Фостер



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Аэрозоль для ингаляций дозированный	**1 доза**
беклометазона дипропионат	100 мкг
формотерола фумарат	6 мкг

120 доз - баллоны аэрозольные алюминиевые (1) - пачки картонные.
180 доз - баллоны аэрозольные алюминиевые (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Фостер содержит беклометазон дипропионат и формотерол, имеющие различные механизмы действия и проявляющие аддитивный эффект в отношении снижения частоты обострений бронхиальной астмы.

Беклометазона дипропионат - ингаляционный ГКС, в рекомендуемых дозах оказывает противовоспалительное действие, уменьшает выраженность симптомов бронхиальной астмы и уменьшает частоту обострений заболевания, при этом имеет меньшую частоту побочных эффектов, чем системные ГКС.

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

Добавление формотерола к беклометазону дипропионату уменьшает выраженность симптомов бронхиальной астмы, улучшает показатели функции внешнего дыхания (ФВД) и уменьшает частоту обострений заболевания.

В ходе клинического исследования было показано, что влияние на ФВД фиксированной комбинации Фостер соответствует таковому комбинации монопрепаратов беклометазона дипропионата и формотерола и превышает действие одного беклометазона дипропионата.

Фармакокинетика

Фармакокинетические показатели для соответствующих лекарственных средств были сравнимы после назначения беклометазона дипропионата (БДП) и формотерола в виде монопрепаратов и в составе комбинированного препарата.

Для беклометазона дипропионата при введении в составе комбинированного препарата AUC для его активного метаболита беклометазон-17-монопропионата и величина C_{max} в плазме несколько ниже, а всасывание происходит быстрее, чем у монопрепарата беклометазона дипропионата.

Для формотерола при введении в составе комбинированного препарата C_{max} в плазме совпадала с таковой для монопрепарата, а системное действие было несколько выше, чем у монопрепарата.

Не получено данных относительно фармакокинетического или фармакодинамического взаимодействия между БДП и формотеролом: БДП под действием эстеразы превращается в активный метаболит беклометазон-17-монопропионат (B-17 MP).

Ингалируемый БДП быстро абсорбируется легкими; его абсорбции предшествует интенсивная конверсия БДП в его активный метаболит беклометазон-17-монопропионата (B-17 MP). Системная биодоступность (B-17 MP) обеспечивается на 36% за счет легких, а также за счет всасывания органами ЖКТ проглоченной части ингаляционной дозы. Биодоступность проглоченного БДП ничтожно мала, однако, предсистемная конверсия БДП в B-17 MP приводит к тому, что 41% БДП усваивается организмом в виде B-17 MP. Наблюдается практически линейное увеличение системного действия при увеличении ингаляционной дозы. Абсолютная биодоступность после ингаляции составляет около 2% и 62% от номинальной дозы по отношению к неизмененному БДП у и B-17 MP, соответственно.

Связывание с белками плазмы достаточно высокое.

Метаболизм

БДП характеризуется очень высоким показателем клиренса из большого круга кровообращения за счет действия эстеразы, присутствующей в большинстве тканей. Основной продукт метаболизма БДП - активный метаболит B-17 MP. Менее активными метаболитами являются беклометазон 21 монопропионат (B-21 MP) и беклометазон (BOH), которые также образуются в результате метаболизма, но их роль в системном воздействии БДП очень незначительна.

Выведение

Основная часть БДП выводится с каловыми массами в виде полярных метаболитов. Почечная экскреция БДП и его метаболитов незначительна. $T_{1/2}$ БДП и B-17 MP составляет 0.5 и 2.7 ч, соответственно.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Печеночная недостаточность не приводит к изменению фармакокинетических свойств и профиля безопасности БДП в связи с тем, что последний подвергается быстрому метаболизму до полярных метаболитов B-21 MP, BOH и B-17 MP под действием энзимов, присутствующих в желудочно-кишечном тракте, плазме крови, легких и печени.

Фармакокинетические свойства БДП у пациентов, страдающих почечной недостаточностью, не изучались. Принимая во внимание, что как БДП, так и его метаболиты с мочой практически не выделяются, нет оснований предполагать усиление системного действия препарата на организм пациентов, страдающих почечной недостаточностью.

Формотерол

Всасывание и распределение

Ингалируемый формотерол абсорбируется в легких и ЖКТ. Часть ингаляционной дозы, которая проглатывается, зависит от типа ингаляционного устройства. и техники ингаляции. Так при использовании мультидозового дозированного ингалятора она может составлять до 90%. Поэтому проглоченную фракцию необходимо учитывать при ингаляционном способе введения препарата.

Не менее 65% пероральной дозы фрмотерола всасывается через ЖКТ, при этом 70% этого объема подвергается пресистемному метаболизму. C_{max} неизмененного формотерола в плазме крови наблюдается в течение 0.5-1 ч после перорального применения. Связь с белками плазмы у формотерола составляет 61-64%, при этом аффинность к альбумину - 34%. В диапазоне терапевтических доз насыщения аффиности не наблюдается. При перроральном приеме $T_{1/2}$ составляет 2-3 ч. При ингаляции 12-96 мкг формотерола фумарата всасывание формотерола носит линейный характер.

Метаболизм

Метаболизм формотерола осуществляется, в частности, за счет прямой конъюгации фенолгидроксильной группы.

Конъюгаты глюкуроновой кислоты не активны. Второй значимый путь метаболизма формотерола - O-диметелирование посредством конъюгации на уровне фенол-2-гидроксильной группы. Цитохром P450 ферментов CYP2D6, CYP2C9, CYP2C19 участвует в O-деметелировании формотерола. Есть основания предполагать, что метаболизм формотерола осуществляется, главным образом, в печени. Формотерол не ингибирует CYP450 ферменты в терапевтически значимых концентрациях.

Выведение

Суммарная почечная экскреция формотерола после ингаляции однократной дозы через дозированный порошковый ингалятор увеличивается линейно в диапазоне доз 12-96 мкг. Показатели экскреции неизмененного и общего формотерола, в среднем, составляют 8% и 25%, соответственно. На основании измерений плазменных концентраций формотерола после его однократной ингаляции в дозе 120 мкг у 12 здоровых добровольцев был определен $T_{1/2}$, который составил 10 ч. Соотношение (R,R)- и (S,S)-энантиомеров неизмененного препарата при ренальной экскреции составляет соответственно, 40% и 60%. Относительное соотношение этих 2 показателей не изменяется в диапазоне исследуемых дозировок; нет свидетельств аккумуляции одного энантиомера относительно другого после приема, повторной дозы.

У здоровых добровольцев после перорального приема (40-80 мкг) 6-10% дозы было обнаружено в моче в виде неизмененного препарата; 8% дозы присутствовало в виде глюкуронидов.

Всего 67% от пероральной дозы формотерола выводится почками (преимущественно в виде метаболитов), остальная часть дозы - через кишечник. Почечный клиренс формотерола составляет 150 мл/мин.

Показания к применению:

Базисная терапия бронхиальной астмы, предусматривающей назначение комбинированной терапии (ингаляционного ГКС и β_2-адреномиметика длительного действия):

— пациенты, симптомы заболевания, которых недостаточно контролируются ингаляционными ГКС и β_2-адреномиметиками короткого действия;

— пациенты, получающие эффективные поддерживающие дозы ингаляционных ГКС и β_2-адреномиметиков длительного действия.

Относится к болезням:

- Бронхит

Противопоказания:

— детский возраст до 12 лет;

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью:* беременность, период лактации, туберкулез легких, грибковые, вирусные или бактериальные инфекции органов дыхания, тиреотоксикоз, феохромоцитома, сахарный диабет, неконтролируемая гипокалиемия, идиопатический гипертрофический субаортальный стеноз, AV-блокада III степени, тяжелая артериальная гипертензия, аневризма любой локализации или другие тяжелые сердечно-сосудистые заболевания (острый инфаркт миокарда, ИБС, тахиаритмия, декомпенсированная хроническая сердечная недостаточность, удлиненный интервал QT_c (прием формотерола может вызвать удлинение интервала QT_c).

Способ применения и дозы:

Фостер не предназначен для первоначального лечения бронхиальной астмы. Подбор дозы препаратов, входящих в состав Фостера, происходит индивидуально и в зависимости от степени тяжести заболевания. Это необходимо учитывать не только при начале лечения комбинированными препаратами, но и при изменении поддерживающей дозы препарата. В том случае, если отдельным пациентам требуется иная комбинация доз активных компонентов, чем в Фостере, следует назначить β_2-адреномиметики и/или ГКС в отдельных ингаляторах.

Для **взрослых и подростков старше 12 лет:** 1-2 ингаляции 2 раза/сут. Пациенты должны находиться под постоянным контролем врача для адекватного подбора дозы Фостера. Дозу следует снизить до наименьшей, на фоне которой сохраняется оптимальный контроль симптомов бронхиальной астмы. При достижении полного контроля над симптомами бронхиальной астмы на фоне минимальной рекомендуемой дозы препарата, на следующем этапе можно попробовать назначение монотерапии ингаляционными ГКС.

Нет необходимости в специальном подборе дозы препарата для **пациентов пожилого возраста**.

Нет данных о приеме Фостера **пациентами с почечной или печеночной недостаточностью**.

Инструкция по применению ингалятора.

Больного необходимо научить правильно использовать ингалятор и периодически проверять технику проведения ингаляции.

Перед первым использованием ингалятора или через 3 дня и более после перерыва в его использовании первую дозу необходимо распылить в воздух, чтобы убедиться, что он работает.

1. Возьмите ингалятор большим и указательным пальцами.

2. Снимите защитный колпачок с мундштука ингалятора.

3. Возьмите мундштук в рот, плотно обхватив его губами, и полностью выдохните через нос.

4. Произведите долгий глубокий вдох, одновременно произведя нажатие на торец баллончика указательным пальцем.

5. После вдоха как можно дольше задержите дыхание. Затем выньте мундштук изо рта и продолжайте нормально дышать.

Для получения второй дозы: держа ингалятор в вертикальном положении, ждут около 30 секунд и затем повторяют этапы с 3 по 5.

После использования плотно закрывают мундштук защитным колпачком.

Выполняя этапы 3 и 4, нельзя торопиться. Следует начинать вдох как можно медленнее, непосредственно перед нажатием на клапан ингалятора.

Если газ частично выходит из верхней части ингалятора или из уголков рта пациента, следует повторить последовательность операций, начиная с этапа 3.

Пациентам со слабыми руками удобнее держать ингалятор двумя руками. Следовательно, верхнюю часть ингалятора нужно удерживать двумя указательными пальцами, а его нижнюю часть — большими пальцами.

После ингаляции рекомендуется прополоскать рот водой.

Для поддержания чистоты мундштука рекомендуется промывать его теплой водой по мере загрязнения.

Нет клинических данных относительно применения Фостера со спейсером; поэтому рекомендуемая дозировка препарата дается с учетом того, что используется ингалятор без спейсера со стандартным активатором.

Следует иметь в виду, что при использовании Фостера со спейсером может возникнуть необходимость в корректировке дозы.

Побочное действие:

Фостер содержит беклометазон дипропионат и формотерол фумарат, и поэтому следует ожидать, что он может вызывать побочные эффекты, характерные для указанных компонентов. Нет данных о том, что их одновременное применение вызывает дополнительные побочные эффекты.

Побочные эффекты, связанные с применением беклометазона дипропионата и формотерола в качестве фиксированной комбинации (Фостер), представлены ниже.

Со стороны ЦНС: часто - головная боль.

Со стороны дыхательной системы: часто - осиплость голоса; менее часто - ринит, дисфония, кашель, легкое раздражение в горле, бронхоспазм.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: менее часто - сердцебиение, удлинение интервала QT, изменение ЭКГ.

Со стороны костно-мышечной системы: тремор, мышечные судороги.

Со стороны системы кроветворения: гранулоцитопения, увеличение количества тромбоцитов.

Со стороны пищеварительной системы: сухость во рту, чувство жжения в губах, дисфагия, диспепсия, диарея.

Со стороны имунной системы: аллергический дерматит; увеличение С-реактивного белка.

Метаболический нарушения: гипокалиемия.

Инфекции: фарингиты, грипп, кандидозы слизистой оболочки полости рта, глотки и пищевода, вагинальный кандидоз, гастроэнтериты, синуситы.

Среди наиболее частых побочных эффектов, связанных с приемом формотерола, описаны такие типичные для бета$_2$-адреномиметиков, как гипокалиемия, головная боль, тремор, сердцебиение, кашель, мышечные судороги, удлинение QTc-интервала.

Побочные эффекты, характерные для беклометазона дипропионата: кандидоз слизистой оболочки полости рта и глотки, раздражение в горле.

Как и другие ингаляционные препараты, Фостер может вызывать парадоксальный бронхоспазм.

Другие побочные эффекты, характерные для формотерола: тромбоцитопения, ангионевротический отек, гипергликемия, увеличение содержания в крови инсулина, свободных жирных кислот, глицерола и кетоновых

производных, нарушения сна, галлюцинации, утомляемость, беспокойство, изменение вкусовых ощущений (дисгевзия), тахикардия, тахиаритмия, желудочковая экстрасистолия, стенокардия, фибрилляция предсердий, артериальная гипертензия, артериальная гипотензия, обострение бронхиальной астмы, одышка, тошнота, зуд, кожная сыпь, крапивница, гипергидроз, миалгия, нефрит, периферические отеки.

Системные эффекты ГКС (в т.ч. беклометазона дипропионата) возникают при назначении высоких доз на длительное время. Они включают: угнетение функции надпочечников, снижение минеральной плотности костной ткани, задержка роста у детей и подростков, глаукома и катаракта.

Реакции повышенной чувствительности включают: зуд, кожную сыпь, эритему и отек глаз, лица, губ и горла.

Передозировка:

Симптомы: при передозировке возникают типичные для бета$_2$-адреномиметиков симптомы, обусловленные формотеролом, такие как тошнота, рвота, головная боль, тремор, сонливость, сильное сердцебиение, тахикардия, желудочковая аритмия, удлинение интервала QTc, метаболический ацидоз, гипокалиемия, гипергликемия.

Лечение: симптоматическое лечение. В тяжелых случаях госпитализация. Может быть рассмотрено использование кардиоселективных бета-адреноблокаторов при соблюдении осторожности, так как применение этих средств может вызвать бронхоспазм. Необходимо мониторирование уровня калия в плазме крови.

Ингаляция доз беклометазона дипропионата выше рекомендуемых может вызвать временное угнетение функции коры надпочечников. Обычно это не требует принятия каких-то экстренных мер, поскольку в большинстве случаев нормальная функция надпочечников восстанавливается в течение нескольких дней. Рекомендуется проводить контроль уровня кортизола в плазме крови.

При хроническом приеме чрезмерных доз беклометазона дипропионата может проявиться его системное действие: может возникнуть значимое угнетение коры надпочечников вплоть до адреналового криза. Острый адреналовый криз проявляется гипогликемией, сопровождающейся спутанностью сознания и/или судорогами. К ситуациям, которые могут служить пусковыми факторами острого адреналового криза, относятся травма, хирургическое вмешательство, инфекция или быстрое снижение дозы входящего в состав Фостера беклометазона. При хронической передозировке рекомендуется проводить контроль резервной функции коры надпочечников.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Нет клинических данных об использовании Фостера во время беременности. В ходе исследований на животных эмбриотоксического или тератогенного действия выявлено не было.

При беременности Фостер следует использовать только в тех случаях, когда польза от применения препарата превышает потенциальный риск для плода. Рекомендуется назначать минимальную дозу, обеспечивающую эффективный контроль симптомов бронхиальной астмы.

Нет данных о проникновении Фостера в грудное молоко женщин. Фостер может назначаться кормящим женщинам исключительно в тех случаях, когда ожидаемый терапевтический эффект для матери превосходит потенциальный риск для ребенка.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Блокаторы бета-адренорецепторов могут ослаблять действие формотерола. Фостер не следует назначать одновременно с бета-адреноблокаторами (включая глазные капли), за исключением вынужденных случаев.

При совместном приеме Фостера и других бета-адренергических препаратов возможно усиление побочного действия формотерола.

Совместное назначение Фостера и хинидина, дизопирамида, прокаинамида, фенотиазинов, антигистаминных препаратов (терфенадина), ингибиторов МАО и трициклических антидепрессантов может удлинять интервал QTc и увеличивать риск возникновения желудочковых аритмий.

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

Совместное назначение 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 галогенированных углеводородов.

В результате применения бета$_2$-адреномиметиков может возникать гипокалиемия, которая может усиливаться при сопутствующем лечении производными ксантина, минеральными производными ГКС, диуретиками. Гипокалиемия может усиливать предрасположенность к развитию аритмий у пациентов, принимающих сердечные гликозиды.

Из-за содержания небольшого количества этанола возможно проявление взаимодействия у пациентов с повышенной чувствительностью, принимающих дисульфирам или метронидазол.

Особые указания и меры предосторожности:

Если у пациентов наблюдаются такие сопутствующие заболевания, как ИБС, инфаркт миокарда, обострение течения артериальной гипертензии, нарушения сердечного ритма, хроническая сердечная недостаточность, сахарный диабет, гипертрофия предстательной железы, глаукома, необходимо проявлять особую осторожность при выборе дозы Фостера.

Следует соблюдать меры предосторожности при лечении пациентов с удлиненным интервалом QT_c (QTc >0.44 сек.). Прием формотерола может вызывать удлинение интервала QTc. Фостер может использоваться у пациентов с тахиаритмией только при соблюдении особых мер предосторожности, таких как мониторинг ЭКГ.

Следует соблюдать особые меры предосторожности у пациентов с нестабильной бронхиальной астмой, применяющих бронходилататоры короткого действия, для снятия приступов при обострении тяжелой бронхиальной астмы, т.к. риск
развития гипокалиемии увеличивается на фоне гипоксии и при других состояниях, когда увеличивается вероятность проявления развития гипокалиемического эффекта. В таких случаях рекомендуется контролировать содержание калия в сыворотке.

Ингаляции высоких доз формотерола могут приводить к повышению уровня глюкозы в крови. В период лечения следует контролировать концентрацию глюкозы в крови у пациентов, страдающих сахарным диабетом. Если планируется анестезия
препаратами галогенированных углеводородов, необходимо предупредить пациента не использовать Фостер в течение 12 ч перед началом анестезии.

Как и при назначении других ГКС, следует пересмотреть необходимость применения и дозу Фостера у пациентов с активной или неактивной формами туберкулеза легких, грибковыми, вирусными или бактериальными инфекциями органов дыхания.

Из-за опасности развития обострения лечение Фостером нельзя резко прекращать, дозу препарата следует снижать постепенно и под контролем врача.

Когда пациенты уже проходят данный курс лечения (ингаляционные или пероральные ГКС), его необходимо продолжить без каких-либо изменений, даже если наблюдается улучшение симптомов.

Сохранение симптомов бронхиальной астмы или необходимость увеличения дозы Фостера может свидетельствовать об ухудшении течения бронхиальной астмы и необходимости пересмотра лечения. Для купирования острых приступов бронхоспазма пациентам рекомендуется постоянно иметь при себе бета$_2$-адреномиметики короткого действия.

Лечение Фостером не следует назначать в период обострения бронхиальной астмы.

Как и при любой другой ингаляционной терапии, возможно возникновение парадоксального бронхоспазма с немедленным
усилением хрипов после приема дозы препарата. В связи с чем, следует прекратить терапию Фостером, пересмотреть тактику лечения и, при необходимости, назначить альтернативную терапию.

Любой ингаляционный ГКС может вызывать системные эффекты, особенно при длительном использовании в высоких дозах; следует отметить, однако, что вероятность развития таких симптомов намного ниже, чем при лечении пероральными ГКС. Возможные системные эффекты включают угнетение функции надпочечников, задержку роста у детей и подростков, снижение минеральной плотности костной ткани, катаракту и глаукому. Учитывая сказанное, дозу ингаляционного ГКС следует титровать до минимальной, которая обеспечит поддержание эффективного контроля.

При хроническом приеме чрезмерных доз беклометазона дипропионата может проявиться его системное действие: может возникнуть значимое угнетение коры надпочечников вплоть до адреналового криза. Адреналовый криз проявляется анорексией, болями в животе, снижением веса, усталостью, головной болью, тошнотой, рвотой, гипотензией, гипогликемией, сопровождающейся спутанностью сознания и/или судорогами. К ситуациям, которые могут служить пусковыми факторами острого адреналового криза, относятся травма, хирургическое вмешательство, инфекция или
быстрое снижение дозы входящего в состав Фостера беклометазона. При хронической передозировке рекомендуется проводить контроль резервной функции коры надпочечников.

Если есть основания полагать, что на фоне предшествующей системной терапии ГКС была нарушена функция надпочечников, следует принять меры предосторожности при переводе пациентов на лечение Фостером.

Преимущества ингаляционной терапии, как правило, сводят к минимуму необходимость приема пероральных ГКС, однако у пациентов, прекращающих терапию пероральными ГКС, в течение длительного времени может сохраняться недостаточная функция надпочечников. Пациенты, которые в прошлом нуждались в неотложном приеме высоких доз ГКС или получали длительное лечение ингаляционными ГКС в высокой дозе, также могут находиться в этой группе риска.

Необходимо предусмотреть дополнительное назначение ГКС в период стресса или хирургического вмешательства.

Рекомендуется проинструктировать пациента о необходимости полоскать рот водой после ингаляций поддерживающих доз с целью предотвращения риска развития кандидоза слизистой оболочки полости рта и глотки.

Баллон находится под давлением: не подвергать воздействию высокой температуры, не протыкать, не бросать в огонь, даже пустой. Использовать в течение 3 месяцев с начала применения.

При нарушениях функции почек

Нет данных о приеме Фостера **пациентами с почечной недостаточностью**.

При нарушениях функции печени

Нет данных о приеме Фостера **пациентами с печеночной недостаточностью**.

Применение в пожилом возрасте

Нет необходимости в специальном подборе дозы препарата для **пациентов пожилого возраста**.

Применение в детском возрасте

Противопоказан детям в возрасте до 12 лет.

Условия хранения:

Хранить препарат при температуре +2°-8°С, в защищенном от солнца месте, вдали от нагревательных приборов. Не замораживать. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности - 18 месяцев. Не использовать после даты, указанной на упаковке.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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