Форадил



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Формотерол

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Капсулы с порошком для ингаляций прозрачные бесцветные, размер №3, с маркировкой "CG" на крышечке и "FXF" на корпусе или "CG" на корпусе и "FXF" на крышечке черными чернилами; содержимое капсул - свободно текучий порошок белого цвета.

	1 капс.
формотерола фумарат	12 мкг

Вспомогательные вещества: лактоза - 25 мг.

10 шт. - блистеры (3) в комплекте с устройством для ингаляций (аэролайзером) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (6) в комплекте с устройством для ингаляций (аэролайзером) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Селективный агонист β_2-адренорецепторов. Оказывает бронхорасширяющее действие у пациентов как с обратимой, так и необратимой обструкцией дыхательных путей. Действие препарата наступает быстро (в пределах 1-3 мин) и сохраняется в течение 12 ч после ингаляции. При использовании препарата в терапевтических дозах влияние на сердечно-сосудистую систему минимально и отмечается только в редких случаях.

Форадил тормозит высвобождение гистамина и лейкотриенов из тучных клеток. В экспериментах на животных были показаны некоторые противовоспалительные свойства формотерола, такие как способность препятствовать развитию отека и накоплению клеток воспаления.

В экспериментальных исследованиях на животных in vitro было показано, что рацемический формотерол и его (R,R)- и (S,S)-энантиомеры являются высокоселективными агонистами β_2-рецепторов. (S,S)-энантиомер был в 800-1000 раз менее активен, чем (R,R)-энантиомер и не оказывал негативного воздействия на активность (R,R)-энантиомера в отношении влияния на гладкую мускулатуру трахеи. Не было получено фармакологических доказательств преимущества использования одного из этих двух энантиомеров по сравнению с рацемической смесью.

В исследованиях, проведенных у людей, показано, что Форадил эффективно предотвращает бронхоспазм, вызываемый вдыхаемыми аллергенами, физической нагрузкой, холодным воздухом, гистамином или метахолином. Поскольку бронхорасширяющий эффект Форадила остается выраженным в течение 12 ч после ингаляции, поддерживающая терапия, при которой Форадил назначают 2 раза/сут, позволяет в большинстве случаев обеспечить необходимый контроль бронхоспазма при хронических заболеваниях легких как в течение дня, так и ночью.

У больных хронической обструктивной болезнью легких (ХОБЛ) стабильного течения формотерол, применяемый в виде ингаляций с помощью устройства Аэролайзер в дозах по 12 мкг или 24 мкг 2 раза/сут, вызывает быстрое наступление бронхорасширяющего эффекта, который продолжается в течение минимум 12 ч и сопровождается субъективным улучшением с точки зрения параметров качества жизни.

Фармакокинетика

Терапевтический диапазон доз формотерола составляет от 12 мкг до 24 мкг 2 раза/сут. Данные по фармакокинетике формотерола получены у здоровых добровольцев после ингаляции формотерола в дозах выше рекомендуемого диапазона и у больных ХОБЛ после ингаляции формотерола в терапевтических дозах.

Всасывание

После однократной ингаляции формотерола фумарата в дозе 120 мкг здоровым добровольцам формотерол быстро абсорбировался в плазму, C_{max} формотерола в плазме составляла 266 пмоль/л и достигалась в течение 5 мин после ингаляции. У больных ХОБЛ, получавших формотерол в дозе 12 или 24 мкг 2 раза/сут в течение 12 недель, концентрации формотерола в плазме, измеренные через 10 мин, 2 ч и 6 ч после ингаляции, находились в диапазонах 11.5-25.7 пмоль/л и 23.3-50.3 пмоль соответственно.

В исследованиях, в которых изучали суммарную экскрецию формотерола и его (R,R)- и (S,S)-энантиомеров с мочой было показано, что количество формотерола в системном кровотоке повышается пропорционально величине ингалируемой дозы (12-96 мкг).

После ингаляционного применения формотерола в дозе 12 или 24 мкг 2 раза/сут в течение 12 недель экскреция неизмененного формотерола с мочой у больных с бронхиальной астмой увеличивалась на 63-73%, а у больных ХОБЛ - на 19-38%. Это указывает на некоторую кумуляцию формотерола в плазме после многократных ингаляций. При этом не отмечалось большей кумуляции одного из энантиомеров формотерола по сравнению с другими после повторных ингаляций.

Так же, как это сообщалось и для других лекарственных средств, применяемых в виде ингаляций, большая часть формотерола, применяемого с помощью ингалятора, будет проглатываться и затем всасываться из ЖКТ. При назначении 80 мкг ^{3}H-меченого формотерола внутрь двум здоровым добровольцам абсорбировалось по меньшей мере 65% формотерола.

Распределение

Связывание формотерола с белками плазмы составляет 61-64% (в первую очередь, связывание осуществляется с альбумином - 34%).

В диапазоне концентраций, отмечаемых после применения препарата в терапевтических дозах, насыщение мест связывания не достигается.

Метаболизм

Основным путем метаболизма формотерола является прямая глюкуронизация. Другой путь метаболизма - о-деметилирование с последующей глюкуронизацией.

Малозначимые пути метаболизма включают конъюгацию формотерола с сульфатом с последующим деформилированием. Множество изоферментов участвуют в процессе глюкуронизации (UGT1A1, 1A3, 1A6, 1A7, 1A8, 1A9, 1A10, 2B7 и 2B15) и 0-деметилирования (CYP2D6, 2C19, 2C9, 2A6) формотерола, что предполагает низкую вероятность лекарственного взаимодействия посредством ингибирования какого-либо изофермента, принимающего участие в метаболизме формотерола. В терапевтических концентрациях формотерол не ингибирует изоферменты системы цитохрома P450.

Выведение

У больных бронхиальной астмой и ХОБЛ, получавших формотерола фумарат в дозе 12 или 24 мкг 2 раза в сутки в течение 12 недель, приблизительно 10% или 7% соответственно определялось в моче в виде неизмененного формотерола. Рассчитанные доли (R,R)- и (S,S)-энантиомеров неизмененного формотерола в моче составляют 40% и 60% соответственно после однократной дозы формотерола (12-120 мкг) у здоровых добровольцев и после однократных и повторных доз формотерола у больных бронхиальной астмой.

Активное вещество и его метаболиты полностью выводятся из организма; около 2/3 от применяемой внутрь дозы выводится с мочой, с 1/3 - с калом. Почечный клиренс формотерола составляет 150 мл/мин.

У здоровых добровольцев конечный $T_{1/2}$ формотерола из плазмы после однократной ингаляции в дозе 120 мкг составляет 10 ч; конечные $T_{1/2}$ (R,R)- и (S,S)-энантиомеров, рассчитанные по экскреции с мочой, составляли 13.9 и 12.3 соответственно.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

После коррекции по массе тела фармакокинетические параметры формотерола у мужчин и у женщин не имеют существенных различий.

Фармакокинетика формотерола у пожилых пациентов не изучалась.

В клиническом исследовании у детей в возрасте 5-12 лет с бронхиальной астмой, получавших формотерола фумарат в дозе 12 или 24 мкг 2 раза /сут в течение 12 недель, экскреция неизмененного формотерола с мочой увеличивалась на 18-84% по сравнению с соответствующим показателем, измеренным после первой дозы.

В клинических исследованиях у детей в моче определялось около 6% неизмененного формотерола.

Фармакокинетика формотерола у пациентов с нарушениями функции печени и/или почек не изучалась.

Показания к применению:

— профилактика и лечение бронхоспазма у больных с бронхиальной астмой;

— профилактика бронхоспазма, вызванного вдыхаемыми аллергенами, холодным воздухом или физической нагрузкой;

— профилактика и лечение нарушений бронхиальной проходимости у больных с хронической обструктивной болезнью легких (ХОБЛ), при наличии как обратимой, так и необратимой бронхиальной обструкции, хроническим бронхитом и эмфиземой легких.

Относится к болезням:

- Аллергия
- Бронхит
- Бронхоспазм

Противопоказания:

— детский возраст до 5 лет;

— период лактации (грудного вскармливания);

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

Способ применения и дозы:

Форадил предназначен для ингаляционного применения у взрослых и детей в возрасте 5 лет и старше. Препарат представляет собой порошок для ингаляций, применяемый с помощью специального устройства - Аэролайзера, который входит в комплект упаковки.

Для **взрослых** при *бронхиальной астме* доза препарата для регулярной поддерживающей терапии составляет 12-24 мкг (содержимое 1-2 капсул) 2 раза/сут. В случае необходимости дополнительно можно применить 12-24 мкг/сут. Если потребность в применении дополнительных доз препарата перестает быть эпизодической (например, становится чаще чем 2 дня в неделю), следует рекомендовать пациенту проконсультироваться с врачом на предмет пересмотра лечения, т.к. это может указывать на ухудшение течения основного заболевания.

С целью профилактики бронхоспазма, вызываемого физической нагрузкой или неизбежным воздействием известного аллергена, за 15 мин до предполагаемого контакта с аллергеном или до нагрузки следует ингалировать содержимое 1 капсулы (12 мкг). Больным бронхиальной астмой тяжелого течения может потребоваться разовая доза 24 мкг.

При *хронической обструктивной болезни легких* доза препарата для регулярной поддерживающей терапии составляет 12-24 мкг (содержимое 1-2 капсул) 2 раза/сут.

Для **детей в возрасте 5 лет и старше** при *бронхиальной астме* доза препарата для регулярной поддерживающей терапии составляет 12 мкг 2 раза/сут. В случае необходимости дополнительно можно применить 12-24 мкг/сут. Если потребность в применении дополнительных доз препарата перестает быть эпизодической (например, становится чаще чем 2 дня в неделю), следует рекомендовать пациенту проконсультироваться с врачом на предмет пересмотра лечения, т.к. это может указывать на ухудшение течения основного заболевания.

С целью профилактики бронхоспазма, вызываемого физической нагрузкой или неизбежным воздействием известного аллергена, за 15 мин до предполагаемого контакта с аллергеном или до нагрузки следует ингалировать содержимое 1 капсулы (12 мкг).

Правила проведения ингаляций

Для того, чтобы обеспечить правильное применение препарата, пациент должен быть проинструктирован врачом или другим медицинским работником о правилах проведения ингаляции. Следует показать пациенту, как пользоваться ингалятором; объяснить пациенту, что применять капсулы с порошком для ингаляций следует только с помощью Аэролайзера; предупредить пациента, что капсулы предназначены только для ингаляционного применения и не предназначены для проглатывания.

Важно, чтобы пациент понял, что из-за разрушения желатиновой капсулы маленькие кусочки желатина в результате ингаляции могут попасть в рот или горло. Для того, чтобы свести данное явление к минимуму, не следует прокалывать капсулу более 1 раза.

Вынимать капсулу из блистерной упаковки следует непосредственно перед применением.

Инструкция по применению Аэролайзера

1. Снять колпачок с Аэролайзера.

2. Крепко держать Аэролайзер за основание и повернуть мундштук в направлении стрелки.

3. Поместить капсулу в ячейку, находящуюся в основании Аэролайзера (она имеет форму капсулы). Следует помнить, что вынимать капсулу из блистерной упаковки нужно непосредственно перед проведением ингаляции.

4. Повернув мундштук, закрыть Аэролайзер.

5. Держа Аэролайзер в строго вертикальном положении, один раз надавить до конца на голубые кнопки, имеющиеся по бокам Аэролайзера. Затем отпустить их.

На данном этапе при прокалывании капсулы она может разрушиться, вследствие чего маленькие кусочки желатина могут попасть в рот или горло. Поскольку желатин съедобен, это не причиняет никакого вреда. Для того, чтобы капсула не разрушалась полностью, следует выполнять следующие требования: не прокалывать капсулу более одного раза; соблюдать правила хранения; вынимать капсулу из блистера только непосредственно перед проведением ингаляции.

6. Сделать полный выдох.

7. Взять мундштук в рот и слегка откинуть голову назад. Плотно обхватить мундштук губами и сделать быстрый, равномерный, максимально глубокий вдох. При этом пациент должен услышать характерный дребезжащий звук, создаваемый вращением капсулы и распылением порошка. Если характерного звука не было, то надо открыть Аэролайзер и посмотреть, что произошло с капсулой. Возможно, она застряла в ячейке. В этом случае нужно аккуратно извлечь капсулу. Ни в коем случае не пытаться высвободить капсулу путем повторных нажатий на кнопки по бокам Аэролайзера.

8. Если при вдыхании слышен характерный звук, следует задержать дыхание как можно дольше. В это же время вынуть изо рта мундштук. Затем сделать выдох. Открыть Аэролайзер и посмотреть, не остался ли в капсуле порошок. Если в капсуле остался порошок, проделать повторно действия, описанные в пунктах 6-8.

9. После окончания процедуры ингаляции открыть Аэролайзер, вынуть пустую капсулу, закрыть мундштук и закрыть Аэролайзер колпачком.

Для удаления остатков порошка следует протереть мундштук и ячейку сухой тканью. Можно также пользоваться мягкой кисточкой.

Побочное действие:

Нежелательные реакции распределены в соответствии с частотой возникновения. Для оценки частоты использованы следующие критерии: очень часто (≥10%); часто (≥1%, <10%), иногда (≥0.1%, <1%), редко (≥0.01%, <0.1%); очень редко (<0.01%), включая отдельные сообщения.

Аллергические реакции: очень редко - реакции повышенной чувствительности, такие как артериальная гипотензия, крапивница, ангионевротический отек, зуд, экзантема.

Со стороны ЦНС: часто - головная боль, тремор; иногда - ажитация, чувство тревоги, нервозность, бессонница, головокружение.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - ощущение сердцебиения; иногда - тахикардия; очень редко - периферические отеки.

Со стороны дыхательной системы: иногда - бронхоспазм.

Со стороны пищеварительной системы: очень редко - тошнота; искажение вкусовых ощущений.

Со стороны костно-мышечной системы: иногда - судороги в мышцах, миалгии.

Местные реакции: иногда - раздражение слизистой оболочки глотки и гортани.

Передозировка:

Симптомы: передозировка Форадила предположительно может привести к явлениям, характерным для избыточного действия других бета$_2$-адреномиметиков, таким как тошнота, рвота, головная боль, тремор, сонливость, сердцебиение, тахикардия, желудочковые аритмии, метаболический ацидоз, гипокалиемия, гипергликемия.

Лечение: показано проведение поддерживающей и симптоматической терапии. В серьезных случаях необходима госпитализация.

Может рассматриваться применение бета-адреноблокаторов, но только при условии соблюдения чрезвычайной осторожности и под тщательным медицинским контролем, т.к. использование таких средств может вызвать бронхоспазм.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Безопасность применения Форадила при беременности и в период лактации до настоящего времени не установлена.

Применение препарата при беременности возможно только в том случае, если предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода. Формотерол, также как и другие бета$_2$-адреномиметики, может замедлять процесс родов вследствие токолитического действия (релаксирующего действия на гладкую мускулатуру матки).

Неизвестно, выделяется ли формотерол с грудным молоком у человека. Во время приема Форадила грудное вскармливание следует прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Форадил (как и другие бета$_2$-адреностимуляторы) следует с осторожностью назначать пациентам, получающим такие лекарственные средства, как хинидин, дизопирамид, прокаинамид, фенотиазины, антигистаминные препараты, ингибиторы МАО, трициклические антидепрессанты, а также другие препараты, о которых известно, что они удлиняют интервал QT, т.к. в этих случаях действие адреностимуляторов на сердечно-сосудистую систему может усиливаться. При применении препаратов, способных удлинять интервал QT, повышается риск возникновения желудочковых аритмий.

Одновременное применение других симпатомиметических средств может приводить к усугублению побочных эффектов Форадила.

Одновременное применение производных ксантина, ГКС или диуретиков может усиливать потенциальное гипокалиемическое действие бета$_2$-адреномиметиков. Гипокалиемия может увеличить предрасположенность к развитию сердечных аритмий у пациентов, получающих препараты наперстянки.

Бета-адреноблокаторы могут ослаблять действие Форадила. В связи с этим не следует применять Форадил совместно с бета-адреноблокаторами (включая глазные капли), если только к использованию такой комбинации препаратов не вынуждают какие-либо чрезвычайные причины.

Особые указания и меры предосторожности:

Соблюдение особой осторожности при применении Форадила (особенно с точки зрения снижения дозы) и тщательное наблюдение за пациентами требуются при наличии следующих сопутствующих заболеваний: ИБС; нарушения сердечного ритма и проводимости, особенно AV-блокада III степени; тяжелая сердечная недостаточность;

идиопатический подклапанный аортальный стеноз; гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия; тиреотоксикоз; известное или подозреваемое удлинение интервала QT_c (QT скорригированный) >0.44 сек.

По причине гипергликемического эффекта, свойственного бета$_2$-адреномиметикам, у больных сахарным диабетом рекомендуется дополнительный регулярный контроль уровня глюкозы в крови.

Обычно пациенты с бронхиальной астмой, которым требуется терапия бета$_2$-адреномиметиками, должны также регулярно получать адекватные дозы противовоспалительных средств (например, ГКС для ингаляционного введения или для приема внутрь, и/или у детей - кромогликат натрия). При назначении препарата пациентам, не получающим противовоспалительную терапию, ее следует начинать одновременно с применением Форадила. При назначении Форадила необходимо оценить состояние пациентов в отношении адекватности той противовоспалительной терапии, которую они получают. После начала лечения Форадилом пациентам следует рекомендовать продолжать противовоспалительную терапию без изменений, даже в том случае, если будет отмечено улучшение.

Необходим пересмотр врачом базовой терапии бронхиальной астмы в том случае, если на фоне применения Форадила сохраняются симптомы астмы, или если количество доз Форадила, требуемое для контроля симптомов заболевания, увеличивается, поскольку это обычно свидетельствует об ухудшении течения заболевания.

Следствием терапии бета$_2$-адреномиметиками может быть развитие потенциально серьезной гипокалиемии. Т.к. данное действие препарата может быть усилено гипоксией и сопутствующим лечением, особую осторожность следует соблюдать у больных бронхиальной астмой тяжелого течения. В этих случаях рекомендуется регулярный контроль уровня калия в сыворотке крови.

Также как и при проведении другой ингаляционной терапии, следует учитывать возможность развития парадоксального бронхоспазма. Если он возникает, следует немедленно отменить препарат и назначить альтернативное лечение.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Пациентам, у которых на фоне применения Форадила возникает головокружение или другие нарушения со стороны ЦНС, следует воздержаться от вождения автомашины или управления механизмами в период применения препарата.

Применение в детском возрасте

Противопоказано: детский возраст до 5 лет.

Для **детей в возрасте 5 лет и старше** при *бронхиальной астме* доза препарата для регулярной поддерживающей терапии составляет 12 мкг 2 раза/сут. В случае необходимости дополнительно можно применить 12-24 мкг/сут. Если потребность в применении дополнительных доз препарата перестает быть эпизодической (например, становится чаще чем 2 дня в неделю), следует рекомендовать пациенту проконсультироваться с врачом на предмет пересмотра лечения, т.к. это может указывать на ухудшение течения основного заболевания.

Условия хранения:

Препарат следует предохранять от воздействия влаги. Хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°C.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Foradil