

Stoptussin

butamirát, guaifenesin

Kašel je účelový obranný reflex, který odstraňuje sputum, mikroby, cizí tělíska a cizorodé látky a udržuje dýchací cesty průchodné. Tlumíme jej hlavně tam, kde narušuje některé základní životní funkce (spánek, příjem potravy). Většinou však – např. u suchého dráždivého kašle – zároveň podporujeme expektoraci.

Antitusika jsou léčiva tlumící suchý neproduktivní kašel na jednotlivých místech reflexního oblouku kašle. Rozdělují se podle mechanismu účinku na látky kodeinového typu a látky nekodeinového typu. Jejich hlavní indikací jsou úporné stavy suchého a dráždivého kašle.

Antitusika kodeinového typu působí na centrum pro kašel v prodloužené míše, obvykle mají analgetický účinek a při předávkování mohou vést k útlumu dechového centra. Při jejich dlouhodobém podávání existuje riziko vzniku závislosti. Antitusika nekodeinového typu působí patrně především svým lokálně anestetickým účinkem, který ovlivňuje nervová vlákna vedoucí aferentně dráždivé podněty z dýchacích cest nebo přímo na centrum pro kašel. Jejich centrální působení je výrazně slabší než u antitusik kodeinového typu, nemají analgetický účinek a po jejich podávání nebyl dosud popsán vznik závislosti.

Expektorancia se používají ke zlepšení vykašlávání sekretu z dýchacích cest. Jejich účinek spočívá ve snižování viskozity hlenu a v aktivaci očisťovacích funkcí dýchacích cest.

Antitusika snižují dráždění ke kašli, expektorancia zvyšují sekreci bronchiálních žláz. Obě skupiny nacházejí uplatnění při zánětlivých onemocněních dýchacího ústrojí. Expektorancia vhodně doplňují účinky antitusik, neboť zvýšení sekrece hlenu a snížení jeho viskozity nepřímou snižuje dráždivost ke kašli.

V přípravku Stoptussin (TEVA) jsou obsaženy dvě na první pohled kontraproduktivní účinné látky – guaifenesin a butamirát citrát.

Charakteristika

Guaifenesin je látka, která zřetelně působí průduškový hlen (sekretolytikum), ale také převádí suchý, neproduktivní zánět v dýchacích cestách, projevující se většinou suchým, dráždivým kašlem, na zánět s vlhkými fenomény tím, že podporuje sekreci bronchiálních žláz. Tento účinek je způsoben jednak přímým působením farmaka na žlázy epitelu v bronchiální stěně, ale i nepřímou – reflexní cestou, kdy se podrážděním sliznice žaludku po p.o. podání zvyšuje tonus parasympatiku, což má za následek zvýšení sekrece hlenu v dýchacích cestách. Zvýšená sekrece hlenu vede k aktivaci řasinkového epitelu a tím i k usnadnění transportu hlenu a jeho vykašlávání.

Druhá účinná látka přípravku – butamirát – tlumí kašel, ale na rozdíl např. od dextrometorfanu (kodeinové antitusikum) jej tlumí především periferně a jeho centrální

působení je výrazně slabší než u dextrometorfanu. Kašel je tlumen v kašlových zónách blokadou receptorů, které jsou uloženy těsně pod výstelkou dýchacích cest. Při počáteční suché fázi zánětu, kdy dyskrinická výstelka není na mnohých místech vůbec kryta ochranným hlenovým filmem, jsou receptory vystaveny prakticky jakémukoli podprahovému dráždění (včetně dráždění působků zánětu). Tím se lehce aktivuje základní kašlový reflex iniciální fáze zánětu, navíc tento práh dráždivosti receptorů se dále snižuje. V těchto počátečních fázích nastupuje právě účinek butamirátu periferním tlumením kašlového reflexu. Toto tlumení zdaleka nemá intenzitu centrálního útlumu kašlového reflexu a není spojeno s útlumem respiračního centra a následnou hypoventilací. Po zvýraznění průduškové sekrece, na kterém se podílí také guaifenesin, a poklesu zánětlivé aktivity dochází nejen k zaplnění slizničních hlenových defektů a tím ke snížení možné přímé stimulace kašlových receptorů, ale také ke zvýšení prahu dráždění.

Klinické studie

Terapeutický účinek přípravku byl ověřen rozsáhlou postregistrační multicentrickou klinickou studií (n = 4 326), provedenou v letech 1985 až 1986. Ve studii nebyla ani v jednom případě zaznamenána nedostatečná hlenová očista cest dýchacích s nutností přístrojové či jiné mobilizace sekretu z distálních částí průduškového stromu.

Účinnost kombinace butamirátu citrátového a guaifenesinu byla rovněž klinicky ověřena ve srovnávací, otevřené, randomizované multicentrické studii. Studie byla provedena na 45 pracovištích v průběhu roku 2001. Do klinického hodnocení bylo zapojeno celkem 1032 pacientů ve věku od 6 měsíců do 90 let se suchým, dráždivým a obtížně ztižitelným kašlem při akutních infekcích horních a/nebo dolních dýchacích cest. Z celkového počtu 1032 pacientů zařazených do studie byl přípravek Stoptussin kapky podáván 412 pacientům (166 mužského pohlaví, 146 ženského pohlaví), z toho bylo 212 dětí a 200 dospělých. Všichni pacienti přípravek užívali podle doporučeného dávkovacího schématu, vycházejícího z tělesné hmotnosti, po dobu 7 dnů. Souběžné podávání jiných léčiv ze skupiny antitusik a expektorancií nebylo ve studii povoleno. Před zahájením léčby a po jejím ukončení byla provedena klinická vyšetření za účelem zjištění stavu onemocnění dýchacích cest a pacientům byla odebrána krev na základní hematologická a biochemická vyšetření. Účinnost

přípravku byla posuzována podle změn frekvence kašle, intenzity kašle a expektorace po léčbě. Hodnocení těchto parametrů účinnosti bylo provedeno subjektivně pacienty na základě předem definovaných stupnic.

Převážná většina pacientů (asi 90 %) udávala snížení frekvence a intenzity kašle po léčbě přípravkem Stoptussin kapky. Méně byla ovlivněna expektorace, ale zlepšení tohoto parametru účinnosti bylo zaznamenáno u statisticky signifikantního počtu pacientů. Výsledky provedené studie potvrdily, že přípravek Stoptussin je velmi dobré antitusikum s expektoračním účinkem, vhodné pro terapii suchého neproduktivního kašle u zánětlivých onemocnění dýchacích cest.

Farmakokinetické vlastnosti

Butamirát dihydrogencitrát se po perorálním podání rychle a plně absorbuje. Je metabolizován na dva metabolity, které oba mají antitusický účinek a jsou vylučovány z více než 90 % renální cestou, pouze malá část se vylučuje stolicí. Metabolity se nevylučují do mateřského mléka. Biologický poločas eliminace je přibližně 6 hodin. Butamirát se až z 98 % váže na plazmatické bílkoviny.

Guaifenesin se po perorální aplikaci rychle a snadno absorbuje z gastrointestinálního traktu. Je rychle metabolizován a jeho inaktivní metabolity se vylučují močí. Biologický poločas eliminace guaifenesinu je přibližně 1 hodina. Na bílkoviny krevní plazmy se váže pouze velmi málo.

Indikace

Suchý, dráždivý, obtížně ztišitelný kašel při virových infekcích horních a dolních dýchacích cest, při katarálních infektech horních dýchacích cest, při zánětu hltanu, hrtanu, průdušek, plic; k utišení kašle před operací a po operaci, při astmatu, při tuberkulóze a zaprášení plic.

Nežádoucí účinky, kontraindikace a interakce

Při doporučeném dávkování je přípravek obvykle dobře snášen. Guaifenesin velmi vzácně může vyvolat nauzeu, zvracení, průjem, žaludeční bolesti, závratě a bolesti hlavy, urtikarii a kožní vyrážky.

Po podávání butamirátu se mohou ojediněle objevit nechutenství či gastrointestinální obtíže.

Stoptussin nesmí být používán při přecitlivělosti na některou složku přípravku a při myasthenia gravis, neměl by být užíván v prvních třech měsících těhotenství.

Účinek guaifenesinu je potencován působením lithia a magnézia. Guaifenesin zvyšuje analgetický účinek paracetamolu a kyseliny acetylsalicylové; potencuje tlumivý účinek alkoholu, sedativ, hypnotik a celkových anestetik na CNS a rovněž účinek myorelaxancií.

Dávkování a způsob podání

Dávkuje se podle hmotnosti pacienta:

- do 7 kg 3–4x denně 8 kapek;
- 7–12 kg 3–4x denně 9 kapek;
- 12–20 kg 3x denně 14 kapek;
- 20–30 kg 3–4x denně 14 kapek;
- 30–40 kg 3–4x denně 16 kapek;
- 40–50 kg 3x denně 25 kapek;
- 50–70 kg 3x denně 30 kapek;
- od 70 kg 3x denně 40 kapek.

Přípravek je vhodné podávat po jídle; příslušný počet kapek se odměří přibližně do 100 ml tekutiny (voda, čaj, ovocná šťáva apod.). Přípravek obsahuje alkohol.

Maximální denní dávka guaifenesinu je pro děti do 2 let 300 mg/den (102 kapek), pro děti od 2 do 6 let 600 mg/den (204 kapek), od 6 do 12 let 1 200 mg/den a pro dospělé a děti od 12 let 2 400 mg/den.

POZNÁMKA

Statut přípravku:

léčivý přípravek, není vázán na lékařský předpis.

Úhrada z prostředků veřejného zdravotního pojištění: viz Číselník VZP.

Profil přípravku zpracován kolektivem autorů vedeným profesorem MUDr. Janem Švihovcem, DrSc., s využitím odborné literatury a SPC.

KNIHY NAKLADATELSTVÍ GALÉN



Základní a aplikovaná farmakologie Dagmar Lincová, Hassan Farghali et al.

Počet stran 672

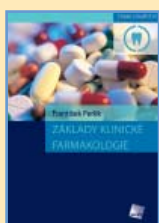
EAN 9788072623730

Cena 1 600 Kč

Zvýhodněná cena 1 440 Kč

Druhé vydání celostátní učebnice farmakologie, která poprvé vyšla v roce 2002 a její dotisk o tři roky později. Některé kapitoly jsou zcela nové (např. kapitola o apoptóze, erektilní dysfunkci, léčivech v očním lékařství a použití léků u speciálních skupin nemocných – tj. v těhotenství, při kojení, u dětí a ve stáří), některé jsou v souladu s novými poznatky zcela nově zpracovány (např. farmakodynamika, celková anesteti-

ka, léky používané u nemocí GIT a léková závislost). Doplněna byla kapitola vysvětlující základní pojmy ve farmakologii. Všechny kapitoly jsou aktualizovány a doplněny o nové lékové skupiny a léky. V závěru knihy jsou zařazeny i dvě nové modelové klinické studie. Ve druhém vydání je obrazová dokumentace výrazně rozšířena a velmi podrobně je zpracován i rejstřík, obsahující více než 5000 pojmů.



Základy klinické farmakologie František Perlík

Počet stran 192

EAN 9788072625284

Cena 350 Kč

Úvodní část knihy shrnuje základy klinické farmakologie, použitelné v běžné terapeutické praxi. Text speciální části předkládá nejdůležitější poznatky o skupinách léčiv používaných u onemocnění jednotlivých orgánů. Snaha o využití publikace také ve stomatologii vedla k zařazení poznámek pro stomatologickou praxi a dále oddílů zahrnujícího zvláště významná témata obo-

ru, která jsou zaměřena nejenom na léčení stomatologických nemocných, ale i na ošetřování pacientů s komplikovaným zdravotním stavem i na neodkladné situace v zubním lékařství. Cílem publikace je usnadnit lékařům v praxi i studentům magisterských a bakalářských programů získání základních poznatků z klinické a speciální farmakologie.