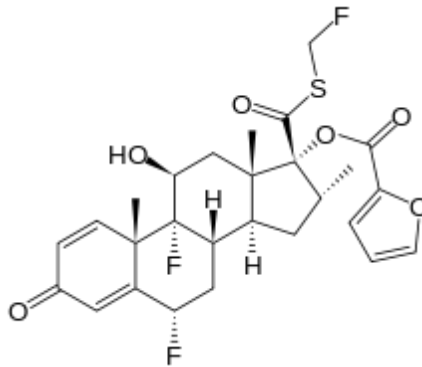


ยานำรู้

Fluticasone furoate

บิตชนก พัฒนจินตกุล ภ.บ.*

สูตรโครงสร้าง



ชื่อยา (Generic name)

ชื่อสามัญ (Generic name)

Fluticasone furoate

สามารถกำหนดปริมาณยาได้ (50 ไมโครลิตร)
ในแต่ละครั้งของการพ่นจะให้ตัวยา fluticasone
furoate (micronized) ประมาณ 27.5 ไมโครกรัม

ชื่อการค้า (Trade name)

Avamys®

ข้อบ่งใช้ (Indication)

ผู้ใหญ่และเด็ก (อายุมากกว่า 12 ปีขึ้นไป)

สำหรับรักษาอาการผิดปกติทางจมูก

(น้ำมูกไหล คัดจมูก คันจมูก และจาม) และอาการ
ผิดปกติทางตา (คันหรือแสบตา น้ำตาไหล และ
ตาแดง) จากโรคเยื่อบุจมูกอักเสบจากภูมิแพ้ชนิด
เป็นเฉพาะฤดูกาล (Seasonal allergic rhinitis :
SAR) และสำหรับรักษาอาการผิดปกติทางจมูก
จากโรคเยื่อบุจมูกอักเสบจากภูมิแพ้ชนิดเป็น
ตลอดทั้งปี (Perennial allergic rhinitis : PAR)

ประเภทของยา (Therapeutic category)

Intranasal corticosteroid

รูปแบบของยา (Dosage form)

ยาน้ำแขวนตะกอนสีขาว สำหรับพ่นจมูก
บรรจุในขวดแก้วสีชาที่มีอุปกรณ์พ่น ทำให้

* กลุ่มงานเภสัชกรรม โรงพยาบาลพระปกเกล้า จังหวัดจันทบุรี

เด็ก (อายุ 2-11 ปี)

สำหรับรักษาอาการผิดปกติทางจมูก จากโรคเยื่อบุจมูกอักเสบจากภูมิแพ้ชนิดเป็นเฉพาะฤดูกาล (Seasonal allergic rhinitis : SAR) และภูมิแพ้ชนิดเป็นตลอดทั้งปี (Perennial allergic rhinitis : PAR)

การออกฤทธิ์ (Pharmacological action)

Fluticasone furoate เป็นสารสังเคราะห์ trifluorinated corticosteroid ซึ่งมีคุณสมบัติในการจับกับ glucocorticoid receptor ได้สูงมาก และมีฤทธิ์แรงในการต้านการอักเสบเฉพาะที่ที่เยื่อบุจมูก โดยไม่พบผลทาง systemic activity

เภสัชจลนศาสตร์ (Pharmacokinetics)

การดูดซึม

Fluticasone furoate ส่วนใหญ่ผ่าน first-pass metabolism ในตับและทางเดินอาหาร การดูดซึมยาเกิดไม่สมบูรณ์ ทำให้พบปริมาณยาในร่างกายเพียงเล็กน้อยเท่านั้น การให้ยาทางจมูกในขนาด 110 ไมโครกรัม วันละครั้ง ไม่สามารถตรวจหาปริมาณยาในพลาสมาได้ (น้อยกว่า 10 พิโคกรัม/มิลลิลิตร) ค่าชีวประสิทธิผลสัมบูรณ์ (absolute bioavailability) ของ fluticasone furoate เมื่อให้ยาในปริมาณ 880 ไมโครกรัม วันละ 3 ครั้ง (ขนาดยารวมทั้งหมดต่อวันเท่ากับ 2,640 ไมโครกรัม) เท่ากับ ร้อยละ 0.50

การกระจายยา

การจับกับโปรตีนในพลาสมาของ fluticasone furoate มีมากกว่าร้อยละ 99 fluticasone furoate สามารถกระจายตัวได้สูง โดยมีค่าปริมาตรการกระจายตัวที่ steady state ประมาณ 608 ลิตร

การเปลี่ยนแปลงยา

Fluticasone furoate ถูกขจัดอย่างรวดเร็ว (ค่า total plasma clearance เท่ากับ 58.7 ลิตร/ชั่วโมง)จากระบบหมุนเวียนในร่างกาย โดยส่วนใหญ่ถูกเปลี่ยนแปลงที่ตับ

การขจัดยา

หลังการให้ยาโดยการรับประทานและทางหลอดเลือดดำ พบว่าในเบื้องต้นยาจะถูกขจัดออกทางอุจจาระ ซึ่งชี้ให้เห็นว่ามีการขับ fluticasone furoate และเมตาบอไลต์ของยาผ่านทางน้ำดี หลังการให้ยาทางหลอดเลือดดำ ค่าครึ่งชีวิตของการขจัดยาโดยเฉลี่ยเท่ากับ 15.1 ชั่วโมง การขับออกทางปัสสาวะประมาณร้อยละ 1 และร้อยละ 2 เมื่อให้ยาโดยการรับประทานและทางหลอดเลือดดำตามลำดับ

ขนาดยา (Dose)

ใช้สำหรับพ่นเข้าทางจมูกเท่านั้น เพื่อให้ผู้ป่วยได้รับประโยชน์จากการใช้ยาอย่างเต็มที่ แนะนำให้ใช้ยาตามกำหนดอย่างสม่ำเสมอ มีรายงานระยะเวลาการออกฤทธิ์เกิดขึ้นได้ภายใน 8 ชั่วโมงหลังจากให้ยาครั้งแรก และอาจต้องใช้เวลาหลายวันกว่าจะเห็นผลจากการรักษาอย่างเต็มที่

ผู้ใหญ่หรือเด็กอายุ 12 ปี ขึ้นไป

ขนาดยาเริ่มต้นที่แนะนำ คือ พ่นจมูกข้างละ 2 ที (27.5 ไมโครกรัมต่อการพ่น 1 ที) วันละครั้ง (ขนาดยาที่ได้รับทั้งหมดต่อวันเท่ากับ 110 ไมโครกรัม) เมื่อสามารถควบคุมอาการได้แล้ว อาจลดขนาดยาลงเหลือพ่นจมูกข้างละ 1 ที วันละครั้ง (ขนาดยาที่ได้รับทั้งหมดต่อวันเท่ากับ 55 ไมโครกรัม) สำหรับการควบคุมอาการ

เด็กอายุ 2 ถึง 11 ปี

ขนาดยาเริ่มต้นที่แนะนำ คือ ฟนจมุข้างละ 1 ที (27.5 ไมโครกรัมต่อการพ่น 1 ที) วันละครั้ง (ขนาดยาที่ได้รับทั้งหมดต่อวันเท่ากับ 55 ไมโครกรัม)

ผู้ป่วยที่ใช้ยาฟนจมุข้างละ 1 ที วันละครั้ง (ขนาดยาที่ได้รับทั้งหมดต่อวันเท่ากับ 55 ไมโครกรัม) แล้วไม่ได้ผล อาจเพิ่มขนาดยาเป็น ฟนจมุข้างละ 2 ที วันละครั้ง (ขนาดยาที่ได้รับทั้งหมดต่อวันเท่ากับ 110 ไมโครกรัม) เมื่อสามารถควบคุมอาการได้แล้ว แนะนำให้ลดขนาดการให้ยาลงเหลือฟนจมุข้างละ 1 ที วันละครั้ง (ขนาดยาที่ได้รับทั้งหมดต่อวันเท่ากับ 55 ไมโครกรัม)

เด็กอายุต่ำกว่า 2 ปี

ยังไม่มีข้อมูลที่จะแนะนำให้ใช้ยานี้

ผู้สูงอายุ

ไม่จำเป็นต้องปรับขนาดยา

ผู้ป่วยที่ไตทำงานบกพร่อง

ไม่จำเป็นต้องปรับขนาดยา

ผู้ป่วยที่ตับทำงานบกพร่อง

ไม่จำเป็นต้องปรับขนาดยาในผู้ป่วยที่ตับทำงานบกพร่องเล็กน้อยถึงปานกลาง ยังไม่มีข้อมูลในผู้ป่วยที่ตับทำงานบกพร่องอย่างรุนแรง

สตรีมีครรภ์และสตรีระยะให้นมบุตร

ยังไม่มีข้อมูลเพียงพอเกี่ยวกับการใช้ยาในสตรีมีครรภ์และสตรีระยะให้นมบุตร ยังไม่มีการศึกษาถึงการส่งผ่านของ Fluticasone furoate ไปยังน้ำนมมารดา ควรใช้เฉพาะในกรณีที่พิจารณาแล้วเห็นว่าประโยชน์ที่คาดว่าจะได้รับนั้นมากกว่าอันตรายที่อาจเกิดขึ้นกับทารกในครรภ์

Pregnancy risk factor

Category C

ข้อห้ามใช้ (Contraindication)

ห้ามใช้ในผู้ป่วยที่แพ้ต่อส่วนประกอบใดๆ ของตำรับยานี้

คำเตือน / ข้อควรระวัง (Warning / Precaution)

ควรระมัดระวังการใช้ยาในผู้ป่วยโรคตับขั้นรุนแรง ไม่แนะนำให้ใช้ยานี้ร่วมกับ Ritonavir (enzyme inhibitor) เนื่องจากมีความเสี่ยงสูงที่จะทำให้ระดับของยา Fluticasone furoate ในเลือดเพิ่มสูงขึ้นได้

อาการข้างเคียงของยา (Side effect)

1. ความผิดปกติของระบบหายใจ ออก และเยื่อชั้นช่องอก (Respiratory, thoracic and mediastinal disorders)

พบบ่อยมาก (very common) : เลือดกำเดาไหล (Epistaxis)

พบบ่อย (common) : เกิดแผลในจมูก (Nasal ulceration)

2. ความผิดปกติของระบบประสาท (Nervous system disorders)

พบบ่อย (common) : ปวดศีรษะ (Headache)

3. ความผิดปกติของระบบภูมิคุ้มกัน (Immune system disorders)

พบน้อย (rare) : ปฏิกิริยาภูมิไวเกิน (Hypersensitivity) รวมถึง Anaphylaxis, Angioedema, Rash และ Urticaria

การได้รับยาเกินขนาด (Overdose)

จากการศึกษาชีวประสิทธิผล (Bioavailability) โดยการให้ยาทางจมูกในขนาดสูงถึง 24 เท่าของขนาดยาที่แนะนำต่อวันในผู้ใหญ่เป็นเวลา 3 วัน ไม่พบอาการไม่พึงประสงค์ใดๆ

ขนาดบรรจุของยา

120 doses

การเก็บรักษา (Storage)

เก็บในที่อุณหภูมิไม่เกิน 30 ห้ามเก็บยาไว้ในตู้เย็นหรือแช่แข็ง

อายุของยา (Shelf life)

3 ปี ส่วนอายุของยาหลังจากเปิดขวดใช้ครั้งแรกเท่ากับ 2 เดือน

การศึกษาทางคลินิก (Clinical trial)

โรคเยื่อบุจมูกอักเสบจากภูมิแพ้ที่เป็นเฉพาะฤดูกาลในผู้ใหญ่และวัยรุ่น

การให้ Fluticasone furoate ฟ่นจมูกในขนาด 110 ไมโครกรัม วันละครั้ง มีผลทำให้การดำเนินชีวิตประจำวันของผู้ป่วยดีขึ้น การวัดคะแนนโดยรวมของอาการผิดปกติทางจมูก (rTNSS : ประกอบด้วย น้ำมูกไหล คัดจมูก จาม และคันจมูก) และคะแนนรวมของอาการผิดปกติทางตา (rTOSS : ประกอบไปด้วยอาการคันตา แสบตา น้ำตาไหล และตาแดง) ให้ผลดีขึ้นอย่างมีนัยสำคัญเมื่อเปรียบเทียบกับยาหลอก อาการที่ดีขึ้นของทั้งจมูกและตานั้นมีผลจนครบ 24 ชั่วโมงเต็มหลังจากได้รับยารวันละครั้ง

ผลของการรับรู้ของผู้ป่วยที่ตอบสนองต่อ

การรักษาโดยรวมนั้น ผู้ป่วยพอใจกับ Fluticasone furoate ฟ่นจมูกในขนาด 110 ไมโครกรัม มากกว่ายาหลอก โดยมีความแตกต่างทางการรักษาอย่างมีนัยสำคัญทางสถิติ ระยะเวลาการออกฤทธิ์เกิดขึ้นได้ภายในประมาณ 8 ชั่วโมงหลังได้รับยาครั้งแรก อาการของผู้ป่วยดีขึ้นอย่างมีนัยสำคัญในช่วง 24 ชั่วโมงแรก และดีขึ้นอย่างต่อเนื่องเป็นเวลาหลายวัน คุณภาพชีวิตของผู้ป่วยดีขึ้นจาก baseline อย่างมีนัยสำคัญ (Minimum Important Difference ในทุกการศึกษา = ค่าที่ดีขึ้นกว่ายาหลอกอย่างน้อย -0.5 ; ค่าความแตกต่างของการรักษา -0.690 , $p < 0.001$, 95%CI -0.84 , -0.54) โรคเยื่อบุจมูกอักเสบจากภูมิแพ้ชนิดเป็นตลอดทั้งปีในผู้ใหญ่และวัยรุ่น

Fluticasone furoate ฟ่นจมูกในขนาด 110 ไมโครกรัม วันละครั้ง ส่งผลให้มี daily rTNSS ดีขึ้นอย่างมีนัยสำคัญ (ค่าความแตกต่างของการรักษา = -0.706 , $p = 0.005$, 95%CI -1.20 , -0.21) อาการที่ดีขึ้นนี้ จะยังคงอยู่เป็นเวลา 24 ชั่วโมงเต็มหลังการให้ยา ผลของการรับรู้ของผู้ป่วยที่ตอบสนองต่อการรักษาโดยรวมดีขึ้นอย่างมีนัยสำคัญเมื่อเปรียบเทียบกับยาหลอก

บรรณานุกรม

1. Berger WE, Godfrey JW, Slater AL. Intranasal corticosteroids: the development of a drug delivery device for fluticasone furoate as a potential step toward improved compliance. Expert Opin Drug Deliv 2007; 4: 689-701.
2. Meltzer EO, Stahlman JE, Leflein J, Meltzer S, Lim J, Dalal AA, et al. Prefer-

ences of adult patients with allergic rhinitis for the sensory attributes of fluticasone furoate versus fluticasone propionate nasal sprays: a randomized, multicenter, double-blind, single-dose crossover study. Clin Ther 2008; 30: 271-9.

3. McCormack PL, Scott LJ. Fluticasone Furoate: Intranasal Use in Allergic Rhinitis. Drugs 2007; 67: 1905-15.
4. Scadding GK, Keith PK, et al. Fluticasone furoate nasal spray consistently and significantly improves both the nasal and ocular symptoms of seasonal allergic rhinitis: a review of the clinical data. Expert Opin Pharmacother 2008; 9: 2707-15.