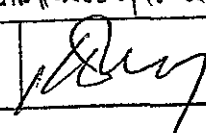


PARTUSISTEN

Tabl.

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА



МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО	
Приложение към разрешение за употреба № 2980/18.01.04	
601/19.12.00	

1. Име на лекарственото средство:

Partusisten

/Партусистен/

2. Състав:

1 таблетка съдържа

5,0 mg

1-(3,5-дихидрокси-фенил)-2-[[1-(4-хидрокси-бензил)-етил]-амино]-
етанол хидробромид (= фенотерол хидробромид)

3. Лекарствена форма:

таблетки от 5 mg

4. Клинични данни:

4.1. Показания:

Подтискане на преждевременно раждане в интервала от 20-та до началото на 37-ма седмица от бременността или в периода, в който белите дробове на плода се развиват и докато е налице явен риск от преждевременно раждане (преценен въз основа на състоянието на матката).

4.2. Дозировка и начин на приложение:

Обичайните дози са следните:

1 таблетка с малко течност през 3-6 часа (1 табл. 4-8 пъти дневно). Интервалите между приемите на таблетките не трябва да надвишават 6 часа.

Ако Партусистен табл. са предписани след инфузия с Партусистен инфузионен концентрат, първата таблетка трябва да бъде приложена 15-30 минути преди края на i.v. инфузия.

Продължителността на маточно релаксиращата терапия се определя от лекаря въз основа на моментната степен на риска и тежестта на нежеланите лекарствени реакции, напр. учестена сърдечна дейност.

Ако пациентът показва повишена чувствителност към симпатикомиметични препарати, Partusisten трябва да се предписва в ниски дози в зависимост от конкретния пациент. Прилага се винаги при непосредствен лекарски контрол по отношение на кардиоваскуларната система.



4.3. Противопоказания:

Партусистен не трябва да се прилага при пациенти със свръхчувствителност към някоя от съставките, пациенти със сърдечни заболявания (особено при тахиаритмия, миокардит, дефекти на митралната клапа, хипертрофична обструктивна кардиомиопатия, синдром на Wolff-Parkinson-White), синдром на компресия на vena cava, наскоро прекаран инфаркт на миокарда, тиреотоксикоза, тежко чернодробно или бъбречно заболяване, амниотична инфекция, неконтролиран захарен диабет, тежък маточен кръвоизлив (abruptio placentae, placenta previa), хипокалиемия или ако е известно, че плодът има тежки малформации без шансове да оживее.

4.4. Специални противопоказания и специални предупреждения за употреба:

Препаратът трябва да се прилага внимателно при следните случаи: пациенти с хипертония, хипотония, непоносимост към бета-адренергични агенти, дистрофия миотоника, констипация, плацентарна инсуфициенция или преекламптична токсемия (синдром, възникващ по време на бременност, характеризиращ се с хипертония, едем и понижена бъбречна функция).

Преди започване на лечение трябва да се направи ЕКГ и да се добави калий, ако съществува хипокалиемия.

По време на лечение с Партусистен е необходимо проследяване на пулсовата честота и кръвното налягане на майката, както и сърдечната честота на плода. Това ще осигури ранно откриване на евентуално възникнали симптоми на предозирание.

Ако е налице необичайно изразено ускоряване на сърдечната честота на майката (над 130 удара/мин или учестяване с повече от 50 %) или явно спадане на кръвното налягане, дозата трябва веднага да бъде намалена; ако се развият тежки симптоми с признаци на понижена дейност на миокарда, както и диспнея, усещане за стягане в гърдите (усещане за напрежение) и сърдечна болка (ангина пекторис), лечението с Партусистен трябва веднага да бъде преустановено и да се извърши цялостен преглед, включително да се направи ЕКГ.

При бременни жени с диабет, лекувани с Партусистен е необходимо да се определят нивата на захарта в кръвта и урината през регулярни интервали от време. Ако диабетът



изисква лечение по време на лечение с Партусистен, може да се наложи увеличаване на дозата на инсулина.

Преди инхалационна анестезия като предпазна мярка се препоръчва да се изследват електролитите, особено калий и да се назначи ЕКГ. Концентрацията на инхалационните анестетици трябва да бъде поддържана ниска, независимо, че при Партусистен не е била установена повишена чувствителност на миокарда към симпатомиметичните препарати. Преди началото на анестезията е необходимо изпразването на стомаха, за да се предотврати аспирация на стомашно съдържимо.

В случаи на хронична плацентарна недостатъчност, особено със забавяне на интраутеринния растеж, маточнорелаксиращото лечение трябва да бъде продължено до раждането на жизнено дете, тъй като плацентарната недостатъчност представлява риск за плода, който се засилва с напредване на бременността. При продължително маточнорелаксиращо лечение е необходимо със стандартни процедури да бъдат определени състоянието на плода и плацентата.

Продължителното лечение (повече от 2 седмици с повече от 6 таблетки дневно, повече от 3 перлонгети дневно или повече от 1 седмица инфузионна терапия) може да доведе до закъсняла зрялост на белите дробове на плода. Поради това се препоръчва да се проследява зрелостта на белите дробове на плода, ако не е възможно да се прекъсне утерорелаксиращото лечение през последната седмица.

Клиничните прояви на *abruptio placentae* могат да станат по-малко изразени по време на утерорелаксиращото лечение.

Клиничните симптоми на *dystrophia myotonica* могат да станат по-изразени по време на утерорелаксиращото лечение с Партусистен. В такива случаи се препоръчва приложението на фенитоин.

При пациенти с тенденция към едем, приемът на сол по време на утерорелаксиращо лечение трябва да бъде намален и пациентката да бъде проследена за признаци на задръжка на течности. Това е особено важно, ако са приложени едновременно кортикостероиди с оглед да се осигури узряването на белите дробове на плода.



4.5. Лекарствени и други взаимодействия:

Партусистен не трябва да се прилага едновременно с препарати, съдържащи калций, витамин D или с дихидротахистерол.

Партусистен не трябва да се използва едновременно с инхибитори на простагландиновата синтеза. В случай на краткотрайно комбинирано лечение с глюкокортикоиди за постигане на феталната белодробна зрялост е необходима внимателна преценка на съотношението възможен риск за майката и терапевтичната полза за новороденото.

Трябва да се избягва едновременното приложение на симпатомиметични лекарства, като някои кардиоваскуларни и антиастматични средства, тъй като това може да доведе до засилен ефект върху сърцето и до симптоми на предозиране.

Кардиоселективните бета-блокери не повлияват ефекта върху гладката мускулатура, напр. върху матката, но могат да противодействат на ефектите на Партусистен върху сърцето. Некардиоселективните бета-блокери отслабват всички ефекти на Партусистен, включително релаксацията на гладката мускулатура.

4.6. Бременност и кърмене:

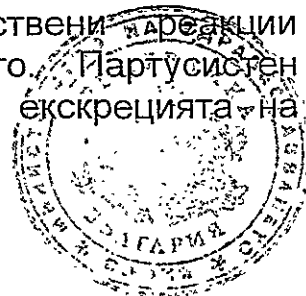
Препаратът няма приложение при нормална бременност и кърмене.

4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини:

Не са известни.

4.8. Нежелани лекарствени реакции:

Особено при свръхчувствителни пациенти, Партусистен може да предизвика фин тремор на пръстите, безпокойство, палпитации, тахикардия, замаяване или главоболие. В отделни случаи могат да се наблюдават гадене, повдигане и повръщане. Сърдечната дейност на майката е учестена. Сърдечната дейност на плода обикновено не се засяга или показва само малки вариации. Също може да се наблюдава леко спадане на диастоличното кръвно налягане. Тези нежелани лекарствени реакции отзвучават бързо при прекъсване на лечението. Партусистен може да предизвика преходна инхибиция на екскрецията на урината и едем.



В много редки случаи при приложение на Партусистен, както и при прилагане на други симпатикомиметични средства е била наблюдавана ангина пекторис, протичаща с изявена тахикардия, както и вентрикуларни екстрасистоли.

По време на лечение с Партусистен глюкозата в кръвта е леко повишена. Този ефект е по-изразен при пациенти с диабет.

През първите няколко дена от лечението серумните концентрации на калия могат леко да спаднат. Рядко е било наблюдавано преходно повишаване на серумните трансаминази. По време на утерорелаксиращо лечение може също да възникне инхибиране на интестиналната перисталтика, затова е необходимо по време на лечение с Партусистен да се осигури регулярна евакуация на чревното съдържимо. В случай, че детето е родено малко преди края на лечението с Партусистен е възможно през първите няколко часа от живота му да се наблюдава преходно нарушение на баланса инсулин/глюкоза. Поради възможността от преминаване на кисели метаболитни продукти (лактати, кетокиселини) през плацентата е необходимо особено внимание при приложение с оглед възможното индуциране на ацидоза в новороденото.

4.9. Предозиране:

Симптоми на предозиране, манифестирани като забележимо учестяване на сърдечната дейност на майката и тежки субективни нежелани лекарствени реакции, могат да бъдат открити при регулярно проследяване на пулсовата честота.

При пациенти с диабет ако се влошат метаболитните параметри може да бъде необходимо да се повиши дозата инсулин и да се назначи лечение на ацидозата.

Ако симптомите на предозиране са тежки, всички ефекти на Партусистен могат да бъдат отстранени от некардиоселективни бета-блокери. При пациенти с бронхиална астма трябва да се има предвид възможността за засилване на бронхиалната обструкция. Ако е необходимо поддържане на утерорелаксиращия ефект трябва да бъде приложен бета₁-селективен рецепторен блокер.

В случаи на сърдечна недостатъчност и/или белодробен едем трябва незабавно да бъде започнато интензивно лечение.



5. Фармакологични данни:

5.1. Фармакодинамични свойства:

Партусистен проявява релаксиращ ефект върху маточната мускулатура като стимулира бета-адренергичните рецептори и инхибира контракциите, които са преждевременни или много интензивни.

Партусистен притежава две особени предимства. Първо той е ефективен дори и при ниски дози; второ като преобладаващ бета₂-рецепторен стимулант притежава по-изразен ефект върху матката, отколкото върху кардиоваскуларната система.

5.2. Фармакокинетични свойства:

Партусистен съдържа активната съставка фенотерол хидробромид, който е бета-адренергичен агент с изразена селективност към β_2 -рецепторите. Фенотерол хидробромид е известен като ефективно утерорелаксиращо средство, дори и при ниски дози. Абсорбираната активна съставка се метаболизира при първо преминаване като образува конюгати в чревната стена (около 90%). Пиковите плазмени концентрации се достигат 1-2 часа след перорално приложение.

Ако са приложени препоръчаните терапевтични дози, при перорално и интравенозно приложение се очакват идентични плазмени нива, тъй като са взети предвид разликите във фармакокинетиките на двете форми на дозиране.

При всички проучени животински видове, както и при хора са били открити само много малки количества от лекарството да преминават през плацентарната бариера.

5.3. Предклинични данни за безвредност:

Проучвания за остра токсичност при плъхове и мишки са довели до смъртни случаи при половината от животните (LD₅₀) при перорална доза от 2200 до 3000 mg/kg, при интраперитонеална доза от 260 до 530 mg/kg и при интравенозна доза от 42 до 76 mg/kg. При ловджийски кучета LD₅₀ е била 150 mg/kg при перорално приложение и 81 mg/kg при интравенозно приложение. При интравенозно приложение при зайци за период над 1 месец са възникнали няколко смъртни случая при дози от 50 mg/kg дневно и миокардна дилатация при дози, до високи от 25 mg/kg/ден. Ишемични лезии на сърцето са били открити при 11 от 45 плъха след перорално приложение за 6



месеца, особено при по-високи дози (300 mg/kg/ден). В контролната група са били открити 2 исхемични лезии. Парентерални дози от 25 20 200 mg/kg фенотерол са били приложени на маймуни - песоглавци, третирани със седативи при опит да се установи токсичност. Смърт е наблюдавана при 2 животни – 1 по време на възстановяване от кетаминова седативна терапия и 1 малко след приложение на фенотерол и след леки конвулсии по време на кетаминово възстановяване. При по-високи дози е бил наблюдаван намален прием на храна. Не са били наблюдавани прекалена възбудимост и агресивност. Не е била установена постоянна минимална летална доза. Тя е определена от 40 до 75 mg/kg. При проучвания за тератогенност не е бил установен тератогенен ефект.

6. Фармацевтични данни:

6.1. Списък на помощните вещества и техните количества:

Lactose	46,0000 mg
Maize starch	32,0000 mg
Aerosil 200	1,2000 mg
Stearic acid SZ 205	0,8000 mg
Water purified	

6.2. Физико-химични несъвместимости:

Не са известни.

6.3. Срок на годност:

Срокът на годност на Партусистен табл. е 36 месеца. Да не се прилага след изтичане на датата, означена върху опаковката.

6.4. Инструкции за съхранение:

Да се съхранява на сигурно място извън достъпа на деца!

6.5. Опаковка:

PVC блистер

6.6. Инструкции за употреба:

Виж т. 4.2.



7. Производител:

Boehringer Ingelheim International GmbH
Binger Strasse 173
Ingelheim am Rhein
Germany

8. Страни, в които е регистрирано лекарственото средство:

Унгария, Германия, Еквадор, Чехия, Кипър, Чили, Белгия,
Италия, Литва, Люксембург, Мексико, Полша, Русия, Словакия,
Швейцария, Украйна, Югославия.

9. Първа регистрация на лекарственото средство:

Чехия - № 54/135/75-С – 29.04.1975

