

**ІНСТРУКЦІЯ**  
**для медичного застосування препарату**

**БУДЕСОНІД-ІНТЕЛІ**  
**(BUDESONID-INTELI)**

**Дія:**

**Діюча речовина:** budesonid

кожна містить 50 мкг або 200 мкг будесоніду мікронізованого;

**Додаткові речовини:** кислота олеїнова, етанол безводний, 1,1,1,2-тетрафторетан (HFA-134a).

**Фармакологічна форма:** Інгаляція під тиском, суспензія.

**Фармакотерапевтична група:**

Глюкокортикоїди, що застосовуються при обструктивних захворюваннях дихальних шляхів. Глюкокортикоїди Код АТС R03B

**Клінічні характеристики.**

**Показання.**

Хронічна астма.

**Протипоказання.**

Гіперчутливість до будь-якого з компонентів препарату. Активна форма туберкульозу легенів.

**Спосіб застосування та дози.**

Застосовується тільки у вигляді інгаляцій.

**Діти віком від 2 до 7 років:** 100-400 мкг щоденно, у 2-4 прийоми.

**Діти віком від 7 років:** 100-800 мкг щоденно, у 2-4 прийоми.

**Дорослі:** 200-1600 мкг щоденно, у 2-4 прийоми.

Для досягнення бажаного клінічного ефекту підтримуюча доза повинна бути поступово зменшена до мінімальної, необхідної для контролю симптомів.

Після кожної інгаляції пацієнт повинен прополоскати рот водою.

**Поради щодо правильного застосування:**

Перед застосуванням аерозолі необхідно перевірити термін придатності препарату. Якщо інгалятор новий або не застосовувався протягом кількох днів, необхідно добреструснути його і випустити одну дозу в повітря, аби переконатися, що він працює.

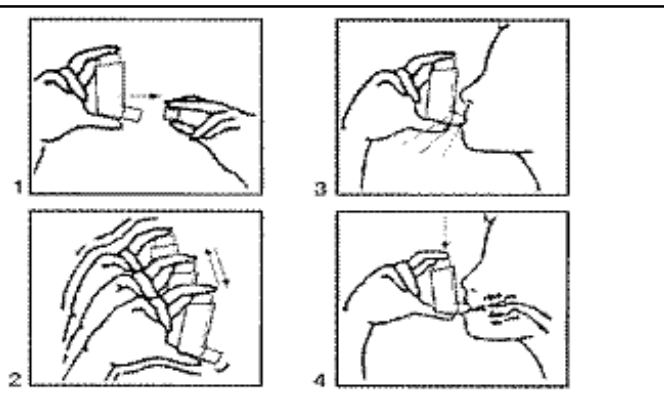
1. Зняти кришку з дозатора (рис. 1).

2. Тримати інгалятор вертикально, як показано на малюнку.

3. Струснути інгалятор протягом 20 секунд (рис.2).

4. Притиснути губи до дозатора (рис.3) і повністю видихнути.

5. Натиснути на аерозольний контейнер як показано на рис.4, одночасно зробивши глибокий вдих ротом.



Після вдиху затримати дихання для максимального проникнення препарату.

Якщо необхідно, продовжити декілька секунд і повторити процедуру знову (3, 4, 5 і 6).

Закрити кришкою після застосування.

Адаптер необхідно регулярно чистити. Для очистки дістати металічний контейнер і промити адаптер теплою (не гарячою) водою з милом.

Потім сполоснути, висушити адаптер і зібрати пристрій. Після збирання закрити кришкою.

### **ічні реакції.**

ирені (> 1/100, > 1/10)

ку дихальної системи: кандидозна інфекція ротоглотки, легке подразнення горла, кашель, захриплість.

динокі (> 1/10 000, < 1/1000)

льні порушення: ангіоневротичний набряк.

ку нервової системи: нервозність, занепокоєння, депресія, порушення поведінки.

ку шкіри: кропив'янка, висипання, дерматит, синці.

ку дихальної системи: бронхоспазм.

### **едозування.**

тривалому застосуванні високих доз можуть виникнути такі системні ефекти глюкокортикостероїдів, як оркортицизм (набряки, припухлість обличчя) та пригнічення гіпоталамо-гіпофізарно-надниркової системи.

тролітний дисбаланс повинен бути усунений за допомогою застосування діуретиків, які не впливають на калій і як спіронолактон і тріамтерен.

### **тосування у період вагітності або годування груддю.**

тність.

, одержані при дослідженні вагітних, не виявили будь-якого підвищеного ризику порушень розвитку, які були б льтатом лікування будесонідом. Дослідження на тваринах продемонстрували, що глюкокортикостероїди можуть чинити порушення розвитку, проте ці дані не вважаються значущими для людей при застосуванні мендованих дозувань.

час вагітності слід намагатися застосовувати найменшу ефективну дозу будесоніду, враховуючи при цьому к погіршення перебігу астми.

од годування груддю.

домо, чи потрапляє будесонід у грудне молоко. У разі необхідності лікування слід вирішити питання про инення годування груддю.

и.

парат протипоказаний дітям віком до 2 років.

### **бливості застосування.**

застосуванні інгаляційних стероїдів пацієнтам слід промивати ротову порожнину водою після кожного ення дози, що зумовлено ризиком інфікування ротової частини глотки грибковою мікрофлорою.

і уникати супутнього лікування кетоконазолом, ітраконазолом або іншими потужними інгібіторами СYP3A4.

о це неможливо, інтервал між застосуванням цих лікарських засобів має бути якомога більше.

бливої уваги потребують пацієнти, які переходять з пероральних стероїдів, оскільки у них протягом тривалого може зберігатися ризик недостатності функції надниркових залоз. До групи ризику також можуть належати енти, які потребували невідкладної терапії високими дозами кортикостероїдів або тривалого лікування вищими рекомендованими дозами інгаляційних кортикостероїдів. У таких пацієнтів при сильному стресі уть проявлятися ознаки та симптоми надниркової залозної недостатності. В період стресу або планових ргічних втручань у таких пацієнтів слід враховувати можливість застосування додаткових системних икостероїдів.

застосуванні будь-якого інгаляційного кортикостероїду можуть виникати системні ефекти, особливо при значенні високих доз протягом тривалого періоду часу. Ймовірність виникнення таких ефектів значно менша застосуванні інгаляційних кортикостероїдів, ніж пероральних. Можливі побічні ефекти включають пригнічення кції надниркових залоз, затримку росту у дітей, зниження мінеральної щільності кісток, катаракту і глаукому. у дозу інгаляційних кортикостероїдів слід титрувати до найменшої ефективної дози.

час переходу з терапії пероральними стероїдами на Будесонід-Інтелі пацієнти можуть відчувати такі симптоми, ль у м'язах та суглобах. У таких випадках може бути потрібне тимчасове підвищення дози перорального оїду. В поодиноких випадках можливі такі симптоми, як стомленість, головний біль, нудота, блювання, що ують на системну недостатність глюкокортикостероїдів.

на терапії системними стероїдами на Будесонід-Інтелі іноді призводить до проявів алергії, таких як риніт та ма, які раніше купірувались системними препаратами.

у випадках з іншими видами інгаляційної терапії, безпосередньо після застосування дози може виникнути доксальний бронхоспазм. Якщо виникають тяжкі реакції, слід зробити переоцінку лікування та, за необхідності, почати альтернативну терапію.

пацієнтів слід повідомити про необхідність звернутися до лікаря, якщо ефект лікування буде знижуватися, оскільки гормональні інгаляції для усунення тяжких нападів бронхіальної астми не повинні відкладати початок іншої важливої терапії. У випадку гострого погіршення результатів терапії слід доповнити курсом пероральних стероїдів при відсутності дії.

Зниження печінкова функція може мати вплив на здатність виводити будесонід.

У пацієнтів старше 3 років при дозах до 400 мкг на добу системних ефектів не спостерігалось. У межах 400-800 мкг на добу можуть виникати біохімічні ознаки системного ефекту. При добових дозах, що перевищують 800 мкг, такі ефекти є поширеними.

У пацієнтів, які одержують довготривале лікування кортикостероїдами, рекомендований регулярний моніторинг росту, незалежно від форми, в якій застосовується препарат. Користь від терапії кортикостероїдами слід розглядати порівняно з можливим ризиком пригнічення росту.

У дітей з бронхіальною астмою, як і інгаляційні кортикостероїди, може сповільнювати ріст. Проте дослідження дітей, яких лікували будесонідом тривалий час (до 13 років), показали, що пацієнти досягають очікуваного росту дорослих. Інгаляційна терапія будесонідом ефективна у запобіганні спричиненої фізичними зусиллями астми.

Застосування: прийом будесоніду спортсменами може дати позитивний результат аналізу на допінг.

### **Вплив будесоніду на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами.**

Будесонід не впливає на швидкість реакції при керуванні автотранспортом та роботі з іншими механізмами.

### **Взаємодія будесоніду з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.**

Клінічно значущих випадків взаємодії будесоніду з протиастматичними препаратами невідомо.

Будесонід 200 мкг, який застосовували один раз на добу, підвищував концентрацію перорального будесоніду в плазмі (3 мкг як одноразова доза) у середньому в 6 разів при їх одночасному застосуванні. При застосуванні будесоніду через 12 годин після будесоніду концентрація підвищувалася в середньому у 3 рази. Інформація про взаємодію відсутня стосовно інгаляційного будесоніду, проте в цьому випадку очікуються суттєво підвищені концентрації будесоніду в плазмі. Оскільки дані, які б дозволили наводити рекомендації щодо дозування, відсутні, комбінації цих препаратів слід уникати. Якщо це неможливо, інтервал між застосуванням кетоконазолу та будесоніду повинен бути якомога більший. Слід також враховувати можливість зниження дози будесоніду. Інші сильнодіючі інгібітори CYP3A4, такі як ітраконазол, також призводять до суттєвого підвищення рівня будесоніду в плазмі.

Інгібітори цитохрому P450 (кетоконазол, ітраконазол) можуть збільшувати системний вплив будесоніду.

Бетаметазон 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 запальних і запальних захворювань дихальних шляхів. Виявляє незначну мінералокортикостероїдну активність. Будесонід належить до препаратів пролонгованої дії з можливістю одноразового дозування. Будесонід характеризується швидкою 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 (макрофаги, нейтрофіли, лімфоцити), зв'язуються з ДНК і активують гени, які відповідають за продукцію запальної реакції. Ліпокортин є інгібітором фосфоліпази A2 – ферменту, що пригнічує синтез медіаторів запалення: простагландину, лейкотрієнів, цитокінів.

анинах дихальних шляхів будесонід утворює кон'югати з ефірами жирних кислот, які накопичуються в клітинах. Концентрація будесоніду в клітинах зменшується, стероїдні ефіри жирних кислот руйнуються під впливом води. Будесонід, що вивільнився, здатний утворювати гормонрецепторні комплекси, які обумовлюють розвиток протизапальної дії препарату. Здатність будесоніду утворювати кон'югати з жирними кислотами пояснює механізм його 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 порівняно з беклометазону глюкостероїдом, відповідно має більш високу місцеву протизапальну і протиалергічну активність. Значне поліпшення функції зовнішнього дихання відзначається через кілька днів (7-10 днів) від початку лікування. Будесонід 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 димом.

**Фармакокінетика.** Препарат швидко абсорбується після інгаляційного застосування. 34 % застосованої дози абсорбується в легенях. Абсолютна системна доступність становить 39 % введеної дози. Максимальні 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 в печінці за участі ензиму CYP3A4, внаслідок чого утворюються метаболіти з низькою глюкокортикостероїдною активністю. Глюкокортикостероїдна активність основних метаболітів 6-бета-гідроксибудесоніду та 16-альфа-гідроксибудесоніду становить менше 1 % порівняно з вихідною 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 крові становить у середньому 2 години, у дітей – 1,5 години. Зв'язування будесоніду з білками плазми крові становить 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.

### **Фізико-хімічні характеристики.**

#### **Фізико-хімічні властивості:**

**Форма випуску:** для дозування 50 мкг/доза: біла суспензія;

для дозування 200 мкг/доза: біла суспензія з типовим запахом та смаком.

**Термін придатності:** для обох дозувань: біла суспензія.

**Термін придатності.** 2 роки.

#### **Умови зберігання.**

Зберігати при температурі не вище 30 °C.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Не тримати під тиском – не проколювати. Не кидати до вогню, навіть порожній балон.

Уникати впливу прямих сонячних променів. Не зберігати поблизу джерел тепла.

Не заморозувати.

#### **Упаковка.**

Мінієвий балон на 200 інгаляцій (10 мл) по 50 мкг/доза або 200 мкг/доза будесоніду кожна, з пластиковим захисним колпачком та кришкою у картонній коробці.

**Категорія відпуску.** За рецептом.

#### **Виробник.**

Фармацевтичне підприємство Альдо-Юніон, С.А./Laboratorio Aldo-Union, S.A.

#### **Місця знаходження.**

Баронеса де Малда, 73, 08950, Есплугес де Ллобрегат, Барселона, Іспанія/Baronesa de Malda, 73, 08950 Esplugues de  
regat, Barsezona, Spain.

**ВНИК.**

«Інтелі Генерікс Норд»JSC «Inteli Generics Nord».

**Місцезнаходження.**

Шеймінішкю 3, 09312, Вільнюс, Литва/Seimyniskiu 3, 09312, Vilnius, Lithuania.