Состав

действующее вещество: budesonid;

1 доза содержит 50 мкг или 200 мкг будесонида микронизированного;

вспомогательные вещества: кислота олеиновая, этанол, 1,1,1,2-тетрафторэтан (HFA-134a).

Лекарственная форма

Ингаляция под давлением, суспензия.

Основные физико-химические свойства:

на выпуск: для дозирования 200 мкг / доза белая суспензия с типичным запахом и вкусом.

В течение срока годности: для обеих дозировок: белая суспензия.

Фармакотерапевтическая группа

Ингаляционные средства, применяемые для лечения обструктивных заболеваний дыхательных путей. Глюкокортикоиды. Код АТХ R03B A02.

Фармакодинамика

Будесонид - это активный синтетический глюкокортикоид, применяется для лечения аллергических и воспалительных заболеваний дыхательных путей. Проявляет незначительную минералокортикостероидну активность. Относится к препаратам пролонгированного действия с возможностью однократного дозирования. Будесонид характеризуется местным противовоспалительным действием за счет высокой липофильности и способности проникать внутриклеточно, связываться с ГКС рецепторами.

Механизм действия будесонида заключается в образовании комплексов с ГКС рецепторами цитоплазмы. Гормонрецепторни комплексы проникают в ядра клеток-мишеней (эозинофилы, нейтрофилы, лимфоциты), связываются с ДНК и активируют гены, которые отвечают за продукцию липокортина. Липокортинов является ингибитором фосфолипазы А2 - фермента, угнетает синтез медиаторов воспаления: гистамина, лейкотриенов, цитокинов.

В тканях дыхательных путей будесонид образует конъюгаты с эфирами жирных кислот, которые накапливаются в клетках. Когда концентрация будесонида в клетках уменьшается, стероидные эфиры жирных кислот разрушаются под воздействием липазы. Будесонид, что освободился, способен образовывать гормонрецепторни комплексы, которые обусловливают развитие противовоспалительного действия препарата. Способность будесонида образовывать конъюгаты с жирными кислотами объясняет механизм местной противовоспалительной активности замедленного типа и высокий уровень терапевтической эффективности препарата.

Препарат имеет большее сродство с ГКС рецепторами бронхов по сравнению с беклометазона пропионата, соответственно имеет более высокую местное противовоспалительное и противоаллергическое активность. Значительное улучшение показателей функции внешнего дыхания отмечается через несколько дней (7-10 дней) от начала лечения. Будесонид не влияет на гладкую мускулатуру бронхов.

Препарат уменьшает гиперреактивность бронхов, подавляет раннюю фазу аллергической реакции (после достаточно длительного применения) и позднюю фазу реакции, таким образом предупреждая приступы астмы. Будесонид также уменьшает бронхоспазм, вызванный физическим усилиям, холодным воздухом или серным ангидридом.

Фармакокинетика

Препарат быстро абсорбируется после ингаляционного применения. 34% дозы осаждается в легких. Абсолютная системная доступность составляет 39% введенной дозы. Максимальные концентрации будесонида в плазме крови достигается через 30 мин после ингаляции. Объем распределения составляет

примерно 2-3 л / кг. Метаболизм большей части будесонида (около 90%) происходит в печени при участии фермента CYP3A4, в результате чего образуются метаболиты с низкой глюкокортикостероидной активностью.

Глюкокортикостероидная активность основных метаболитов 6-бета-гидроксибудесонид и 16-альфа-гидроксибудесонид составляет менее 1% по сравнению с активным веществом. Примерно 90% дозы переходит в неактивное состояние уже во время первого прохождения через печень. Метаболизм в легких незначительный. У взрослых период полувыведения из плазмы составляет в среднем 2 часа, у детей - 1,5 часа. Связывание будесонида с белками плазмы крови колеблется от 85 до 90%. Выводится с мочой (70%) и желчью. Поскольку основное действие будесонида происходит в дыхательных путях, нет данных о связи между концентрацией в плазме и эффективностью его действия.

Показания

Бронхиальная астма.

Противопоказания

Гиперчувствительность к любому из компонентов препарата.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Метаболизм будесонида происходит преимущественно с участием CYP3A4, в результате чего ингибиторы этого фермента, например, кетоконазол и итраконазол, могут повышать системную экспозицию будесонида (см. Разделы «Особенности применения» и «Фармакологические свойства»). Поскольку данные по дозировке отсутствуют, рекомендуется избегать совместного применения этих препаратов.

Если это невозможно, интервал между применением этих лекарственных средств должно быть как можно длиннее. Следует также учитывать возможность снижения дозы будесонида. Существует вероятность, что другие мощные ингибиторы CYP3A4 также приводят к существенному повышению уровня будесонида в плазме.

Ограниченные данные по подобного взаимодействия с высокими дозами ингаляционного будесонида показывают, что при одновременном применении итраконазола в дозе 200 мг один раз в сутки введение ингаляционного будесонида (разовая доза 1000 мкг) приводит к существенному повышению концентрации вещества в плазме крови (в среднем в 4 раза) .

У женщин, которые одновременно принимали эстрогены или гормональные контрацептивы, повышалась концентрация будесонида в плазме крови и усиливался эффект кортикостероидов, однако при применении будесонида вместе с низкими дозами комбинированных пероральных контрацептивов этот эффект отсутствовал.

Циметидин имеет нерезко выраженный угнетающее влияние на печеночный метаболизм будесонида, однако это явление не имеет клинического значения.

Из-за возможного угнетения функции надпочечников тест со стимуляцией АКТГ (адено- кортикотропного гормона) для диагностики гипофизарной недостаточности может давать ошибочные результаты (низкие значения).

Дети

Исследование взаимодействия проводилось только с участием взрослых.

Особенности применения

Препарат следует с осторожностью применять пациентам с активной или неактивной формой туберкулеза легких и грибковыми или вирусными инфекциями дыхательных путей.

Пациенты без зависимости от стероидов. Терапевтический эффект обычно достигается в течение 10 дней. Пациентам с избыточной продукцией слизистого секрета в бронхах начала можно применять кратковременный (около 2 недель) дополнительный курс пероральных кортикостероидов. После курса пероральных

препаратов достаточным лечением может быть применение будесонида в качестве монотерапии.

Пациенты с зависимостью от стероидов. Начинать переход с пероральных стероидов на будесонид можно, когда пациент находится в относительно стабильной фазе заболевания. В таких случаях примерно в течение 10 дней будесонид используют в комбинации с пероральным стероид в дозе, применявшейся ранее.

После этого дозу пероральных стероидов следует постепенно уменьшать (например, на 2,5 мг преднизолона или эквивалента ежемесячно), пока не будет достигнуто низкой возможной дозы. Во многих случаях возможно полное замещение пероральных стероидов будесонидом.

При переходе с терапии пероральными стероидами на будесонид в большинстве случаев наблюдается уменьшение системного действия кортикостероидов, что может привести к появлению симптомов аллергии или артрита, таких как ринит, экзема и мышечно-суставной боли. При этих состояниях необходимо назначить специфическое лечение. В редких случаях возможны такие симптомы, как усталость, головная боль, тошнота, рвота, указывающие на системную недостаточность ГКС. В таких случаях иногда может потребоваться временное повышение дозы перорального стероида.

Как и в случаях с другими видами ингаляционной терапии, непосредственно после применения дозы может возникнуть парадоксальный бронхоспазм. Если возникают тяжелые реакции, следует сделать переоценку лечения и, при необходимости, начать альтернативную терапию.

У пациентов, которым была необходима неотложная терапия кортикостероидами в высоких дозах или длительное лечение ингаляционными кортикостероидами в самой рекомендуемой дозе, также существует риск развития нарушения функции надпочечников. У этих пациентов в случае тяжелого стресса могут возникать симптомы надпочечниковой недостаточности. В стрессовых ситуациях или на период планового оперативного вмешательства можно назначить

дополнительную системную ГКС.

При применении любого ингаляционного ГКС могут возникать системные эффекты, особенно при назначении высоких доз в течение длительного периода. Вероятность возникновения таких эффектов значительно меньше при применении ингаляционных кортикостероидов, чем пероральных. Возможны системные эффекты включают синдром Иценко-Кушинга, кушингоидные черты, угнетение функции надпочечников, задержку роста у детей, снижение минеральной плотности костей, катаракту и глаукому, реже - ряд психологических и поведенческих расстройств, в том числе психомоторную гиперактивность, нарушения сна, беспокойство, депрессию или проявления агрессии (особенно у детей). Поэтому дозу ингаляционных кортикостероидов следует титровать до минимальной эффективной дозы, при которой сохраняется эффективный контроль бронхиальной астмы.

Будесонид не предназначен для быстрого устранения острых эпизодов бронхиальной астмы, требующих применения ингаляционных бронходилататоров короткого действия. Если у пациента лечение бронходилататоры короткого действия неэффективное или если они нуждаются в большем количестве ингаляций, чем обычно, необходимо медицинское вмешательство. В такой ситуации следует рассмотреть вопрос усиления обычной терапии, например, за счет увеличения дозы ингаляционного будесонида или добавления бета-агониста длительного действия или назначения курса пероральных ГКС.

Снижение функции печени может влиять на вывод ГКС из организма, поскольку уменьшается клиренс и увеличивается системная экспозиция. Необходимо учитывать о возможном развитии побочных эффектов.

У пациентов, принимающих высокие дозы экстренной кортикостероидов, или при длительном лечении максимальной рекомендуемой дозой ингаляционных кортикостероидов может повышаться риск нарушения функции надпочечников. У таких пациентов при сильном стрессе возможно возникновение признаков и симптомов недостаточности надпочечников.

Нужно рассмотреть необходимость дополнительного применения системных кортикостероидов в периоды стресса или при плановой операции. Эти пациенты должны быть проинструктированы о необходимости носить с собой карту, в которой указано, что им может понадобиться стероид. Лечение дополнительными системными стероидами или лекарственным средством Будесонид-Интел не следует прекращать внезапно.

Однако плазменный клиренс после введения будесонида был одинаков у пациентов с циррозом печени и у здоровых добровольцев. После приема системная биодоступность будесонида росла вследствие нарушения функции печени за счет снижения пресистемного метаболизма. Клиническое значение этих изменений для лечения будесонидом окончательно не выяснено, поскольку данные по ингаляционного препарата отсутствуют, но можно ожидать повышения уровня в плазме, а следовательно, и повышение риска системных побочных эффектов.

Известно показали, что пероральный прием кетоконазола и итраконазола (известных ингибиторов активности CYP3A4 в печени и слизистой оболочке кишечника) приводит к росту системной экспозиции будесонида. Следует избегать совместного лечения кетоконазолом, итраконазолом, ингибиторами протеазы ВИЧ или другими мощными ингибиторами CYP3A4. Если это невозможно, интервал между применением этих лекарственных средств должно быть как можно длиннее. Также следует рассмотреть возможность снижения дозы будесонида (см. Раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»).

На фоне лечения ингаляционными ГКС может развиваться кандидоз ротовой полости. Эта инфекция может потребовать применения соответствующих противогрибковых препаратов, а для некоторых пациентов может возникнуть необходимость прекращения лечения (см. Также раздел «Способ применения и дозы»).

При применении ингаляционных стероидов пациентам следует промывать ротовую полость водой после каждого введения дозы обусловлено риском инфицирования ротовой части глотки грибковой микрофлорой.

Предупреждение: прием будесонида спортсменами может дать положительный результат анализа на допинг.

Дети

Влияние на рост

У детей, которые в течение длительного времени лечатся ингаляционными кортикостероидами, рекомендуется регулярный мониторинг роста. Если рост замедляется, терапию следует пересмотреть с целью снижения дозы ингаляционного ГКС до самой низкой возможной дозы, при которой сохраняется эффективный контроль бронхиальной астмы. Пользу от терапии кортикостероидами следует тщательно взвесить с учетом возможного риска угнетения роста. Кроме того, важно направить пациента на консультацию к детскому пульмонологу.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

Будесонид не влияет на скорость реакции при управлении автотранспортом и работе с механизмами.

Применение в период беременности или кормления грудью

Беременность

Применение будесонида во время беременности требует тщательного взвешивания пользы для женщины по сравнению с риском для плода. Ингаляционные глюкокортикостероиды следует отдавать предпочтение над пероральными ГКС учитывая меньшую выраженность системных эффектов при применении в дозах, необходимых для достижения одинакового эффекта со стороны органов дыхания.

Период кормления грудью

Будесонид проникает в грудное молоко. Однако при применении терапевтических доз будесонида не ожидается никакого влияния на ребенка,

находящегося на грудном кормлении. Будесонид можно применять во время кормления грудью.

Поддерживающее лечение ингаляционным будесонидом (200 или 400 мкг два раза в сутки) у женщин с бронхиальной астмой, которые кормят грудью, приводит лишь к незначительному системной экспозиции будесонида у детей, находящихся на грудном вскармливании.

Принимая во внимание сведения о будесонид для ингаляционного введения и тот факт, что будесонид демонстрирует линейные ФК-свойства в пределах интервалов терапевтических доз после назального, ингаляционного, перорального или ректального введения, ожидается, что у детей, которых кормят грудью, экспозиция будесонида при применении в терапевтических дозах будет низкой.

Способ применения и дозы

Применяется только в виде ингаляций.

Дети в возрасте от 5 до 12 лет: 200-800 мкг ежедневно, в 2-4 приема.

Взрослые (включая пациентов пожилого возраста) и дети старше 12 лет: 200-1600 мкг ежедневно, в 2-4 приема.

После достижения желаемого клинического эффекта поддерживающая доза должна быть постепенно снижена до минимальной дозы, необходимой для контроля симптомов.

После каждой ингаляции пациент должен прополоскать рот водой.

Указания по правильному использованию:

Перед использованием аэрозоля необходимо проверить срок годности препарата. Если ингалятор новый или использовался в течение нескольких дней, необходимо хорошо встряхнуть его и выпустить одну дозу в воздух, чтобы убедиться, что он работает.

1. Снять крышку с дозатора.

2. Держать ингалятор вертикально.

3. Встряхнуть ингалятор в течение 20 секунд.

4. Прижать губы к дозатору и полностью вдохнуть.

5. Нажать на аэрозольный контейнер, одновременно сделав глубокий вдох ртом.

6.После вдоха задержать дыхание для максимального проникновения препарата.

7. Если необходимо, продолжить несколько секунд и повторить процедуру снова.

8. Закрыть крышкой после применения.

Пластиковый адаптер необходимо регулярно чистить. Для очистки достать металлический контейнер и промыть адаптер в теплой (не горячей) воде с мылом.

Тщательно сполоснуть, высушить адаптер и собрать устройство. После сбора закрыть крышкой.

Дети

Препарат противопоказан детям в возрасте до 5 лет.

Передозировка

При длительном применении высоких доз могут возникнуть такие системные эффекты ГКС, как гиперкортицизм (отеки, припухлость лица) и угнетение гипоталамо-гипофизарно-надпочечниковой системы. Электролитный дисбаланс должен быть устранен посредством применения диуретиков, которые не влияют на калий, такие как спиронолактон и триамтерен.

Побочные реакции

Частота побочных эффектов представлена ниже согласно следующим критериям: очень часто (≥1 / 10); часто (от ≥1 / 100 до <1/10); нечасто (от ≥1 / 1000 до <1/100); редко (от ≥1 / 10000 до <1/1 000) очень редко (<1/10 000).

Инфекционные и паразитарные заболевания

Часто: орофарингеальный кандидоз.

Редко: пневмония (у больных с ХОБЛ (хронические обструктивные заболевания легких)).

Со стороны иммунной системы.

Редко: реакции гиперчувствительности немедленного и отсроченного типа (в том числе сыпь, контактный дерматит, крапивница, ангионевротический отек и анафилактическая реакция).

Со стороны эндокринной системы.

Редко: признаки и симптомы системных эффектов ГКС, в том числе угнетение функции надпочечников и задержка роста *.

Со стороны психики.

Редко: психомоторная гиперактивность, нарушения сна, агрессивность, раздражительность, психоз, изменение поведения (преимущественно у детей).

Нечасто: беспокойство, депрессия.

Со стороны нервной системы

Нечасто: тремор **.

Со стороны органов зрения

Нечасто: катаракта.

Неизвестно: глаукома.

Со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения

Часто: кашель, охриплость, першение в горле.

Редко: дисфония, бронхоспазм, охриплость ***.

Со стороны кожи и подкожной клетчатки.

Редко: синяки.

Со стороны костно-мышечной системы и соединительной ткани

Неизвестно: спазмы мышц.

* См. ниже раздел «Дети»;

** на основе периодичности, о которой сообщали клинические испытания;

*** изредка у детей.

Описание отдельных побочных реакций

Кандидоз в ротоглотке возникает вследствие отложения лекарственного средства. Ополаскивания полости рта водой после каждой ингаляции минимизирует этот риск.

Как и при любой ингаляционной терапии, очень редко возможно развитие парадоксального бронхоспазма (см. Раздел «Особенности применения»).

Существует повышенный риск развития пневмонии у пациентов с диагностированным впервые ХОБЛ, начинают лечение ингаляционными кортикостероидами. Однако взвешенная оценка восьми сводных клинических исследований не продемонстрировала повышенного риска пневмонии. Результаты первых семи из этих восьми исследований были опубликованы в виде отдельного метаанализа.

На фоне применения ингаляционных кортикостероидов может возникать системный эффект, особенно если высокие дозы принимают в течение длительного времени. Этот эффект значительно менее вероятным при ингаляционном лечении, чем при применении пероральных кортикостероидов. Возможен системный эффект включает снижение минеральной плотности костной ткани. Эффект, вероятно, зависит от дозы, времени экспозиции, одновременного и предварительного лечения кортикостероидами, а также индивидуальной чувствительности.

Дети

Из-за риска задержки роста у детей необходимо проводить контроль роста у педиатрических пациентов, как описано в разделе «Особенности применения».

Срок годности

2 года.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 30 ° С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Баллон под давлением - не прокалывать. Не бросать в огонь, даже пустой баллон.

Беречь от воздействия прямых солнечных лучей. Не хранить вблизи источников тепла. Не замораживать.

Упаковка

Алюминиевый баллон на 200 ингаляций (10 мл) по 50 мкг / доза или 200 мкг / доза будесонида каждая, с пластиковым адаптером и крышкой в картонной коробке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

ЛАБОРАТОРИО АЛЬДО-ЮНИОН, С.Л./LABORATORIO ALDO-UNION, S.L.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Баронесса де Малда, 73, 08950 Эсплугес де Ллобрегат, Барселона, Испания/Baronesa de Malda, 73, 08950 Esplugues de Llobregat, Barcelona, Spain.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — Государственного реестра лекарственных средств Украины.