Оксис Турбухалер



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:

Порошок для ингаляций в виде округлых гранул от белого до почти белого цвета, распадающихся в тонкий порошок при небольшом давлении; возможно содержание порошкообразной фракции.

	1 доза (1 ингаляция)
формотерола фумарата дигидрат	4.5 мкг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 450 мкг.

60 доз - ингаляторы пластиковые (1) состоят из дозирующего устройства, резервуара для хранения порошка, резервуара для дессиканта, мундштука, навинчивающейся крышки, нижнего поворачивающегося диска светлого зеленовато-голубого цвета - пачки картонные.

Порошок для ингаляций в виде округлых гранул от белого до почти белого цвета, распадающихся в тонкий порошок при небольшом давлении; возможно содержание порошкообразной фракции.

	1 доза (1 ингаляция)
формотерола фумарата дигидрат	9 мкг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 450 мкг.

60 доз - ингаляторы пластиковые (1) состоят из дозирующего устройства, резервуара для хранения порошка, резервуара для дессиканта, мундштука, навинчивающейся крышки, нижнего поворачивающегося диска темного зеленовато-голубого цвета - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Селективный бета$_2$-адреномиметик. Оказывает бронхолитическое действие у пациентов с обратимой обструкцией дыхательных путей.

После применения препарата в разовой дозе терапевтический эффект достигается быстро (через 1-3 мин) и продолжается в среднем 12 ч.

Фармакокинетика

Всасывание

После ингаляции формотерол быстро абсорбируется. C_{max} в плазме отмечается через 10 мин. Средняя доля препарата, попадающего в легкие после ингаляции с помощью турбухалера, составляет 28-49% от доставленной дозы (что соответствует 21-37% от ингалируемой дозы). При более высоких концентрациях в легких общая системная биодоступность препарата составляет 61% от доставленной дозы (что соответствует 46% от ингалируемой дозы).

Распределение и метаболизм

Связывание с белками плазмы составляет приблизительно 50%.

Препарат подвергается метаболизму путем прямого присоединения остатка глюкуроновой кислоты и О-деметилирования. Фермент, участвующий в реакции О-деметилирования, не установлен. Общий плазменный клиренс и V_d не установлены.

Выведение

Основная часть формотерола выводится из системного кровотока в виде метаболитов. После ингаляции 8-13% доставленной дозы (что соответствует 6-10% ингалируемой дозы) выводится в неизмененном виде с мочой. $T_{1/2}$ составляет в среднем 17 ч.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Влияние на фармакокинетнку формотерола сниженной функции почек или печени, а также фармакокинетика у пожилых пациентов не описаны.

Поскольку формотерол выводится из организма в результате метаболизма, у пациентов с тяжелым циррозом печени следует ожидать замедления выведения препарата.

Показания к применению:

При бронхиальной астме в дополнение к терапии ГКС:

— для регулярной поддерживающей терапии;

— для купирования приступов бронхоспазма;

— для профилактики приступов, вызванных физической нагрузкой.

При хронической обструктивной болезни легких для профилактики и лечения бронхообструктивных симптомов.

Относится к болезням:

- Бронхит
- Бронхоспазм
- Хроническая обструктивная болезнь легких

Противопоказания:

— детский возраст до 6 лет;

— повышенная чувствительность к формотеролу или лактозе.

С *осторожностью* следует назначать препарат пациентам с тиреотоксикозом, феохромоцитомой, сахарным диабетом, гипертрофической обструктивной кардиомиопатией, идиопатическим субаортальным стенозом, тяжелой артериальной гипертензией, аневризмой и тяжелыми заболеваниями сердечно-сосудистой системы (в т.ч. ИБС, тахиаритмии или тяжелая сердечная недостаточность).

Необходимо с осторожностью назначать препарат пациентам, у которых определяется удлинение интервала QT_c на ЭКГ, а также пациентам, принимающим лекарственные средства, способные влиять на продолжительность интервала QT_c.

Следует соблюдать особую осторожность при обострении тяжелой бронхиальной астмы, так как риск развития гипокалиемии может усиливаться гипоксией.

Способ применения и дозы:

Препарат в **дозе 4.5 мкг/1 доза** назначают **взрослым** по 1-2 ингаляции 1-2 раза/сут (утром и/или вечером). При

необходимости назначают по 4 ингаляции 1-2 раза/сут. Максимальная суточная доза для регулярной поддерживающей терапии - 8 ингаляций. При необходимости дополнительные ингаляции, свыше рекомендованных для регулярной поддерживающей терапии, могут проводиться пациентом для купирования приступов бронхоспазма до максимальной суточной дозы, которая составляет 12 ингаляций (поддерживающая доза + дозы, принимаемые при необходимости). Не рекомендуется применение более 6 доз (ингаляций) для купирования одного приступа. Необходимость в использовании препарата более 2 раз/сут и/или использование больших дозировок, чем необходимо для поддерживающей терапии чаще, чем 2 дня в неделю, является критерием недостаточного контроля заболевания и терапия заболевания должна быть пересмотрена.

При наличии ночных приступов бронхиальной астмы рекомендованную дозу препарата можно принимать 1 раз на ночь (продолжительность действия препарата составляет около 12 ч.)

При подборе дозы необходимо стремиться к назначению минимальной эффективной дозы.

При *хронической обструктивной болезни легких* назначают 2 ингаляции 1-2 раза/сут. Максимальная суточная доза для регулярной поддерживающей терапии составляет 4 ингаляции. При необходимости дополнительные ингаляции, свыше рекомендованных для регулярной поддерживающей терапии, могут проводиться пациентом для облегчения бронхообструктивных симптомов до максимальной общей суточной дозы, которая составляет 8 ингаляций (поддерживающая доза + дозы, принимаемые по необходимости). Не рекомендуется применение более 4 доз за 1 прием. Частое использование препарата (более 2 раз в сутки и/или чаще 2 дней в неделю), свыше рекомендованного для регулярной поддерживающей терапии, указывает на недостаточный контроль заболевания и необходимость пересмотра схемы лечения.

Детям в возрасте 6 лет и старше назначают 2 ингаляции 1-2 раза/сут. Максимальная суточная доза - 4 ингаляции.

Для *профилактики приступов бронхиальной астмы, вызванных физической нагрузкой,* **взрослым и детям в возрасте 6 лет и старше** назначают 2 ингаляции до физической нагрузки. Не следует превышать максимальную суточную дозу.

Препарат в **дозе 9 мкг/1 доза** назначают **взрослым** по 1 ингаляции 1-2 раза/сут (утром и/или вечером). При необходимости назначают по 2 ингаляции 1-2 раза/сут. Суточная доза регулярной поддерживающей терапии составляет 4 ингаляции. При необходимости дополнительные ингаляции, свыше рекомендованных для регулярной поддерживающей терапии, могут проводиться пациентом для купирования приступов бронхоспазма до максимальной суточной дозы, которая составляет 6 ингаляций (поддерживающая доза + дозы, принимаемые по необходимости). Не рекомендуется применение более 3 доз (ингаляций) для купирования одного приступа. Частое использование препарата (более 2 раз/сут и/или 2 дней в неделю), свыше рекомендованного для регулярной поддерживающей терапии, указывает на недостаточный контроль заболевания и необходимость пересмотра схемы лечения.

При наличии ночных приступов бронхиальной астмы рекомендованную дозу препарата можно принимать 1 раз на ночь (продолжительность действия препарата составляет около 12 ч.)

При подборе дозы необходимо назначать минимальные эффективные дозы.

При *хронической обструктивной болезни легких* назначают 1 ингаляцию 1-2 раза/сут. Максимальная суточная доза для регулярной поддерживающей терапии составляет 2 ингаляции. При необходимости дополнительные ингаляции (свыше рекомендованных для регулярной поддерживающей терапии) могут приниматься пациентом для купирования бронхообструктивных симптомов до максимальной общей суточной дозы, которая составляет 4 ингаляции (поддерживающая доза + дозы, принимаемые по необходимости). Не рекомендуется применение более 2 доз препарата за 1 прием. Частое использование препарата (более 2 раз/сут и/или чаще 2 дней в неделю), свыше рекомендованного для регулярной поддерживающей терапии, указывает на недостаточный контроль заболевания и необходимость пересмотра схемы лечения.

Детям в возрасте 6 лет и старше назначают по 1 ингаляции 1-2 раза/сут. Максимальная суточная доза - 2 ингаляции.

Для *профилактики приступов бронхиальной астмы, вызванных физической нагрузкой,* **взрослым и детям в возрасте 6 лет и старше** назначают 1 ингаляцию до физической нагрузки. Не следует превышать максимальную суточную дозу.

Не требуется специального подбора дозы **пациентам пожилого возраста, а также пациентам с нарушениями функции почек или печени** при назначении рекомендованных доз препарата.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС: часто (>1/100) - головная боль; редко (<1/100) - возбуждение, беспокойство, нарушение сна.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто (>1/100) - учащенное сердцебиение; редко (<1/100) - тахикардия, изменение АД; очень редко (< 1/1000) - мерцание предсердий, наджелудочковая тахикардия, экстрасистолия.

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

Дерматологические реакции: очень редко (<1/1000) - сыпь, крапивница, зуд.

Метаболические нарушения: очень редко (<1/1000) - гипокалиемия, гиперкалиемия.

Со стороны дыхательной системы: очень редко (<1/1000) - бронхоспазм.

Тремор и учащенное сердцебиение носят временный характер и проходят в процессе лечения. Как и при любой ингаляционной терапии, в очень редких случаях возможно развитие парадоксального бронхоспазма.

Описаны единичные случаи развития следующих побочных эффектов: тошнота, нарушение вкуса, головокружение, стенокардия, удлинение интервала QT_c, реакции гиперчувствительности, изменение АД и гипергликемия. Применение β_2-симпатомиметиков может приводить к увеличению содержания в крови инсулина, свободных жирных кислот, глицерола и кетона.

Передозировка:

Клинический опыт лечения в случае передозировки отсутствует.

Симптомы: наиболее вероятны симптомы, типичные для других бета$_2$-адреномиметиков, - тремор, головная боль, учащенное сердцебиение; в отдельных случаях - тахикардия, гипергликемия, гипокалиемия, удлинение интервала QT_c, аритмия, тошнота, рвота.

Лечение: проводят симптоматическую и поддерживающую терапию. Возможно назначение кардиоселективных бета-адреноблокаторов, однако это надо делать с большой осторожностью, так как назначение блокаторов β-адренорецепторов может спровоцировать развитие бронхоспазма. При этом также показан мониторинг содержания калия в сыворотке крови.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Клинический опыт применения препарата Оксис Турбухалер при беременности ограничен.

При беременности должен быть обеспечен контроль симптомов бронхиальной астмы, для этой цели Оксис Турбухалер можно применять на всех сроках беременности. Однако, как и для любых других препаратов, решение о назначении препарата при беременности должно приниматься только в том случае, когда ожидаемая польза для матери превосходит любой возможный риск для плода.

В *экспериментальных исследованиях* на лабораторных животных отмечено отторжение имплантата, а также уменьшение продолжительности жизни потомства в раннем постнатальном периоде и снижение веса тела при рождении. Эти эффекты наблюдали при системных экспозициях, значительно превышающих экспозиции, достигаемые при применении клинических доз препарата.

Неизвестно, выделяется ли формотерол с грудным молоком.

В *экспериментальных исследованиях* на лабораторных животных (крысах) было показано наличие небольших количеств формотерола в материнском молоке.

Решение о назначении препарата в период лактации принимается только в том случае, когда ожидаемая польза для матери превосходит любой возможный риск для ребенка.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Специальные исследования по изучению лекарственного взаимодействия Оксис Турбухалера с другими препаратами не проводились.

При одновременном применении с другими симпатомиметиками (эфедрин) Оксис Турбухалера возможно усиление побочных эффектов последнего.

При одновременном применении с производными ксантина, ГКС или диуретиками (тиазидные и "петлевые" диуретики) возможно усиление гипокалиемии. Гипокалиемия может усиливать риск развития аритмий у пациентов, получающих сердечные гликозиды.

При одновременном применении Оксис Турбухалера с препаратами, удлиняющими интервал QTc (в т.ч. антигистаминными препаратами: терфенадином, астемизолом, мизоластином; антиаритмиками: хинидином, дизопирамидом, прокаинамидом; эритромицином и трициклическими антидепрессантами), может возрастать риск развития желудочковых аритмий.

Существует риск развития аритмий у пациентов, получающих Оксис Турбухалер и сопутствующую анестезию галогенизированными углеводородами.

Бета-адреноблокаторы могут частично или полностью блокировать действие препарата (особенно в тех случаях, когда применяются неселективные β-адренорецепторы). В связи с чем не следует назначать Оксис Турбухалер совместно с бета-адреноблокаторами (включая глазные капли), за исключением крайней необходимости совместного применения.

Особые указания и меры предосторожности:

Формотерол, содержащийся в препарате, попадает в дыхательные пути пациента вместе с потоками воздуха при выполнении активного вдоха через мундштук Турбухалера. Важно четко инструктировать пациента делать глубокий и сильный вдох через мундштук для гарантированного попадания оптимальной дозы препарата в дыхательные пути.

Также пациента следует инструктировать никогда не жевать и не грызть мундштук, не использовать Турбухалер в случае повреждения мундштука или отсоединения мундштука от корпуса Турбухалера.

Пациент может не почувствовать вкус или не ощутить препарат после использования Оксиса Турбухалера, что обусловлено небольшим количеством доставляемого вещества.

Следует учитывать, что пациенты с бронхиальной астмой, регулярно принимающие бета$_2$-адреномиметики, должны получать оптимальную противовоспалительную терапию кортикостероидами. Следует рекомендовать пациентам продолжать противовоспалительную терапию даже в тех случаях, когда после приема Оксиса Турбухалера наступает улучшение. Сохранение симптоматики или возникновение необходимости увеличения дозы бета$_2$-адреномиметиков является признаком ухудшения состояния пациента и требует пересмотра противоастматической терапии.

Не следует начинать лечение Оксис Турбухалером и увеличивать его дозу при обострении заболевания.

Не следует превышать максимальную суточную дозу препарата. Отсутствуют данные по безопасности при длительном постоянном применении препарата в более высоких дозах, таких как 36 мкг/сут у взрослых и 18 мкг/сут у детей при бронхиальной астме, и 18 мкг /сут у пациентов с ХОБЛ.

Частое использование препарата для профилактики симптомов бронхиальной астмы, вызванных физической нагрузкой, может указывать на недостаточный контроль течения заболевания и послужить причиной пересмотра используемой схемы лечения, а также оценки степени приверженности пациента к соблюдению применяемой схемы терапии. Если необходимость в профилактике симптомов бронхиальной астмы, вызванных физической нагрузкой, возникает по несколько раз в течение одной недели на фоне адекватной поддерживающей терапии (ГКС, бета$_2$-адреномиметики длительного действия), то необходим пересмотр текущей схемы лечения специалистом.

При сахарном диабете в начале лечения следует контролировать концентрацию глюкозы в крови, поскольку бета$_2$-адреномиметики обладают гипергликемическим эффектом.

В результате применения бета$_2$-адреномиметиков потенциально может развиться тяжелая гипокалиемия. Следует соблюдать особую осторожность при обострении тяжелой бронхиальной астмы, т.к. риск развития гипокалиемии может усиливаться при гипоксии. Гипокалиемия может усугубляться при сопутствующей терапии производными ксантина, стероидами, диуретиками. В таких случаях необходимо контролировать уровень калия в сыворотке крови.

Также как и при использовании другой ингаляционной терапии, необходимо учитывать возможность развития парадоксального бронхоспазма.

Доставляемая доза препарата содержит 450 мкг лактозы в (соответствует 600 мкг в измеренной дозе). Такое количество, как правило, не вызывает проблем у людей с непереносимостью лактозы.

Использование в педиатрии

Детям в возрасте до 6 лет не следует назначать препарат, так как отсутствует достаточная информация для данной возрастной группы.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Оксис Турбухалер не влияет на способность к концентрации внимания и на скорость психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Не требуется специального подбора дозы **пациентам с нарушениями функции почек** при назначении рекомендованных доз препарата.

При нарушениях функции печени

Не требуется специального подбора дозы **пациентам с нарушениями функции печени** при назначении

рекомендованных доз препарата.

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить недоступном для детей месте при температуре не выше 30°C. Турбухалер после применения следует хранить плотно закрытым.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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