń mechanicznych w ruchu

Brak doniesień o wpływie fenoterolu na zdolność kierowania pojazdami i obsługiwanie urządzeń mechanicznych w ruchu.

4.8 Działania niepożądane

W obrębie każdej grupy o określonej częstości występowania objawy niepożądane są wymienione zgodnie ze zmniejszającym się nasileniem: bardzo często ($>1/10$); często ($>1/100$, $<1/10$); niezbyt często ($>1/1000$, $<1/100$); rzadko ($>1/10\ 000$, $<1/1000$); bardzo rzadko ($<1/10\ 000$); częstość nieznana (nie może być oszacowana na podstawie dostępnych danych).

Zaburzenia serca

Często: kołatanie serca

Niezbyt często: zaburzenia w EKG (częstoskurcz, skurcze dodatkowe komorowe), bóle w obrębie klatki piersiowej

Zaburzenia układu nerwowego

Często: drżenia mięśniowe, bóle i zawroty głowy, osłabienie siły mięśni

Zaburzenia żołądka i jelit

Często: nudności

Niezbyt często: wymioty, zwolnienie perystaltyki jelit

Zaburzenia metabolizmu i odżywiania

Często: zwiększenie stężenia glukozy w surowicy krwi

Zaburzenia naczyniowe

Niezbyt często: spadek ciśnienia tętniczego krwi

Zaburzenia ogólne i stany w miejscu podania

Często: wzmożona potliwość

Zaburzenia układu immunologicznego

Niezbyt często: reakcje alergiczne (pokrzywka, skurcz oskrzeli)

Zaburzenia psychiczne

Często: uczucie niepokoju

Podczas stosowania dużych dawek opisywano wystąpienie tachykardii, hipokaliemii i w pojedynczych przypadkach - obrzęku płuc.

4.9 Przedawkowanie

Przedawkowanie może być powodem arytmii i ciężkich zaburzeń hemodynamicznych, prowadzących nawet do zgonu.

W razie przedawkowania stosuje się oprócz leczenia objawowego, leki blokujące receptory β -adrenergiczne, np. propranolol, sotalol, tymolol.

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

5.1 Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: Leki sympatykomimetyczne powstrzymujące akcję porodową; kod ATC: G02C A03.

Fenoterol wykazuje działanie selektywnie pobudzające receptory β_2 -adrenergiczne. Receptory te położone są postsynaptycznie na komórkach efektowych układu współczulnego i w niewielkich ilościach, na zakończeniach presynaptycznych neuronów noradrenergicznych układu współczulnego.

Postsynaptyczne receptory β_2 -adrenergiczne występują w przeważającej liczbie w obrębie mięśniówki gładkiej oskrzeli, w mięśniówce macicy oraz naczyń krwionośnych, zaopatrujących mięśnie szkieletowe. Receptory β_2 -adrenergiczne mają duży wpływ na gospodarkę węglowodanową. Aktywacja tych receptorów w wątrobie i mięśniach szkieletowych wywołuje nasilenie glikogenolizy, czego następstwem jest hiperglikemia i hiperlaktacidemia.

Pobudzenie receptorów β_2 -adrenergicznych w mięśniach gładkich powoduje zmniejszenie stężenia wolnych jonów Ca^{++} w komórkach (wynik pobudzenia pompy jonowej usuwającej jony Ca^{++} do przestrzeni pozakomórkowej, jak też zwiększonego magazynowania Ca^{++} w siateczce endoplazmatycznej).

W konsekwencji, w następstwie pobudzenia receptorów β_2 -adrenergicznych:

- zmniejsza się napięcie skurczowe macicy,
- rozkurcza się mięśniówka gładka oskrzeli,
- dochodzi do zahamowania uwalniania z komórek tucznych substancji kurczących oskrzela (dzięki zapobieganiu degranulacji komórek tucznych),
- przyspiesza się aktywność transportowa nabłonka rzęskowego oskrzeli,
- zwiększa się sekrecja gruczołów oskrzelowych, następuje zmiana struktury wydzieliny.

Fenoterol, w porównaniu z terbutaliną i salbutamolem, wywiera dwa razy silniejszy wpływ rozkurczający na mięśniówkę gładką.

Fenoterol należy do leków doraźnie poprawiających drożność oskrzeli. Wynika to z hamowania wczesnej odpowiedzi bronchospastycznej, występującej po kilku minutach jako reakcja na inhalację alergenów. Nie wpływa na fazę późną, na którą oddziałują leki stosowane profilaktycznie.

Leki z grupy, do której należy fenoterol mogą również słabo pobudzać receptory β_1 -adrenergiczne.

β_2 -agoniści oddziałują również na układ krążenia. Są to z jednej strony wpływy korzystne, a z drugiej niepożądane. O końcowym efekcie decyduje często stan pacjenta, stopień wydolności krążenia. Powodują przyspieszenie czynności serca, zwiększają zapotrzebowanie mięśnia na tlen, powodują

wzrost zużycia tlenu oraz obniżenie ciśnienie parcjalego tlenu w krwi tętniczej, co jest zjawiskiem niepożądanym, zwłaszcza u chorych z hipoksją.

Obserwowano także zaburzenia metaboliczne, zwiększenie stężenia wolnych kwasów tłuszczowych i wydłużenie odstępu QT w zapisie EKG oraz hipokaliemię - co może sprzyjać zaburzeniom rytmu serca.

Z pośród aktualnie stosowanych B₂-agonistów, wpływ fenoterolu na układ krążenia uważa się za najslabszy.

5.2. Właściwości farmakokinetyczne

Po podaniu dożylnym działanie terapeutyczne fenoterolu rozpoczyna się po kilku minutach, maksimum osiąga po około 10 minutach i utrzymuje się od 4 do 8 godzin. Czas działania zależy głównie od wielkości zastosowanej dawki oraz intensywności skurczów mięśniówki gładkiej. Biologiczny okres półtrwania leku wynosi od 6 do 7 godzin.

Fenoterol w postaci nieaktywnych metabolitów wydalany jest z moczem, a także z żółcią. Lek w niewielkim stopniu przenika przez łożysko oraz do mleka kobiet karmiących.

5.3. Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

Toksyczność ostra (LD₅₀) fenoterolu u myszy, po podaniu dożylnym wynosi 48,0 mg/kg mc.(46,8 - 49,2), a po podaniu dootrzewnowym 255,0 (247,1 - 263,1) mg/kg mc.

6. DANE FARMACEUTYCZNE

6.1. Wykaz substancji pomocniczych

sodu chlorek, kwas solny, woda do wstrzykiwań, azot.

6.2. Niezgodności farmaceutyczne

Lek należy rozcieńczać w 5% roztworze glukozy lub fruktozy. Nie stosować do rozcieńczeń soli fizjologicznej.

6.3 Okres ważności

3 lata

6.4. Specjalne środki ostrożności przy przechowywaniu

Przechowywać w temperaturze poniżej 25°C, chronić przed światłem.

Przechowywać w miejscu niedostępnym i niewidocznym dla dzieci.

6.5. Rodzaj i zawartości opakowania

Ampułki ze szkła typu I ,w pudełku tekturowym ,

10 ml w ampułce, 15 ampulek..

6.6. Instrukcja dotycząca przygotowania leku do stosowania (i usuwania jego pozostałości)

Patrz p. Dawkowanie i sposób podawania.

7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Teva Pharmaceuticals Polska Sp. z o.o.
ul. Emilii Plater 53, 00 – 113 Warszawa

8. NUMER (-Y) POZWOLEŃ NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Nr 5897;

Nr-R/3136

9. DATA WYDANIA PIERWSZEGO POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU/DATA PRZEDŁUŻENIA POZWOLENIA

27.05.1994;

01.12.1999

RR/0399/05 – 31.03.2005

RR/0171/06 – 10.02.2006

10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO

12.12.2008/ 15.06.2010 r./ 10.08.2010