

ИНСТРУКЦИЯ
по применению лекарственного препарата для медицинского применения

ФОРМОТЕРОЛ ИЗИХЕЙЛЕР

Регистрационный номер: ЛС-002226

Торговое название препарата: **Формотерол Изихейлер**

Международное непатентованное название: **формотерол**.

Лекарственная форма: **порошок для ингаляций дозированных**.

Состав: каждая доза содержит:
активное вещество: формотерола фумарата дигидрат – 0,012 мг;
вспомогательное вещество: лактозы моногидрат – 7,988 мг.

Описание: ингалятор из полимерного материала. На дозирующую часть прибора надета крышечка с фиксатором. На лицевой части прибора нанесена надпись «EaTuheler». Сбоку находится счетчик количества оставшихся доз. Содержимое ингалятора – однородный порошок белого или желтовато-белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа:
бронходилатирующее средство – beta2-адреномиметик селективный.
КОД АТХ: R03AC13.

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

Фармакодинамика
Формотерол – мощный селективный стимулятор beta2-адренорецепторов. У пациентов с обратимой обструкцией дыхательных путей он оказывает бронхорасширяющее действие. Это действие развивается быстро (в течение 1–3 минут) и остается достаточно выраженным через 12 часов после ингаляции препарата.
Показано, что у человека формотерол предотвращает развитие бронхоспазма, индуцируемого физической нагрузкой и метакוליном.

Фармакокинетика

Всасывание
Около 80% формотерола при назначении через ингалятор Изихейлер проглатывается и впоследствии всасывается в желудочно-кишечном тракте. Поэтому к ингаляционной лекарственной форме в значительной степени применимы данные о фармакокинетических свойствах, полученные для лекарственной формы для приема внутрь. После ингаляции терапевтических доз препарата формотерол не обнаруживается в плазме с помощью существующих аналитических методов. Всасывание происходит быстро и с высокой интенсивностью: при дозах, превышающих терапевтические (120 мкг), максимальная концентрация препарата в плазме наблюдается через 5 минут после ингаляции, в то время как при приеме внутрь 80 мкг всасывается не менее 65%, а прием препарата внутрь в дозах до 300 мкг сопровождается его быстрым всасыванием с достижением максимальной концентрации в течение 0,5–1 часа.

Фармакокинетика формотерола в изученном диапазоне доз, т.е. 20–300 мкг, имеет линейный характер. При повторном приеме внутрь в дозе 40–160 мкг/сут значимого накопления препарата не отмечено. Максимальная скорость экскреции после назначения 12–96 мкг достигается в течение 1–2 часов после ингаляции.

В исследованиях кумулятивной экскреции формотерола и/или его (R,R) и (S,S)-энантиомеров с мочой после ингаляции сухого порошка (12–96 мкг) или аэрозольных лекарственных форм (12–96 мкг) было выявлено, что абсорбция по мере увеличения дозы возрастает линейно. Связь с белками плазмы для формотерола составляет 61–64 (34% — с альбумином). Насыщение участков связывания в диапазоне концентраций достигается при назначении терапевтических доз препарата, не происходит.

Биотрансформация
Основной путь биотрансформации – глюкуронирование, другим путем является S-деметилирование с дальнейшей конъюгацией глюкуроновой кислотой. Процесс катализируют большое количество изоферментов системы CYP450 (2D6, 2C19, 2C9, 2A6), поэтому возможность метаболических лекарственных взаимодействий низкая. Кинетика формотерола после однократного и повторного введения оказывается сходной, что указывает на отсутствие аутоиндукции или подавления метаболизма.

Выведение из организма
Процесс выведения формотерола из системы кровообращения многофазный; период полувыведения зависит от рассматриваемого временного интервала. На основании данных о концентрациях препарата в плазме крови в период до 6, 8 или 12 часов после приема внутрь, период полувыведения составляет около 2–3 часов. По данным скорости экскреции с мочой в период от 3 до 16 часов после ингаляции, период полувыведения – около 5 часов.
После однократного приема внутрь формотерола 59–62 % выводится с мочой, и 32–34 % — с калом. Почечный клиренс формотерола – 150 мл/мин.

ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ

Лечение и профилактика бронхоспазма, вызванного физическими нагрузками, холодным воздухом или вдыхаемыми аллергенами у больных с бронхиальной астмой в качестве дополнения к терапии ингаляционными глюкокортикостероидами.

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

Реакции гиперчувствительности на формотерол или лактозу, детский возраст до 6 лет, период лактации, редкие наследственные заболевания, такие как непереносимость лактозы, дефицит лактазы или глюкозо-галактозная мальабсорбция.

С осторожностью: выраженная хроническая сердечная недостаточность, ишемическая болезнь сердца, нарушения сердечного ритма, тахикардия, аритмогенная блокада III ст., удлинение интервала Q-T (Q-T скорректированный > 0,44 с), гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия, анорексия, артериальная гипертензия, феохромоцитом, сахарный диабет, тиреотоксикоз.

Беременность и лактация

Необходимые данные по применению формотерола для лечения беременных женщин отсутствуют.
Тератогенного влияния препарата в исследованиях на животных не выявлено, однако в исследованиях на животных формотерол приводил к отторжению имплантированной яйцеклетки, а также к снижению уровня постнатальной выживаемости и к снижению веса новорожденных. Эти эффекты, по-видимому, обусловлены более сильным системным воздействием, чем то, которое наблюдается при клиническом применении формотерола. До накопления более обширного опыта Формотерол Изихейлер не рекомендуется применять во время беременности (особенно в конце беременности или в период родов), кроме случаев, когда другие доказанные альтернативы лечения не остаются. Как и для любых видов лекарственной терапии, применение данного препарата во время беременности следует рассматривать только в случае, если ожидаемая польза для матери оказывается выше риска от этого вида лечения для плода.

В исследованиях на крысах небольшие количества формотерола были обнаружены в материнском молоке. Нет данных о том, проникает ли формотерол в грудное молоко у человека, поэтому матерям в период лактации, пользующимся ингалятором Формотерол Изихейлер, рекомендуется воздерживаться от кормления детей грудью.

СПОСОБ ПРИМЕНЕНИЯ И ДОЗЫ

Ингаляции

Взрослые (в том числе пожилые)
Бронхиальная астма
Постоянная поддерживающая терапия: 1 ингаляция (12 мкг) 2 раза в сутки; у некоторых пациентов может потребоваться проведение 2 ингаляций (24 мкг) 2 раза в сутки. Максимальная суточная доза при постоянном применении составляет 4 ингаляции.

При необходимости возможно применение дополнительных доз, помимо назначенных для постоянной поддерживающей терапии, для купирования симптомов до максимальной общей суточной дозы 6 ингаляций (поддерживающих плюс принимаемых по потребности). Не следует проводить более 3 ингаляций одновременно. Однако частое (более двух раз в сутки) и/или более чем в течение 2 суток в неделю) применение, либо применение в дозах, превышающих рекомендованные для постоянной поддерживающей терапии, является признаком субоптимального контроля течения бронхиальной астмы и требует пересмотра схемы лечения.

Профилактика бронхоспазма, вызываемого физическими нагрузками:

1 ингаляция (12 мкг) приблизительно за 15 минут до физической нагрузки. При тяжелом течении бронхиальной астмы могут потребоваться 2 ингаляции (24 мкг). Не следует превышать максимальную общую суточную дозу (6 ингаляций).

Дети в возрасте 6 лет и старше

Бронхиальная астма
Постоянная поддерживающая терапия: 1 ингаляция (12 мкг) 2 раза в сутки. Не следует проводить более 2-х ингаляций в день.

ПОБОЧНОЕ ДЕЙСТВИЕ

Наиболее часто регистрируемые неблагоприятные побочные эффекты терапии бета2-адреномиметиками, такие, как тремор и ощущение сердцебиения, как правило, проявляются в легкой степени и исчезают через несколько дней после начала лечения.

Нарушения обмена веществ и питания	Редко (> 1/10000 - < 1/1000)	Гипокалемия, гиперкалемия
	Очень редко, включая отдельные случаи (< 1/10000)	Гипергликемия
Заболевания нервной системы	Часто (> 1/100 - < 1/10) Нечасто (> 1/1000 - < 1/100)	Головная боль Возбуждение, беспокойство, головокружение, тревога, нервозность, бессонница, нарушения сна
Заболевания сердца	Часто (> 1/100 - < 1/10) Нечасто (> 1/1000 - < 1/100) Редко (> 1/10000 - < 1/1000)	Нарушения ритма сердца Тахикардия Мерцательная аритмия, наджелудочковая тахикардия, экстрасистолия,
Заболевания сосудов	Очень редко, включая отдельные случаи (< 1/10000)	Стенокардия, увеличение продолжительности интервала QT
Заболевания дыхательных путей, органов грудной клетки и средостения	Редко (> 1/10000 - < 1/1000)	Усиление бронхоспазма, раздражение полости рта и глотки, парадоксальный бронхоспазм
Желудочно-кишечные заболевания	Очень редко, включая отдельные случаи (< 1/10000)	Нарушения вкуса, тошнота
Заболевания скелетно-мышечной системы, соединительной и костной ткани	Часто (> 1/100 - < 1/10) Нечасто (> 1/1000 - < 1/100)	Тремор Мышечные судороги, миалгия
Общие заболевания и состояния, развивающиеся в участке введения препарата	Очень редко, включая отдельные случаи (< 1/10000)	Реакции гиперчувствительности, в т.ч. бронхоспазм, выраженное снижение артериального давления, крапивница, ангионевротический отек, зуд, сыпь, периферические отеки

Лечение бета2-адреномиметиками может приводить к повышению в крови концентрации инсулина, свободных жирных кислот, глицерина, кетоновых тел. Как и в случае применения любых ингаляционных средств, парадоксальный бронхоспазм наблюдается в очень редких случаях.

ПЕРЕДОЗИРОВКА

Симптомы
Клинического опыта по лечению передозировки до настоящего времени не накоплено, однако предполагается, что передозировка лекарственного вещества Формотерол Изихейлер будет сопровождаться симптомами, обычно наблюдающимися при передозировке бета2-адреномиметиками: тошнотой, рвотой, головными болями, тремором, сонливостью, сердцебиением, тахикардией, желудочковыми аритмиями, повышением/понижением артериального давления, метаболическим ацидозом, гипокалемией, гипергликемией, удлинением интервала QT, аритмией.
Показано проведение поддерживающей и симптоматической терапии. При тяжелом течении пациента следует госпитализировать. Возможно применение кардиоселективных бета-адреноблокаторов, требующее крайней осторожности, поскольку использование бета-адреноблокаторов может провоцировать развитие бронхоспазма. Следует проводить контроль концентрации калия в сыворотке крови.

ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ С ДРУГИМИ ЛЕКАРСТВЕННЫМИ СРЕДСТВАМИ

Исследования специфических взаимодействий ингалятора Формотерол Изихейлер не проводились.
Увеличение продолжительности интервала QT и повышение риска развития желудочковых аритмий может наблюдаться при лечении рядом препаратов, удлиняющих интервал QT с например, хинидином, дилтиаземом, прокаиномидом, сотололом, ацидокарбонил фенотилазином, некоторыми антигистаминными препаратами (например, терфенадином, астемизолом, мизоластин), ингибиторами моноаминоксидазы, трициклическими антидепрессантами, эритромицином. Одновременное применение других симпатомиметических препаратов может усиливать побочные эффекты применения Формотерола Изихейлер.

Прим. леводобы, левотиросина натрия, окситадина и алкалоидов может усиливать побочное действие бета2-адреномиметиков на сердце.

У пациентов, получающих ингибиторы моноаминоксидазы или трициклические антидепрессанты, Формотерол Изихейлер следует применять с осторожностью, поскольку действие бета2-адреномиметика на сердечно-сосудистую систему при этом может усиливаться. Не следует применять Формотерол Изихейлер пациентам, получающим ингибиторы моноаминоксидазы, и в течение 14 дней после прекращения их приема.
Одновременный прием производных ксантинов, глюкокортикостероидов, диуретиков может усиливать возможное гипокалемическое действие бета2-адреномиметиков. Гипокалемия может усиливать риск развития аритмий сердца на фоне лечения препаратами наперстянки.

Риск развития аритмий увеличивается на фоне проведения общей анестезии галогену-леводородом.
Бета-адреноблокаторы могут ослабить или устранить действие Формотерола Изихейлер. Поэтому препарат не следует использовать одновременно с бета-адреноблокаторами (в том числе в составе глазных капель), если только их использование не обосновано жизненными показаниями.
Одновременное применение формотерола и глюкокортикостероидов может привести к усилению гипотензивного эффекта, наблюдаемого при приеме этих препаратов.
Бронхолитический эффект формотерола может усиливаться при приеме антихолинэргических препаратов.

ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ

У пациентов с бронхиальной астмой Формотерол Изилайер следует использовать только в качестве дополнительного лечения при недостаточной эффективности ингаляционных глюкокортикостероидов (в средних и малых дозах) или при тяжелой форме заболевания, требующей применения двух поддерживающих видов терапии, включающих Формотерол Изилайер. При назначении препарата пациентам, не получающим противовоспалительную терапию, ее следует начинать одновременно с применением Формотерола Изилайера.

Поражение почек и печени
Данных о необходимости корректировать дозу препарата Формотерол Изилайер у пациентов с нарушением функции почек или печени нет.
Продолжительность действия формотерола составляет около 12 часов. Лечение во всех случаях следует проводить минимально эффективными дозами препарата.

В действующих рекомендациях по лечению бронхиальной астмы указано на необходимость применять длительно действующие бета2-адреномиметики для поддерживающей бронходилатирующей терапии в дополнение к терапии глюкокортикостероидами. Кроме того, в них рекомендуется в случае приступа бронхиальной астмы применять короткодействующие бета2-адреномиметики.

Следует рекомендовать пациентам на период включения в схему лечения Формотерола Изилайер не прерывать прием и не изменять схему лечения глюкокортикостероидами, даже если симптомы бронхиальной астмы уменьшились.

Если симптомы заболевания сохраняются или усиливаются, либо если рекомендуемые дозы Формотерола Изилайер не позволяют их контролировать (обостряется хроническая приступов), такое состояние обычно является свидетельством ухудшения течения бронхиальной астмы и необходимости пересмотра схемы лечения.

Частая потребность в лекарственных препаратах (т.е. профилактический прием, например, глюкокортикостероидов и бета2-адреномиметиков пролонгированного действия) для предотвращения бронхоспазма при физических нагрузках несколько раз в неделю, несмотря на адекватную поддерживающую терапию, может быть признаком недостаточного контроля симптомов астмы и требует пересмотра противовоспалительного лечения и оценки его соответствия.

При переводе пациентов на терапию ингалятором Формотерол Изилайер с других ингаляторов схему лечения следует подбирать индивидуально. При этом следует учитывать особенности ранее применявшегося препарата, схемы лечения, способы применения лекарственного вещества. У пациентов с циррозом печени лечение оксидом увеличение экскреции, т.к. формотерол первоначально элиминируется посредством печеночного метаболизма.

Ингалятор Изилайер управляется потоком воздуха, образующимся на вдохе, что означает, что, когда пациент вдыхает воздух через мундштук, лекарственное вещество поступает в дыхательные пути вместе с вдыхаемым воздухом.

Примечание: заранее обучите пациента вдыхать через мундштук достаточно активно и глубоко, чтобы обеспечить поступление в ткань бронхов оптимальной дозы препарата.

Если пациенту требуется регулярный прием пролонгированных бета2-адреномиметиков, ему следует также регулярно и в достаточных дозах получать систематическое противовоспалительное лечение (ингаляционные или пероральные глюкокортикостероиды). Формотерол Изилайер следует использовать только у пациентов, которым требуется длительная терапия бронхорасширяющими препаратами.

В случае приступа бронхиальной астмы рекомендуется применять короткодействующие бета2-адреномиметики. При назначении препарата необходимо оценить, достаточно ли активность проводимой пациенту противовоспалительной терапии.

Во время обострения течения бронхиальной астмы терапию ингалятором начинать не следует.
Следует соблюдать осторожность при одновременном применении Формотерола Изилайера и теофиллина пациентам с заболеваниями сердца.

Учитывая способность бета2-адреномиметиков вызывать гипергликемию, у больных сахарным диабетом рекомендуется проводить дополнительный контроль концентрации глюкозы в крови.

При терапии бета2-адреномиметиками может развиваться опасная для жизни гипокалиемия. Особую осторожность рекомендуется проявлять при тяжелых обострениях бронхиальной астмы, поскольку риск развития гипокалиемии при этом увеличивается на фоне развивающейся гипоксии. Гипокалиемическое действие может усиливаться при одновременном проведении терапии производными скатинной, глюкокортикостероидами и диуретиками. В этих случаях рекомендуется проводить контроль концентрации калия в сыворотке крови.

Как и при других видах ингаляционной терапии, не следует забывать о риске развития парадоксального бронхоспазма. Если таковой бронхоспазм развивается, прием препарата следует немедленно прекратить, заменив его на какой-либо альтернативный метод лечения.

Каждая доза Формотерола Изилайер содержит около 8 мг лактозы. Обычно такое количество лактозы у лиц, страдающих непереносимостью лактозы, не вызывает клинических проявлений.

Препарат не следует применять лицам с дефицитом лактазы, непереносимостью лактозы и глюкозо-галактозной мальабсорбцией.

Внимание на способность управлять транспортными средствами и другими механизмами

Тремор или треморность, возникающие во время лечения бета-адреностимуляторами, могут влиять на способность пациента управлять автомобилем.

ФОРМА ВЫПУСКА

Порошок для ингаляции дозированный 12 мкг – 120 доз. По 1,7 г порошка препарата помещают в ингалятор из полимерного материала. Каждый ингалятор, герметично упакованный в пакет из фольги и алюминиевой ламинированной, вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ

Хранить при температуре не выше 30°C, в сухом, недоступном для детей месте.

СРОК ГОДНОСТИ

2 года.
После вскрытия алюминиевого пакета использовать в течение 4 месяцев.

Не использовать после срока годности, указанного на упаковке.

УСЛОВИЯ ОТПУСКА ИЗ АПТЕК

По рецепту.

ПРОИЗВОДИТЕЛЬ:

«Орион Корпорейшн ОРИОН ФАРМА»
02200 Эспоо, Финляндия.

ООО «Орион Фарма»
119034, г. Москва, Сеченовский пер., д.6, стр.3
тел.: (495) 363-50-73
факс: (495) 363-50-74

Фасовщик (вторичная упаковка) и выпускающий контроль.

ООО «Фармакор Продакшн»

Адрес юридический:
194021, Россия, г. Санкт-Петербург, 2-й Муринский проспект, д.41, лит.А
Адрес производства:
198216, Россия, г. Санкт-Петербург, Ленинский пр., д.140, лит.Ж.
Факс: (812) 325-23-15
www.pharmacor.ru

Претензии потребителей просьба направлять в адрес ООО «Орион Фарма»

При факсове препарата на ООО «Фармакор Продакшн» претензии направлять в адрес ООО «Фармакор Продакшн».

ИНСТРУКЦИИ ПО ЭКСПЛУАТАЦИИ ИНГАЛЯТОРА И ПРИМЕНЕНИЮ ПРЕПАРАТА

«Базулет» (Изилайер) – ингалятор, приводимый в действие потоком выдыхаемого воздуха; это означает, что, когда делается вдох через мундштук, лекарственное средство вместе с потоком воздуха попадает в дыхательные пути.
Внимательно ознакомьтесь с инструкцией по использованию ингалятора!



1 Снимите защитный колпачок с мундштука Изилайера



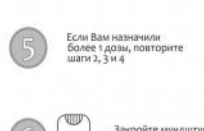
2 Встряхните ингалятор 3–5 раз в вертикальном положении



3 НАЖАТЬ
Для высвобождения 1 дозы лекарства поместите Изилайер между большим и указательным пальцами и одновременно нажмите на ингалятор – Вы услышите щелчок



4 Сделайте полный выдох, плотно обхватите мундштук губами и глубоко вдохните, задержите дыхание на 5–10 секунд



5 Если Вам назначили более 1 дозы, повторите шаги 3, 3 и 4



6 Закройте мундштук Изилайера защитным колпачком



7 Счетчик доз поможет Вам узнать количество оставшихся доз лекарства. Счетчик переключается через каждые 5 доз. Красная зона на счетчике означает, что в Вашем Изилайере осталось 20 доз

Ингалятор рекомендуется хранить в жестком футляре, чтобы защитить его от ударов и обеспечить надежную работу устройства.

Нельзя делать выдох через мундштук, так как это приведет к уменьшению получаемой дозы препарата.

Если пациент непреднамеренно сделал выдох через мундштук, необходимо постучать ингалятором по твердой поверхности или по ладони руки, чтобы извлечь порошок из мундштука, а затем повторить процедуру приема препарата. Таким же образом необходимо поступать в случае, если пациент непреднамеренно включил ингалятор без последующего проведения ингаляции.

После использования ингалятора необходимо всегда надевать на него защитный колпачок во избежание случайного включения устройства, что может привести либо к передозировке, либо к уменьшению дозы при очередном использовании ингалятора.

Мундштук нужно регулярно протирать сухой тканью. Для его очистки нельзя применять воду, поскольку находящийся внутри порошок гигроскопичен.

Всякий раз, когда счетчик показывает ноль, необходима замена препарата, несмотря на то, что внутри ингалятора при этом может оставаться порошок.