

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

АСКОРІЛ (ASCORIL)

Склад:

діючі речовини: 1 таблетка містить сальбутамолу сульфату еквівалентно сальбутамолу 2 мг, бромгексину гідрохлориду 8 мг, гвайфенезину 100 мг;

допоміжні речовини: кальцію гідрофосфат, крохмаль кукурудзяний, метилпарагідроксибензоат (Е 218), пропілпарагідроксибензоат (Е 216), тальк, кремнію діоксид колоїдний безводний, магнію стеарат.

Лікарська форма. Таблетки.

Основні фізико-хімічні властивості: білі, округлі, плоскі зі скошеними краями таблетки, з лінією розлому з одного боку.

Фармакотерапевтична група.

Комбіновані засоби, що застосовуються при кашлі та застудних захворюваннях. Відхаркувальні засоби. Комбінації.

Код АТХ R05C A10.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Сальбутамол. Сальбутамол – прямий симпатоміметик, селективний агоніст β_2 -адренорецепторів. Основна дія β_2 -адреноміметиків полягає у здатності стимулювати аденілатциклазу – фермент, який каталізує утворення циклічного аденозинмонофосфату (цАМФ) з аденозинтрифосфату (АТФ). Збільшення кількості цАМФ спричиняє розслаблення гладких м'язів бронхів і пригнічує виділення медіаторів негайної гіперчутливості з клітин, особливо опасистих. Сальбутамол розслаблює гладкі м'язи бронхів, матки, судинного ложа скелетних м'язів. Сальбутамол чинить сильнішу і довгшу дію на β_2 адренорецептори, ніж ізопротеренол. Сальбутамол може також покращувати механізми мукоциліарного транспортування.

Бромгексин чинить відхаркувальну і муколітичну дію. Бромгексин – похідне бензиламіну і вазицину. Збільшує об'єм мокротиння, знижує його в'язкість та сприяє його евакуації з бронхів; стимулює гідролітичну деполімеризацію мукопротеїнових волокон і стимулює активність миготливого епітелію. Відомо, що бромгексин здійснює вивільнення лізосомальних ферментів бронхіальними залозами. Відомо також про інші фармакологічні ефекти бромгексину: підвищення секреції екзокринних залоз (наприклад, слезовиділення) і збільшення продукції легеневого сурфактанта. Одночасне застосування бромгексину з окситетрацикліном, еритроміцином, ампіциліном, амоксициліном призводить до підвищення їх концентрації в мокротинні.

Вважається, що збільшенню секреції екзокринних залоз під час застосування бромгексину може сприяти метаболіт бромгексину, амброксол (NA-872).

Гвайфенезин. Дія гвайфенезину полягає у стимуляції рецепторів слизової оболонки шлунка і рефлекторному стимулюванні секреції залоз дихальних шляхів. У результаті цього збільшується об'єм і знижується в'язкість бронхіального секрету.

Фармакокінетика.

Сальбутамол.

Сальбутамол добре абсорбується з травного тракту, його біодоступність становить від 50 % до 85 %. Після перорального застосування максимальна концентрація (C_{max}) у плазмі крові настає через 1-4 години (T_{max}). Їжа не впливає на біодоступність сальбутамолу. Зв'язується з білками у кількості 10 %. Об'єм розподілу (V_d) становить 156 +/- 38 літрів. Сальбутамол метаболізується у печінці донеактивного сульфатного кон'югату. Виводиться сальбутамол переважно нирками. Від 64 % до 98 % виводиться із

сечею та 1,2-7 % – із калом. Період напіввиведення сальбутамолу становить 3-6,5 години.

Бромгексин.

Бромгексин добре всмоктується з травного тракту. Максимальна концентрація бромгексину в сироватці крові настає приблизно через 1 годину після прийому препарату. Метаболізується в печінці до активного метаболіту – амброксолу. Бромгексин виводиться в основному з сечею у вигляді метаболітів, лише незначна його частина виводиться у незміненому стані. Період напіввиведення бромгексину – 6,5 години.

Гвайфенезин.

Гвайфенезин добре абсорбується з травного тракту. 60 % гвайфенезину гідролізується в крові протягом 7 годин з утворенням \square (2-метоксифеноксид)-молочної кислоти. Гвайфенезин виводиться з сечею у формі метаболітів. Період напіввиведення гвайфенезину – 1 година.

Клінічні характеристики.

Показання.

Симптоматичне лікування продуктивного кашлю при різних захворюваннях органів дихання, що супроводжуються бронхоспазмом.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до сальбутамолу, інших симпатоміметиків, бромгексину, гвайфенезину, ментолу або до будь-якого з інших компонентів препарату. Коронарна недостатність, аритмія, інші тяжкі серцево-судинні захворювання, гіпертиреоз, тяжкі порушення функції печінки, виразка шлунка та дванадцятипалої кишки.

Особливі заходи безпеки.

Сальбутамол, як і інші стимулятори β -адренорецепторів, необхідно призначати з обережністю пацієнтам із судомними розладами, цукровим діабетом.

У деяких пацієнтів, як і після застосування будь-яких інших агоністів β -адренорецепторів, можуть спостерігатися клінічно важливі зміни систолічного і діастолічного артеріального тиску. Відомо, що стимулятори β -адренорецепторів можуть спричинити зміни ЕКГ, такі як: згладжування зубця Т, подовження інтервалу QT, депресію сегмента ST. Тому сальбутамол необхідно застосовувати з обережністю пацієнтам із захворюваннями серцево-судинної системи, особливо при артеріальній гіпертензії.

Потреба збільшення дози сальбутамолу свідчить про погіршення контролю над астмою і вимагає перегляду терапії, у разі необхідності – призначення кортикостероїдів.

З обережністю необхідно застосовувати гвайфенезин у лікуванні кашлю з надмірним виділенням мокротиння, персистуючого чи хронічного кашлю, що виникає внаслідок тютюнопаління, астми, хронічного бронхіту, емфіземи.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Однотимчасне застосування інгібіторів моноаміноксидази та непрямих симпатоміметиків часто спричиняє гіпертонічний криз. Прямі симпатоміметики не протипоказані для призначення хворим, що лікуються інгібіторами MAO. Проте описані поодинокі випадки, коли виникнення таких побічних ефектів, як тахікардія та гіпоманіакальний стан, пов'язували з цією взаємодією.

У здорових добровольців, які приймали дигоксин протягом 10 днів, спостерігалось збільшення його концентрації з 16 % до 22 % в сироватці крові після одноразового призначення сальбутамолу.

Гіпокаліємія, що розвивається внаслідок застосування препаратів, які містять сальбутамол, може підвищитися при одночасному застосуванні діуретиків. Унаслідок цього підвищується ризик розвитку аритмій при застосуванні на тлі такого лікування серцевих глікозидів. Ефекти сальбутамолу можуть бути зменшені при одночасному використанні β -адреноблокаторів, особливо невібіркових (таких як пропранолол), а також можуть підсилитися при одночасному застосуванні ксантинів (наприклад теофіліну).

β-блокатори можуть не лише блокувати бронхорозширювальний ефект β-агоністів, а й спричиняти бронхоспазм у пацієнтів з бронхіальною астмою. Тому пацієнтам з астмою протипоказане застосування β-блокаторів.

Але за певних обставин, наприклад, як профілактика після інфаркту міокарда, застосування β-блокаторів для пацієнтів з астмою може бути розглянуто. У таких випадках їх слід застосовувати з обережністю. Діуретики β-агоністи можуть погіршувати спричинені застосуванням діуретиків, що виводять калій (таких, як петлеві та тіазидні), зміни ЕКГ і/чи гіпокаліємію.

Хоча клінічне значення цих ефектів невідоме, рекомендується проявляти обережність у спільному прийомі β-агоністів з діуретиками, що виводять калій.

Не слід одночасно застосовувати сальбутамол з препаратами для інгалаційного наркозу, адреналіном, трициклічними антидепресантами та кортикостероїдами.

Також не рекомендується одночасно застосовувати сальбутамол та інші пероральні симпатоміметики, оскільки така комбінація може призвести до серцево-судинних порушень.

Бромгексин не призначати одночасно з лікарськими засобами, що містять кодеїн. При одночасному застосуванні бромгексину та препаратів, що подразнюють травний тракт, можливе взаємне посилення подразнювальної дії на слизову оболонку шлунка. Одночасний прийом з антибіотиками (амоксицилін, еритроміцин, цефуроксим, доксицилін), сульфаніламідними препаратами сприяє підвищенню їх концентрації у бронхіальному секреті. При прийомі одночасно з лікарськими засобами, що пригнічують кашльовий центр, можливе утруднення відходження розрідженого мокротиння (накопичення бронхіального секрету у дихальних шляхах). Можливий одночасний прийом з бронходилататорами.

Гвайфенезин підсилює дію лікарських засобів, що пригнічують центральну нервову систему, а також етанолу. Також може зумовити хибно-позитивні результати діагностичних тестів, при яких визначають 5-гідроксиіндолоцетну та ванільмигдалеву кислоти у сечі.

Немає даних щодо негативної взаємодії ментолу з іншими лікарськими засобами.

Особливості застосування.

Препарат слід застосовувати з обережністю пацієнтам, які хворіють на глаукому.

Дуже рідко на тлі застосування бромгексину мають місце тяжкі шкірні реакції, наприклад синдром Стівенса-Джонсона та синдром Лайєлла. При появі змін на шкірі та слизових оболонках слід негайно звернутися до лікаря, а застосування препарату припинити.

При порушенні бронхіальної моторики, що супроводжується утворенням великої кількості бронхіального секрету (злякисний синдром війок), препарат слід застосовувати з особливою обережністю через можливий застій секрету.

При порушенні функції нирок (включаючи тяжку ниркову недостатність) або захворюваннях печінки (при печінковій недостатності середнього та легкого ступеня тяжкості) слід застосовувати з особливою обережністю (зменшуючи дозу або збільшуючи інтервал часу між застосуванням).

Рекомендується періодичний контроль функції печінки, особливо при тривалому застосуванні.

Перед початком лікування та під час лікування таких хворих необхідно контролювати рівень глюкози в крові.

Повідомлялося про поодинокі випадки виникнення ішемії міокарда, асоційованої із застосуванням сальбутамолу. Пацієнтам із хворобами серця (наприклад ішемічна хвороба серця), які лікуються сальбутамолом сульфатом, у разі виникнення болю в грудях або інших симптомів, що свідчать про загострення хвороби серця, слід звернутися за медичною допомогою. Слід звернути увагу на оцінку таких симптомів як ядуха та біль у грудях, що можуть бути наслідком як захворювання серця, так і захворювань дихальної системи.

Результатом лікування β₂-агоністами може бути тяжка гіпокаліємія, рекомендується перевіряти рівень калію в сироватці крові.

Як і інші агоністи β -адренорецепторів, сальбутамолу сульфат може призводити до оборотних метаболічних змін, наприклад до збільшення рівня цукру в крові. У результаті цього були окремі повідомлення про розвиток кетоацидозу у хворих на цукровий діабет. Одночасне застосування кортикостероїдів може загострити цей стан.

Не призначати пацієнтам перед застосуванням наркозу.

Препарат не можна застосовувати хворим з гіпертрофічною кардіоміопатією.

При наявності шлункових кровотеч в анамнезі препарат слід застосовувати під контролем лікаря. При лікуванні препаратом необхідно вживати достатню кількість рідини, що збільшує відхаркувальну дію бромгексину.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Не застосовувати.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

Слід утримуватись від керування автотранспортом і роботи з іншими механізмами під час лікування препаратом.

Спосіб застосування та дози.

Дорослим та дітям віком від 12 років застосовувати внутрішньо по 1 таблетці 3 рази на добу.

Діти віком від 6 до 12 років: по ½-1 таблетці 3 рази на добу.

Тривалість лікування визначається індивідуально.

Діти.

Не призначати препарат дітям віком до 6 років.

Передозування.

Симптоми: збудження, сплутаність свідомості, пригнічення дихання, часте дихання, порушення свідомості, атаксія, диплопія, легкий метаболічний ацидоз, аритмії, біль у грудях, гіпотензія аж до шоку, прискорене серцебиття, тахікардія і сильний тремор, особливо в руках. Можливі скарги з боку шлунково-кишкового тракту, включаючи нудоту і блювання; судоми, екстрасистолія, сонливість, головний біль, гіперглікемія, болі у животі, загострення виразкової хвороби шлунка.

Лікування. Терапія симптоматична, спостереження за допомогою електрокардіографії показано для контролю функції серця.

Побічні реакції.

З боку імунної системи: реакції гіперчутливості, що включають у себе висипи, свербіж, анафілактичні реакції, у тому числі анафілактичний шок, ангіоневротичний набряк, кропив'янку, орофарингеальний набряк, синдром Лайєлла; рідко при пероральному застосуванні сальбутамолу у дітей може виникнути мультиформна еритема, синдром Стівенса-Джонсона, набряк обличчя.

З боку травного тракту: диспепсичні явища, нудота, блювання, діарея, біль у животі, загострення виразкової хвороби шлунка/виразок кишечника, гастралгія, неприємний присмак у роті

З боку нервової системи: тремор, міалгія, головний біль, гіперактивність, дисгевзія, запаморочення, неспокій, безсоння, парестезія ротоглотки.

З боку серцево-судинної системи: тахікардія; периферична вазодилатація; порушення серцевого ритму, включаючи фібриляцію шлуночків, суправентрикулярну тахікардію та екстрасистолію; гіпотензія або гіпертензія; відчуття серцебиття; ішемія міокарда; колапс.

З боку дихальної системи: розлади дихання, посилення кашлю.

Сальбутамол може спровокувати парадоксальний бронхоспазм, що є життєво небезпечним станом. У разі його виникнення необхідно негайно припинити застосування препарату і призначити альтернативне лікування.

Інші: міоспазм, судоми м'язів, відчуття тиску у м'язах, гіпертермія, озноб, мідріаз, атонія сечового міхура, підвищена пітливість, гіперглікемія, тромбоцитопенія, метаболічні зміни, такі як гіпокаліємія.

У деяких пацієнтів може розвинутися транзиторне підвищення рівня амінотрансфераз у крові, спричинене бромгексином.

Метилпарагідроксибензоат (Е 218) може спричиняти алергічні реакції (можливо, уповільнені).

Термін придатності.

2 роки.

Умови зберігання.

Зберігати в сухому, захищеному від світла місці при температурі не вище 25 °С.

Зберігати в недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 10 таблеток у блістері, по 1 або по 2, або по 5 блістерів у картонній упаковці.

Категорія відпуску.

За рецептом.

Виробник.

Гленмарк Фармасьютикалз Лтд./GlenmarkPharmaceuticalLtd.

Місцезнаходження виробника та його адреси місця провадження діяльності.

1. Дільниця № Е – 37/39, Ем.Ай.Ді.Сі., Сатпур, Насік - 422 007, Махараштра, Індія/
Plot No E- 37/39, M.I.D.C. Industrial Estate, Satpur, Nasik 422 007, Maharashtra, India

2. Селище Кішанпура, Бадді-Налагарх Роуд, Техсіл Налагарх, округ Солан, (Х.П.) 174101, Індія/
Village - Kishanpura, Baddi-Nalagarh Road, Tehsil Nalagarh, Distt. Solan, H.P. 174101, India