

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
РЕКТОДЕЛЬТ 100

Загальна характеристика:

міжнародна та хімічна назви: преднізон, 17,21-дигідроксипрегна-1,4-дієн-3,11,20-тріон;

основні фізико-хімічні властивості: супозиторії блакитного кольору;

склад: 1 супозиторій містить преднізону 100 мг;

допоміжні речовини: твердий жир, барвник Е 132, алюмінію гідроксид.

Форма випуску. Супозиторії ректальні.

Фармакотерапевтична група. Кортикостероїди для системного застосування.
Глюкокортикоїди. Код АТС Н02АВ07.

Фармакологічні властивості. *Фармакодинаміка.* Преднізон швидко метаболізується до преднізолону. Окрім метаболічних ефектів глюкокортикоїди, у тому числі преднізон/преднізолон, мають специфічну дію, зокрема характеризуються протизапальними, протиалергічними та антипроліферативними властивостями, що найчастіше використовуються в клініці.

Основою клінічного застосування більшості глюкокортикоїдів є їх протизапальний ефект і здатність впливати на імунну систему. Наприклад, у дітей з нападами псевдокрупу кортикостероїди використовуються, перш за все, зважаючи на їх протизапальну активність і здатність зменшувати гострий набряк слизової оболонки. Застосування глюкокортикоїдів у лікуванні алергічних реакцій ґрунтується на їх протиалергічній активності, а імуносупресивний та антипроліферативний ефекти кортикостероїдів особливо важливі в лікуванні ревматичних захворювань. Основними ефектами преднізону є такі:

- мембраностабілізуювальні ефекти (пригнічення збільшення проникності капілярів і мембран у наслідок запалення; стабілізація лізосомальних мембран);
- пригнічуючий вплив на клітини мезенхімального походження (пригнічення росту фібробластів; пригнічення синтезу колагену);
- пригнічуючий або стимулюювальний вплив на лімфатичну тканину (зменшення кількості лімфоцитів; зменшення загальної кількості лейкоцитів; збільшення кількості тромбоцитів);
- вплив на метаболізм (стимуляція глюконеогенезу з амінокислот і катаболізму білків; зниження толерантності до глюкози та чутливості до інсуліну; пригнічення абсорбції Ca^{2+} в кишечнику);
- відносно незначний вплив на натрієвий та водний баланс (збільшення реабсорбції

Na^+ ; збільшення елімінації K^+).

Негайні, неспецифічні ефекти глюкокортикоїдів, в основному пов'язані із змінами фізико-хімічних властивостей клітинних мембран, як правило, спостерігаються через кілька хвилин після введення. Специфічні ефекти виявляються із певною затримкою (від 30 хвилин до кількох годин) і пов'язані із залученням комплексних багатоетапних механізмів.

Глюкокортикоїди зв'язуються із специфічними рецепторними білками чутливих клітин і в подальшому акумулюються в хроматині у формі модифікованих стероїдорецепторних комплексів для транскрипції.

Зазначеним шляхом реалізується синтез спеціальних білків, зокрема макрокортину, який

Сторінка 2 з 5. Видаєник: Державний експертний центр МОЗ України
безпосередньо опосередковує фармакодинамічні ефекти глюкокортикоїдів.

Фармакокінетика. Після введення преднізон швидко метаболізується до преднізолону. Загалом, преднізон і преднізолон в організмі взаємно конвертуються один в один, при цьому більшу частку становить преднізолон. Після застосування супозиторіїв Ректодельт 100 концентрація активного інгредієнта у плазмі досить швидко досягає величин, які можливо виміряти. Максимальні рівні преднізолону досягаються приблизно через 5 годин. Абсолютна біодоступність становить близько 29%. Преднізолон зв'язується з білками плазми на 50-90% – в основному з транскортином, а у високих концентраціях також і з альбуміном. Об'єм розподілу становить приблизно 1 л/кг, а кліренс – приблизно 1,5 мл/хв/кг. Близько 2-5% абсорбованої дози виділяється із сечею у вигляді преднізону, 11-24% – у вигляді преднізолону, а решта – у вигляді інших метаболітів.

Показання для застосування.

Супозиторії Ректодельт 100 показані при таких гострих станах, як астматичні напади, тяжкі алергічні реакції, лейкози, нефрози, а також при первинному лікуванні захворювань сполучної тканини, в тому числі ревматичних захворювань, у дітей з псевдокрупом (гострим стенозуючим ларинготрахеїтом), крупом, спастичним бронхітом.

Спосіб застосування та дози.

За відсутності інших рекомендацій первинна доза для дорослих при тяжких і загрозливих станах становить 100-200 мг преднізону на добу, при гострих станах – 100 мг преднізону на добу. Препарат Ректодельт 100 застосовують 1 раз на добу, при тяжких і загрозливих станах – 2 рази на добу.

Дітям, які хворіють на круп, псевдокруп і спастичний бронхіт з явищами гострого порушення дихання, призначають 100 мг преднізону на добу. Залежно від тяжкості стану доза для дітей може коливатись у межах 5–20 мг преднізону/кг маси тіла. Доза 5 мг/кг рекомендована дітям з масою тіла більше 20 кг.

Супозиторії слід вводити глибоко в пряму кишку. Ректальне застосування особливо рекомендується дітям із захворюваннями респіраторного тракту, зокрема гострим ларинготрахеїтом, коли внутрішньовенне, внутрішньом'язове або пероральне введення глюкокортикоїдів спричинює труднощі і додатковий стрес у дітей.

Термін застосування залежить від перебігу хвороби. При гострих станах загалом достатньо короткотермінової терапії. Лікування супозиторіями Ректодельт 100 не повинно перевищувати 2 днів у дітей, хворих на псевдокруп. Як правило, при гострих станах препарат застосовується до 6 днів, у залежності від перебігу хвороби.

При застосуванні преднізону більше 6 днів рекомендується індивідуальний режим дозування, під контролем лікаря. За необхідності можливий інтервал між введенням супозиторіїв становить 12–30 годин. При довготривалому лікуванні слід брати до уваги циркадні ритми.

Після довготривалого лікування застосування преднізону не повинно припинятися відразу; доцільно поступове зменшення підтримуючої дози. Для цього можуть бути використані інші лікарські форми преднізону/преднізолону, які дозволяють поступово зменшувати дозу лікарського засобу.

Побічна дія.

Тривале застосування преднізону може спричинити розвиток синдрому Іценко-Кушинга з такими проявами, як місяцеподібне обличчя, збільшення маси тіла та ожиріння, гіпертензія та остеопороз.

Крім того, можливий розвиток діабетичного метаболічного синдрому, міопатій, шлункових або кишкових виразок (у наслідок ульцерогенної дії на ШКТ та підвищення кислотності шлункового соку), психічних розладів, симптомів дефіциту калію, порушення водного та електролітного балансу. Може мати місце затримка натрію в організмі з утворенням набряків; артеріальна гіпертензія; підвищення зсілості крові; остеопороз, асептичний некроз кіст; гіперглікемія аж до розвитку стероїдного діабету, виснаження (аж до атрофії) кори надниркових залоз; негативний азотистий баланс; стероїдна катаракта, провокування латентної глаукоми.

Під час лікування внаслідок зниження опірності інфекціям зростає ризик розвитку інфекційних хвороб і можливість маскування симптомів інфекцій, може мати місце уповільнене загоєння ран.

Протипоказання.

Відома гіперчутливість до преднізону або будь-якого інгредієнта препарату.

Протипоказання проти стероїдів, за винятком індивідуальної гіперчутливості, можуть не враховуватися при короткотривалому (1-2 дні) застосуванні високих доз при лікуванні гострих, потенційно загрозливих для життя та ургентних станів. При тривалому застосуванні преднізону необхідно, однак, враховувати загальні протипоказання щодо прийому глюкокортикоїдів: виразки шлунково-кишкового тракту, тяжкі форми остеопорозу, виражена гіпертензія, стани до та після профілактичних щеплень, тяжкі вірусні інфекції (в т.ч. прості герпес та вітряна віспа чи герпес зостер), системні мікози, амебні інфекції, поліомієліт, за винятком бульбарно-енцефалітичних форм, закритокутова та відкритокутова форми глаукоми, лімфаденіт унаслідок щеплення вакциною БЦЖ, туберкульоз в активній формі, наявність продуктивної симптоматики при психічних захворюваннях.

Передозування.

Гостра інтоксикація преднізоном або іншими глюкокортикоїдами до цього часу не описана. Разові дози, толерантні для дорослих, становлять 2 000 мг преднізону без розвитку будь-яких ускладнень (дослідження на здорових добровольцях).

Особливості застосування.

Препарат Ректодельт 100 слід застосовувати, в першу чергу, при гострих станах. Як і щодо всіх інших глюкокортикоїдів, застосування Ректодельту 100 можливо тільки при ретельному аналізі співвідношення ризик/користь. Тривале застосування (більше 6 днів) можливо тільки під суворим контролем лікаря.

Спеціальні перестороги та спеціальні попередження при застосуванні

Якщо препарат застосовується для тривалого лікування, необхідно спостереження окуліста, контроль АТ і водно-електролітичного балансу, а також картини периферичної крові і рівня глюкози в крові; з метою зменшення побічних ефектів можна призначити анаболітичні стероїди, антибіотики, а також збільшити надходження калію в організм (дієта, препарати калію).

За наявності інформації про псоріаз в анамнезі преднізон у високих дозах застосовують під суворим контролем лікаря. При цукровому діабеті призначають тільки за абсолютними показаннями або для попередження ймовірної резистентності до інсуліну. При неспецифічних інфекціях застосовують з обережністю і за умови одночасної хіміо- або антибіотикотерапії. При латентних формах туберкульозу

Сторінка 4 з 5. Видавець: Державний експертний центр МОЗ України
преднізон може бути застосований тільки в сполученні з протитуберкульозними засобами.

Мутагенні ефекти преднізолону досліджені недостатньо. Існують окремі публікації, в яких наведена інформація про можливу наявність у нього мутагенного потенціалу, однак значущість цих свідчень не підтверджена відповідними даними. Довготривалі дослідження канцерогенного потенціалу преднізолону на тваринах відсутні.

При хворобі Аддісона слід уникати одночасного застосування з барбітуратами.

Після припинення лікування можливо виникнення синдрому відміни, недостатності надниркових залоз, а також загострення захворювання, з приводу якого був призначений преднізон.

Вагітність і лактація

Ректодельт 100 може застосовуватися при вагітності та в період лактації тільки після ретельного аналізу співвідношення ризик/користь. При вагітності (особливо в I триместрі) застосовують за життєвими показаннями.

Вплив на здатність керувати автомобілем і працювати з технікою

При застосуванні згідно з рекомендаціями та за відсутності тяжких небажаних реакцій – малоімовірний.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами.

Спільне застосування із саліцилатами або нестероїдними протиревматичними засобами може збільшувати ризик розвитку шлунково-кишкових кровотеч.

Одночасний прийом серцевих глікозидів може посилювати глікозидну активність, пов'язану із стероїдіндукованою втратою калія.

При одночасному застосуванні салуретичних засобів можливо збільшення втрати калію.

Ефекти антидіабетичних засобів або похідних кумарину можуть послаблюватися при спільному прийомі з Ректодельтом 100.

Рифампіцин, фенітоїн і барбітурати можуть послаблювати ефекти Ректодельту 100.

Умови та термін зберігання.

Зберігати при температурі не вище 25°C в сухому, захищеному від світла місці, недоступному для дітей.

Термін придатності - 36 місяців.

Умови відпуску.

За рецептом.

Упаковка.

Смужкова упаковка з PVC/PE, безбарвна, непрозора, штампована, що містить 6 супозиторіїв.
Картонна упаковка, що містить 1 смужку (№6) і листок-вкладиш.

Виробник.

Інструкцію завантажено з сайту www.dovgolit.com

Троммсдорфф ГмбХ енд Ко КГ (Німеччина).

Адреса.

Trommsdorff GmbH & Co. KG