

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
БУДЕКОРТ®
(BUDECORT)

Склад:

діюча речовина: будесонід;

1 доза містить 100 або 200 мкг будесоніду;

допоміжні речовини: пропелент HFA-134a (тетрафторетан).

Лікарська форма. Аерозоль для інгаляцій дозований.

Фармакотерапевтична група.

Препарати для лікування обструктивних захворювань дихальних шляхів. Глюкокортикоїди.

Код АТС R03 BA02.

Клінічні характеристики.***Показання.***

Бронхіальна астма.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до компонентів препарату, активна форма туберкульозу легенів, грибкові та вірусні інфекції дихальних шляхів, I триместр вагітності.

Афонія є абсолютним показанням до припинення лікування будесонідом. Інгаляційні глюкокортикоїди протипоказані при астматичному статусі або в умовах посилення бронхоспазму, оскільки ці препарати можуть викликати сухий кашель.

Спосіб застосування та дози.

Будесонід слід застосовувати у вигляді інгаляцій двічі на добу – вранці перед сніданком та ввечері перед сном. Для інгаляцій рекомендується використовувати спейсер.

Для дорослих терапевтична доза становить 200 мкг двічі на добу; в період загострення бронхіальної астми дозу препарату збільшують до 1600 мкг на добу, в декілька прийомів. Після досягнення терапевтичного ефекту дозу поступово зменшують до мінімальної ефективної дози. При бронхіальній астмі легкого або середнього ступеня тяжкості при встановленому контролі за симптомами захворювання рекомендована доза становить 200-400 мкг один раз на добу.

Дітям віком від 6 років препарат призначають у дозі 50-400 мкг двічі на добу; максимальна добова доза в період загострення захворювання становить 800 мкг, в декілька прийомів. Після досягнення терапевтичного ефекту дозу поступово зменшують до мінімальної ефективної дози. У разі необхідності застосування дози 50 мкг слід використовувати препарат з відповідним дозуванням.

Після кожної інгаляції треба ретельно почистити зуби (а також зубні протези) і прополоскати рот водою, щоб зменшити ризик розвитку кандидозу.

Перед використанням аерозолю треба струснути контейнер і натиснути один - два рази на дозуючий клапан.

Інгаляцію проводять у декілька етапів:



1. Зніміть захисний ковпачок з розпилюючої насадки.



2. Ретельно струсіть контейнер.

Переконайтесь, що він знаходиться в розпилюючій насадці в зворотному вертикальному положенні.



3. Зробіть глибокий видих. Обхопіть мундштук губами. Роблячи глибокий вдих, натисніть на контейнер.



4. Затримайте дихання на декілька секунд. Відведіть мундштук від рота та видихніть.

Якщо Вам призначена повторна доза, зачекайте 1 хвилину і почніть інгаляцію з пункту 2.

Примітка. 1 раз на тиждень промивайте розпилюючу насадку проточною водою. Перед цим обережно вийміть алюмінієвий контейнер. Запобігайте попаданню води на контейнер.

Побічні реакції.

Можливі загриплість голосу, відчуття сухості в горлі, сухий кашель. Довготривале застосування у високих дозах може призвести до мікозу глотки і гортані. Однак ці прояви можна попередити полосканням ротової порожнини і ковтком води після кожної інгаляції, а також застосуванням спеціальних спейсерів, що збільшують відстань від вихідного отвору розпилюючого пристрою до слизової оболонки глотки.

У дітей дуже рідко спостерігалися збудженість, занепокоєння, депресія.

В поодиноких випадках повідомлялося про реакції гіперчутливості негайного або уповільненого типів, які проявлялися висипаннями на шкірі, контактним дерматитом, кропив'яркою, ангіоневротичним набряком, анафілактичною реакцією і парадоксальним бронхоспазмом.

При тривалому застосуванні високих доз інгаляційних глюкокортикоїдів можуть спостерігатися системні побічні ефекти: пригнічення функції надниркових залоз, пригнічення росту у дітей і підлітків, зменшення мінеральної щільності кісток, катаракта, глаукома. Ступінь вираженості вказаних небажаних ефектів залежить від дози, тривалості лікування, застосування інших стероїдних препаратів в анамнезі.

Передозування.

Випадки гострого передозування не описані. Хронічне передозування призводить до пригнічення гіпоталамо-гіпофізарно-надниркової системи і проявляється симптомами, характерними для синдрому Кушинга. При цьому вживання екстрених заходів не потрібно. Рекомендується проводити моніторинг резервної функції кори надниркової залози. Лікування препаратом можна продовжувати у мінімальних ефективних дозах.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Застосування препарату в I триместрі вагітності протипоказане. В II і III триместрах вагітності будесонід може застосовуватися в мінімальних ефективних дозах лише у тих випадках, коли, на думку лікаря, переваги лікування для матері перевищують будь-який можливий ризик для плода. Даних про проникнення будесоніду в грудне молоко немає.

Діти.

Препарат не рекомендується застосовувати у дітей до 6 років. Рекомендовані дози для дітей повинні бути мінімальними для контролю за симптомами бронхіальної астми.

Особливості застосування.

Без застосування спейсера приблизно 10-25 % інгаляційної дози потрапляє в дихальні шляхи, частина

препарату осаджується в ротовій порожнині. Застосування спейсера забезпечує більш ефективну інгаляцію.

Афонія є абсолютним показанням до припинення лікування будесонідом. Захриплість голосу перед початком лікування не є протипоказанням для призначення препарату, хоча це явище вимагає ретельного спостереження, оскільки захриплість голосу може підсилюватися під час лікування будесонідом. Інгаляційні глюкокортикоїди протипоказані при астматичному статусі або при посиленні бронхоспазму, оскільки ці препарати можуть спричинювати сухий кашель.

Під час відміни таблетованих глюкокортикоїдів при переході на інгаляційну терапію пацієнти потребують особливої уваги до повного відновлення функції гіпоталамо-гіпофізарно-надниркової системи.

У поодиноких випадках при лікуванні інгаляційними глюкокортикоїдами може спостерігатися демаскування прихованої еозинофілії (наприклад, синдрому Хурга – Штраусса). Це особливо характерно для пацієнтів, у яких початок лікування інгаляційними глюкокортикоїдами збігся зі значним зменшенням дози системних кортикостероїдів. Прямого зв'язку між лікуванням інгаляційними глюкокортикоїдами і частотою цього синдрому не встановлено.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами.

Препарат не впливає на здатність керувати транспортними засобами та роботу з іншими механізмами.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Інгібітори цитохрому P₄₅₀ (кетконазол, інтраконазол) можуть збільшувати системний вплив будесоніду. Інші потенційні інгібітори CYP3A4 також здатні підвищувати рівні будесоніду в плазмі крові. Циметидин має нерізка виражений пригнічувальний вплив на печінковий метаболізм будесоніду, однак це явище не має клінічного значення. Даних про інші види взаємодій немає.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Будесонід – це активний синтетичний глюкокортикоїд, що застосовується для лікування алергічних і запальних захворювань дихальних шляхів. Виявляє незначну мінералокортикостероїдну активність. Належить до препаратів пролонгованої дії з можливістю однократного дозування. Будесонід характеризується місцевою протизапальною дією за рахунок високої ліпофільності і здатності проникати внутрішньоклітинно, зв'язуватися з глюкокортикоїдними рецепторами. Механізм дії будесоніду полягає в утворенні комплексів з глюкокортикоїдними рецепторами цитоплазми. Гормонрецепторні комплекси проникають в ядра клітин-мішеней (еозинофіли, нейтрофіли, лімфоцити), зв'язуються з ДНК і активують гени, які відповідають за продукцію ліпокортину. Ліпокортин є інгібітором фосфоліпази A₂ – ферменту, що пригнічує синтез медіаторів запалення: гістаміну, лейкотрієнів, цитокінів.

В тканинах дихальних шляхів будесонід утворює кон'югати з ефірами жирних кислот, які накопичуються в клітинах. Коли концентрація будесоніду в клітинах зменшується, стероїдні ефіри жирних кислот руйнуються під впливом ліпази. Будесонід, що вивільнився, здатний утворювати гормонрецепторні комплекси, які обумовлюють розвиток протизапальної дії препарату. Здатність будесоніду утворювати кон'югати з жирними кислотами пояснює механізм місцевої протизапальної активності уповільненого типу і високий рівень терапевтичної ефективності препарату.

Дослідження *in vivo* і на моделях тварин показали, що спорідненість будесоніду зі специфічними рецепторами глюкокортикоїдів у 200 разів вища, ніж у кортизолу, а місцевий протизапальний ефект у 1000 разів вищий ніж у кортизолу.

Препарат має більшу спорідненість з глюкокортикоїдними рецепторами бронхів у порівнянні з беклометазону пропіонатом, відповідно має більш високу місцеву протизапальну і протиалергічну активність. Значне поліпшення показників функції зовнішнього дихання відзначається через кілька днів (7-10 днів) від початку лікування. Будесонід не впливає на гладку мускулатуру бронхів. Препарат зменшує гіперреактивність бронхів, пригнічує ранню фазу алергічної реакції (після досить тривалого

застосування) і пізню фазу реакції, таким чином попереджаючи напади астми. Будесонід також зменшує бронхоспазм, спричинений фізичним зусиллям, холодним повітрям або сірчаним ангідридом. *Фармакокінетика.* Препарат швидко абсорбується після інгаляційного застосування. 34 % застосованої дози осаджується в легенях. Абсолютна системна доступність становить 39 % введеної дози. Пікові концентрації будесоніду в плазмі досягаються через 30 хв. після інгаляції. Об'єм розподілу становить приблизно 2-3 л/кг. Метаболізм більшої частини будесоніду (приблизно 90 %) відбувається у печінці за участі ензиму СYP3A4, внаслідок чого утворюються метаболіти з низькою глюкокортикостероїдною активністю. Глюкокортикостероїдна активність основних метаболітів 6-бета-гідроксибудесоніду та 16-альфа-гідроксибудесоніду становить менше 1 % порівняно з активною речовиною. Приблизно 90 % прийнятої дози переходить у неактивний стан вже під час першого проходження через печінку. Метаболізм у легенях незначний. У дорослих період напіввиведення препарату з плазми становить у середньому 2 год., у дітей – 1,5 год. Зв'язування будесоніду з білками плазми коливається від 85 до 90 %. Виводиться із сечею (70 %) і жовчю. Оскільки основна дія будесоніду відбувається в дихальних шляхах, немає даних про зв'язок між концентрацією препарату в плазмі та ефективністю його дії.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості: біла гомогенна суспензія.

Термін придатності.

2 роки.

Умови зберігання.

Зберігати при температурі не вище 30 °С у недоступному для дітей місці. Запобігати заморожуванню.

Упаковка.

Алюмінієвий контейнер з дозуючим клапаном і розпилюючою насадкою та захисним ковпачком у картонній коробці.

Категорія відпуску.

За рецептом.

Виробник.

Ципла Лтд.

Місцезнаходження.

Центральний офіс: Мумбаї Централ, Мумбаї - 400 008, Індія.