Формисонид-натив



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Будесонид
- Формотерол

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[мнн] [мнн] Википедия[мнн] [мнн] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru

Форма выпуска:

Форма выпуска, описание и состав

Порошок для ингаляций в капсулах твердых №3, зеленых, прозрачных; содержимое капсул- порошок белого или почти белого цвета.

	1 капс.
будесонид	320 мкг
формотерола фумарата дигидрат	9 мкг

Вспомогательные вещества: натрия бензоат - 0.02 мг, лактозы моногидрат - до 12 мг.

Состав оболочки капсулы: краситель хлорофиллин-медь - 0.2%, гипромеллоза - до 100%.

10 шт. - упаковки контурные ячейковые (3) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки контурные ячейковые (6) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки контурные ячейковые (12) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Комбинированное бронходилатирующее средство. Будесонид и формотерол обладают разными механизмами действия и проявляют аддитивный эффект в отношении снижения частоты обострений бронхиальной астмы и ХОБЛ.

Особые свойства будесонида и формотерола дают возможность использовать их комбинацию одновременно в качестве поддерживающей терапии и для купирования приступов, или как поддерживающую терапию бронхиальной астмы.

Будесонид - ГКС, который после ингаляции оказывает быстрое (в течение нескольких часов) и дозозависимое противовоспалительное действие на дыхательные пути, снижая выраженность симптомов и частоту обострений бронхиальной астмы. При назначении ингаляционного будесонида отмечается меньшая частота возникновения серьезных нежелательных эффектов, чем при использовании системных ГКС. Уменьшает выраженность отека слизистой бронхов, продукцию слизи, образование мокроты и гиперреактивность дыхательных путей. Точный механизм противовоспалительного действия ГКС неизвестен.

Формотерол - селективный агонист β_2-адренорецепторов, который после ингаляции вызывает быстрое и длительное расслабление гладкой мускулатуры бронхов у пациентов с обратимой обструкцией дыхательных путей. Бронхолитическое дозозависимое действие наступает быстро, в течение 1-3 мин после ингаляции и сохраняется в течение как минимум 12 ч после приема разовой дозы.

Добавление формотерола к будесониду уменьшает выраженность симптомов бронхиальной астмы, улучшает функцию бронхов и уменьшает частоту обострений заболевания. Действие данной фиксированной комбинации на функцию бронхов соответствует действию комбинации монопрепаратов будесонида и формотерола и превышает действие одного будесонида. Во всех случаях для купирования приступов использовался бета$_2$-адреностимулятор короткого действия. Не отмечалось снижения противоастматического действия с течением времени. Комбинация характеризуется хорошей переносимостью.

Фармакокинетика

Отсутствуют доказательства фармакокинетического взаимодействия будесонида и формотерола.

Фармакокинетические показатели для соответствующих веществ сравнимы после назначения будесонида и формотерола в виде монопрепаратов и в составе данной комбинации. При введении в составе комбинации AUC будесонида несколько больше, всасывание происходит быстрее и величина C_{max} в плазме крови выше. C_{max} в плазме крови формотерола при введении в составе комбинации совпадает с таковой для монопрепарата.

Ингалируемый будесонид быстро абсорбируется и достигает C_{max} в плазме через 30 мин после проведения ингаляции. Средняя доза будесонида, попавшего в легкие после проведения ингаляции, составляет 32-44% от доставленной дозы. Системная биодоступность составляет примерно 49% от доставленной дозы.

Ингалируемый формотерол быстро абсорбируется и достигает C_{max} в плазме крови через 10 минут после проведения ингаляции. Средняя доза формотерола, попавшего в легкие после проведения ингаляции, составляет 28-49% от доставленной дозы. Системная биодоступность составляет около 61% от доставленной дозы.

Связывание с белками плазмы формотерола составляет 50%, будесонида - 90%. V_d формотерола составляет около 4 л/кг, будесонида - 3 л/кг.

Формотерол инактивируется путем конъюгации (образуются активные О-деметилированные метаболиты, в основном, в виде инактивированных конъюгатов). Будесонид подвергается интенсивной биотрансформации (около 90%) при "первом прохождении" через печень с образованием метаболитов, обладающих низкой глюкокортикоидной активностью. Глюкокортикоидная активность основных метаболитов 6-β-гидроксибудесонида и 16-α-гидроксипреднизолона не превышает 1% аналогичной активности будесонида. Не существует доказательств взаимодействия метаболитов или реакции замещения между будесонидом и формотеролом.

Основная часть дозы формотерола подвергается метаболизму в печени и затем выводится почками. После ингаляции 8-13% доставленной дозы формотерола выводится в неизмененном виде с мочой. Формотерол имеет высокий системный клиренс (примерно 1.4 л/мин); $T_{1/2}$ препарата составляет в среднем 17 ч.

Будесонид метаболизируется преимущественно с участием фермента CYP3A4. Метаболиты будесонида выводятся с мочой в неизмененном виде или в виде конъюгатов. В моче обнаруживается только незначительное количество неизмененного будесонида. Будесонид имеет высокий системный клиренс (примерно 1.2 л/мин).

Показания к применению:

Бронхиальная астма, недостаточно контролируемая приемом ингаляционных ГКС и бета$_2$-адреностимуляторов короткого действия или адекватно контролируемая ингаляционными ГКС и бета$_2$-адреностимуляторами длительного действия.

Симптоматическая терапия пациентов с тяжелой ХОБЛ (ОФВ1 <50% от предполагаемого расчетного уровня) и с повторяющимися обострениями в анамнезе, которые имеют выраженные симптомы заболевания, несмотря на терапию бронходилататорами длительного действия.

Относится к болезням:

- Астма
- Бронхит

Противопоказания:

Детский и подростковый возраст до 18 лет; повышенная чувствительность к будесониду, формотеролу или ингалируемой лактозе.

С осторожностью

Туберкулез легких (активная или неактивная форма), грибковые, вирусные или бактериальные инфекции органов дыхания, тиреотоксикоз, феохромоцитома, сахарный диабет, неконтролируемая гипокалиемия, идиопатический гипертрофический субаортальный стеноз, тяжелая артериальная гипертензия, аневризма любой локализации или другие тяжелые сердечно-сосудистые заболевания (ИБС, тахиаритмия или сердечная недостаточность тяжелой степени), удлинение интервала QT.

Способ применения и дозы:

Дозу и частоту применения устанавливают индивидуально, в зависимости от показаний, клинической ситуации, возраста пациента, применяемой лекарственной формы.

Побочное действие:

Со стороны нервной системы: часто (>1/100, <1/10) - головная боль; менее часто (>1/1000, <1/100) - психомоторное возбуждение, беспокойство, тошнота, головокружение, нарушения сна; очень редко (<1/10 000) - депрессия, нарушения поведения (главным образом, у детей), нарушения вкуса.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто (>1/100, <1/10) - ощущение сердцебиения; менее часто (>1/1000, <1/100) - тахикардия; редко (>1/10 000, <1/1000) - фибрилляция предсердий, суправентрикулярная тахикардия, экстрасистолия; очень редко (<1/10 000) - стенокардия, колебания АД.

Со стороны костно-мышечной системы: часто (>1/100, <1/10) - тремор; менее часто (>1/1000, <1/100) - мышечные судороги.

Со стороны дыхательной системы: часто (>1/100, <1/10) - кандидоз слизистой оболочки полости рта и глотки, легкое раздражение в горле, кашель, хрипота; редко (>1/10 000, <1/1000) - бронхоспазм.

Дерматологические реакции: менее часто (>1/1000, <1/100) - кровоподтеки; редко (>1/10 000, <1/1000) - экзантема, зуд, дерматиты.

Аллергические реакции: редко (>1/10 000, <1/1000) - крапивница, ангионевротический отек, анафилактические реакции.

Метаболические нарушения: редко (>1/10 000, <1/1000) - гипокалиемия; очень редко (<1/10 000) - гипергликемия, симптомы системного действия ГКС (включая гипофункцию надпочечников).

Системное действие ингаляционных ГКС может наблюдаться при приеме препарата в высоких дозах в течение продолжительного времени.

Применение бета$_2$-адреномиметиков может приводить к увеличению содержания в крови инсулина, свободных жирных кислот, глицерола, кетоновых производных.

Применение при беременности и кормлении грудью:

При беременности комбинацию будесонид/формотерол следует использовать только в тех случаях, когда ожидаемая польза терапии для матери превышает потенциальный риск для плода. Будесонид следует применять в минимальной эффективной дозе, необходимой для поддержания адекватного контроля симптомов бронхиальной астмы.

Ингалируемый будесонид выделяется с грудным молоком, однако при применении в терапевтических дозах воздействия на ребенка не отмечено. Неизвестно, выделяется ли формотерол с грудным молоком у женщин. Комбинацию будесонид/формотерол можно назначать кормящим женщинам, только если ожидаемая польза для матери превышает любой возможный риск для ребенка.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Прием кетоконазола в дозе 200 мг 1 раз/сут повышает концентрацию в плазме будесонида при пероральном применении (разовая доза 3 мг) при их совместном назначении, в среднем, в 6 раз. При назначении кетоконазола через 12 ч после приема будесонида концентрация в плазме последнего повышалась, в среднем, в 3 раза. Информация о подобном взаимодействии с будесонидом при его ингаляционном применении отсутствует, однако следует ожидать заметного повышения концентрации препарата в плазме крови. Т.к. данные для рекомендаций по подбору дозы отсутствуют, следует избегать вышеуказанной комбинации препаратов. Если это возможно, временные интервалы между назначением кетоконазола и будесонида следует максимально увеличить. Также следует рассмотреть возможность снижения дозы будесонида. Другие мощные ингибиторы CYP3A4, вероятно, также могут значительно повышать концентрацию будесонида в плазме.

Блокаторы β_2-адренорецепторов способны уменьшать интенсивность действия формотерола. Комбинацию формотерол + будесонид не следует назначать одновременно с бета-адреноблокаторами (включая глазные капли), за исключением вынужденных случаев.

Совместное назначение комбинации формотерол+будесонид и хинидина, дизопирамида, прокаинамида, фенотиазинов, антигистаминных препаратов (терфенадина), ингибиторов МАО, трициклических антидепрессантов может удлинять интервал QT и увеличивать риск возникновения желудочковых аритмий.

Кроме того, леводопа, левотироксин, окситоцин и алкоголь могут снижать толерантность сердечной мышцы к бета$_2$-адреномиметикам.

Одновременное применение ингибиторов МАО, а также препаратов, обладающих подобными свойствами, таких как фуразолидон и прокарбазин, может вызвать повышение АД. Существует повышенный риск развития аритмий у пациентов при проведении общей анестезии препаратами галогенизированных углеводородов.

При одновременном применении комбинации будесонид/формотерол и других бета-адренергических лекарственных препаратов возможно усиление побочного действия формотерола. В результате применения бета$_2$-адреномиметиков возможно развитие гипокалиемии, которая может усиливаться при сопутствующем лечении производными ксантина, ГКС или диуретиками. Гипокалиемия может усиливать предрасположенность к развитию аритмий у пациентов, принимающих сердечные гликозиды.

Особые указания и меры предосторожности:

Диагнозы

- Астматический статус
- Бронхит
- Кашель
- Муковисцидоз

Источник: http://drugs.thead.ru/Formisonid-nativ