

ИНСТРУКЦИЯ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ
ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

БЕКЛОСПИР®

РЕГИСТРАЦИОННЫЙ НОМЕР:

ТОРГОВОЕ НАИМЕНОВАНИЕ: Беклоспир®

МЕЖДУНАРОДНОЕ НЕПАТЕНТОВАННОЕ НАИМЕНОВАНИЕ (МНН): беклометазон

ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА: аэрозоль для ингаляций дозированный.

СОСТАВ НА ОДНУ ДОЗУ:

Беклоспир® 50 мкг/доза:

действующее вещество: беклометазона дипропионат 0,05 мг;

вспомогательные вещества: этанол абсолютированный, гидрофторалкан (HFA134a).

Беклоспир® 100 мкг/доза:

действующее вещество: беклометазона дипропионат 0,10 мг;

вспомогательные вещества: этанол абсолютированный, гидрофторалкан (HFA134a).

Беклоспир® 250 мкг/доза:

действующее вещество: беклометазона дипропионат 0,25 мг; *вспомогательные вещества:*
этанол абсолютированный, гидрофторалкан (HFA134a).

ОПИСАНИЕ

Баллон алюминиевый с дозирующим клапаном. При распылении на предметное стекло содержимое баллона образует пятно белого цвета. Содержимое баллона после испарения пропеллента представляет собой бесцветный раствор.

ФАРМАКОТЕРАПЕВТИЧЕСКАЯ ГРУППА: средства для лечения обструктивных заболеваний дыхательных путей; другие средства для ингаляционного введения, применяемые для лечения обструктивных заболеваний дыхательных путей; глюкокортикоиды.

КОД АТХ: R03BA01

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

Фармакодинамика

Беклометазона дипропионат является пролекарством и обладает слабой тропностью к

глюкокортикостероидным (ГКС) рецепторам. Под действием эстераз превращается в активный метаболит – беклометазона-17-монопропионат, который оказывает выраженный местный противовоспалительный эффект за счет снижения образования субстанции хемотаксиса (влияние на аллергические реакции замедленного типа). Подавляя продукцию метаболитов арахидоновой кислоты и снижая выделение из тучных клеток медиаторов воспаления, тормозит развитие аллергической реакции немедленного типа. Улучшает мукоцилиарный транспорт, снижает количество тучных клеток в слизистой оболочке бронхов, уменьшает отек эпителия, секрецию слизи бронхиальными железами, гиперреактивность бронхов, краевое скопление нейтрофилов, воспалительный экссудат и продукцию лимфокинов, тормозит миграцию макрофагов, снижает интенсивность процессов инфильтрации и грануляции. После ингаляционного введения практически не оказывает резорбтивного действия. Не купирует бронхоспазм. Терапевтический эффект развивается постепенно, обычно через 5–7 дней курсового применения.

За счет увеличения активных бета-адренорецепторов восстанавливает реакцию больного на бронходилататоры, позволяя уменьшить частоту их применения.

Фармакокинетика

Всасывание

Более 25 % ингалированной дозы беклометазона дипропионата оседает в дыхательных путях, оставшееся количество – во рту, глотке и проглатывается. В легких перед абсорбцией беклометазона дипропионат интенсивно метаболизируется до активного метаболита - беклометазон-17-монопропионата. Его системная абсорбция происходит в легких (36 % легочной фракции), в желудочно-кишечном тракте (ЖКТ) (26 % от поступившей при проглатывании дозы). Абсолютная биодоступность неизмененного беклометазона дипропионата и беклометазона-17-монопропионата составляет, соответственно, около 2 и 62 % от ингалированной дозы.

Беклометазона дипропионат всасывается быстро (время достижения максимальной концентрации $[t_{\max}]$ – 0,3 часа), беклометазона-17-монопропионат - медленнее ($t_{\max}$ – 1 час).

Распределение

В тканях для беклометазона дипропионата составляет 20 л и для беклометазона-17-монопропионата – 424 л. Связь с белками плазмы крови умеренно высокая – 87 %. Беклометазона дипропионат и беклометазона-17-монопропионат имеют высокий плазменный клиренс (150 и 120 л/ч, соответственно).

Метаболизм

В большинстве тканей беклометазона дипропионат разрушается эстеразами. Основным продуктом является активный метаболит - беклометазона-17- монопропионат.

В незначительных количествах образуются неактивные метаболиты - беклометазона-21- монопропионат и беклометазон.

Выведение: период полувыведения ($t_{1/2}$) беклометазона дипропионата и беклометазона-17- монопропионата составляет 0,5 и 2,7 часа, соответственно. Беклометазона дипропионат и его метаболиты выводятся главным образом с калом посредством элиминации с желчью, в меньшей степени – с мочой.

ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ

Базисная терапия различных форм бронхиальной астмы у взрослых и детей старше 4 лет.

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

Гиперчувствительность к беклометазону или к любому из вспомогательных веществ.

Детский возраст до 4 лет.

Препарат Беклоспир[®], содержащий 250 мкг в 1 дозе, не предназначен для использования в педиатрии (т. е. у детей до 18 лет).

С ОСТОРОЖНОСТЬЮ

Глаукома, системные инфекции (бактериальные, вирусные, грибковые), паразитарные заболевания, туберкулез легких (активная и неактивная формы), остеопороз, цирроз печени, гипотиреоз, беременность, период грудного вскармливания.

ПРИМЕНЕНИЕ ПРИ БЕРЕМЕННОСТИ И В ПЕРИОД ГРУДНОГО ВСКАРМЛИВАНИЯ

С особой осторожностью, лишь в случае, если потенциальная польза для матери превышает возможный риск для плода и ребенка.

СПОСОБ ПРИМЕНЕНИЯ И ДОЗЫ

Ингаляционно.

Препарат Беклоспир[®] относится к препаратам базисной терапии, поэтому его необходимо применять постоянно, даже при отсутствии симптомов заболевания. Недопустимо резкое прекращение ингаляций. Рекомендуемые дозы зависят от тяжести заболевания и подбираются индивидуально. При переходе на высокую дозу ингаляционного беклометазона многие пациенты, получающие системные глюкокортикостероиды, смогут уменьшить их дозу или

отменить их совсем.

Взрослые и дети в возрасте 12 лет и старше: рекомендуемые начальные дозы препарата:

- бронхиальная астма легкой степени тяжести (объем форсированного выдоха (ОФВ₁) или пиковая скорость выдоха [ПСВ] – более 80 % от должных величин, суточный разброс показателей ПСВ – менее 20%): 200–600 мкг/сут (за 2 ингаляции в сутки).;
- бронхиальная астма средней степени тяжести (ОФВ₁ или ПСВ – 60–80 %, суточный разброс показателей ПСВ – 20–30 %): 600–1000 мкг/сут (за 2–4 ингаляции в сутки);
- бронхиальная астма тяжелой степени тяжести (ОФВ₁ или ПСВ – 60 %, суточный разброс показателей ПСВ – более 30 %): 1000–2000 мкг/сут (за 2–4 ингаляции в сутки).

В зависимости от индивидуального ответа пациента начальную дозу препарата можно увеличить до появления клинического эффекта или снизить до минимальной эффективной дозы.

Стандартная максимальная суточная доза – 1000 мкг. В отдельных очень тяжелых случаях суточная доза может быть увеличена до 1500–2000 мкг (за 2–4 ингаляции в сутки).

Лечение бронхиальной астмы основано на ступенчатом подходе - терапию начинают согласно ступени, соответствующей тяжести заболевания. ГКС ингаляционно назначают на второй ступени терапии.

Ступень 2. Базисная терапия: беклометазона дипропионат – 100–400 мкг 2 раза в сутки.

Ступень 3. Базисная терапия: ингаляционно беклометазона в высокой (800–1600, в отдельных случаях до 2 000 мкг/сут) или стандартной дозе, но в сочетании с ингаляционным введением агонистов бета₂-адренорецепторов длительного действия.

Ступень 4 (тяжелая астма). Беклометазона дипропионат – 800–1600 мкг/сут, в отдельных случаях доза может быть увеличена до 2000 мкг/сут.

Ступень 5 (тяжелая астма). Беклометазона дипропионат – 800–1600 мкг, в отдельных случаях суточная доза может быть увеличена до 2000 мкг.

Суточную дозу делят на несколько приемов.

Дети в возрасте от 4 до 12 лет: рекомендуемая доза составляет до 400 мкг/сут в несколько приемов. Рекомендуемая начальная суточная доза 100–200 мкг (за 2 ингаляции в сутки). Стандартная максимальная суточная доза 200 мкг. В отдельных очень тяжелых случаях суточная доза может быть увеличена до 400 мкг (за 2–4 ингаляции в сутки).

Ингалятор, содержащий 250 мкг в 1 дозе не предназначен для использования в педиатрии.

Применение препарата у детей должно проходить под контролем взрослых.

Особые группы пациентов: пациентам пожилого возраста и пациентам с почечной или печеночной недостаточностью специального подбора доз не требуется.

Пропуск приема 1 дозы препарата: при случайном пропуске ингаляции следующую дозу необходимо принять в положенное время в соответствии со схемой лечения.

После каждой ингаляции необходимо тщательно прополоскать полость рта и горло водой.

Инструкция по использованию ингалятора

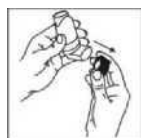
Перед первым использованием ингалятора клапан баллона необходимо разработать. Для этого поместите распылитель на баллон так, чтобы выходная трубка баллона попала в отверстие распылителя (п. 1), снимите защитный колпачок (п. 2), держа баллон с распылителем вертикально дном вверх, нажмите на дно баллона 3 раза, перед каждым нажатием интенсивно встряхивая баллон в течение 5 секунд.

Убедитесь, что в выходной трубке баллона и распылителе нет пыли и грязи. Если в результате осмотра обнаружены загрязнения, то выходную трубку баллона и распылитель необходимо почистить.



1. Поместите распылитель на баллон, так чтобы выходная трубка баллона попала в отверстие распылителя.

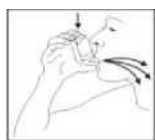
2. Снимите защитный колпачок.



3. Держите баллон вертикально, положив большой и указательный пальцы, как показано на рисунке. Интенсивно встряхните баллон 3–4 раза «вверх–вниз».



4. Поместите распылитель в ротовую полость, плотно обхватив его губами, и полностью выдохните через нос (без напряжения).



5. Произведите долгий глубокий вдох, одновременно нажав указательным пальцем на дно баллона, выпуская одну дозу лекарства. После впрыска, продолжайте медленно вдыхать.



6. Выньте изо рта распылитель и задержите дыхание на несколько секунд. Медленно выдохните.

7. Наденьте колпачок на распылитель. Если требуется повторная ингаляция препарата, повторите действия, начиная с п. 2.

8. Для поддержания чистоты распылителя рекомендуется промывать его

теплой водой после использования не реже одного раза в день. После промывки распылитель просушить.

ВНИМАНИЕ: не использовать для ингаляции влажный распылитель.

В зависимости от упаковки баллон рассчитан на 200 или 250 ингаляций. После этого баллон следует заменить. Несмотря на то, что в баллоне может оставаться некоторое количество содержимого, количество лекарственного вещества, высвобождающееся при ингаляции, может быть уменьшено.

Если распылитель не снабжён счётчиком доз, то количество препарата в баллоне можно определить следующим образом: сняв распылитель, баллон погружают в ёмкость, наполненную водой. Количество препарата определяют в зависимости от позиции баллона в воде (см. рис.1).

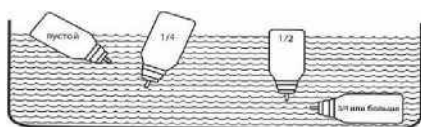


Рис.1. Определение количества препарата в баллоне

Предостережения:

Баллон необходимо предохранять от падений и ударов. Баллон не вскрывать и не подвергать нагреванию. Распылитель не может быть использован с другими дозированными аэрозолями. Также нельзя использовать препарат Беклоспир® с другими адаптерами.

Применение препарата у детей должно проходить под контролем взрослых.

Рекомендуется для предотвращения вдоха через нос во время ингаляции зажимать ноздри ребенка.

ПОБОЧНОЕ ДЕЙСТВИЕ

Частота возникновения нежелательных реакций определялась в соответствии со следующими градациями частоты их возникновения: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$, $< 1/100$), редко ($\geq 1/10000$, $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$), частота неизвестна (на основании имеющихся данных оценить невозможно).

Инфекции и инвазии: очень часто – ларингит, фарингит; часто – кандидоз полости рта, глотки, верхних дыхательных путей (вероятность развития повышается при дозах более 400 мкг/сут, наиболее вероятно у пациентов с высоким уровнем преципитирующих антикандидозных антител, свидетельствующих о перенесенном ранее кандидозе); пневмония (у пациентов с ХОБЛ).

Нарушения со стороны иммунной системы: редко – реакции гиперчувствительности,

включая сыпь, крапивницу, зуд, анафилактические реакции, ангионевротический отек, в том числе параорбитальной области, слизистой оболочки ротовой полости и глотки, губ и лица.

Эндокринные нарушения: очень редко – снижение функции коры надпочечников (при длительном применении высоких доз более 1,5 мг/сут), в том числе задержка роста у детей и подростков.

Психические нарушения: частота неизвестна – психомоторная гиперактивность, расстройства сна, беспокойство, депрессия, агрессия, изменение поведения (преимущественно у детей).

Нарушения со стороны нервной системы: нечасто – головная боль.

Нарушения со стороны органа зрения: нечасто – нарушение четкости зрения; очень редко – катаракта, глаукома (как возможные системные эффекты применения ГКС); частота неизвестна – центральная серозная ретинопатия.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: часто – дисфония (охриплость), раздражение слизистой оболочки глотки (применение спейсера снижает вероятность их развития), редко – парадоксальный бронхоспазм (как при любой ингаляционной терапии), в этом случае требуется немедленное применение ингаляционных быстродействующих бронходилататоров с последующей отменой препарата и назначение альтернативной терапии, очень редко – эозинофильная пневмония.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: часто – кровоподтеки, истончение кожи (как возможные системные эффекты применения ГКС).

Нарушения со стороны мышечной, скелетной и соединительной ткани: очень редко – снижение минеральной плотности костей (как возможные системные эффекты применения ГКС).

Если любые из указанных в инструкции побочных эффектов усугубляются, или Вы заметили любые другие побочные эффекты, не указанные в инструкции, сообщите об этом врачу.

ПЕРЕДОЗИРОВКА

Симптомы

Разовая ингаляция высоких доз беклометазона дипропионата (более 1 мг)

Возможно подавление функции гипоталамо-гипофизарно-надпочечниковой системы.

Хроническая (в течение недель или месяцев) передозировка

Может отмечаться стойкое подавление функции коры надпочечников.

Лечение

Разовая ингаляция высоких доз беклометазона дипропионата (более 1 мг)

Не требует экстренной терапии, в этом случае лечение препаратом должно быть продолжено. Функция коры надпочечников восстанавливается через 1–2 дня, что

подтверждается уровнем кортизола в плазме.

Хроническая (в течение недель или месяцев) передозировка

В этом случае необходимо проводить мониторинг резервной функции коры надпочечников. В таких случаях необходимо постепенное снижение дозы до достаточной для поддержания терапевтического эффекта. Пациентов с атрофией коры надпочечников считают стероидозависимыми и до достижения стабилизации состояния подбирают им адекватную поддерживающую терапию системными ГКС.

ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ С ДРУГИМИ ЛЕКАРСТВЕННЫМИ СРЕДСТВАМИ

Беклометазон восстанавливает реакцию больного на бета-адреномиметики, позволяя уменьшить частоту их использования. При одновременном применении с фенобарбиталом, фенитоином, рифампицином и другими индукторами микросомальных ферментов печени эффективность беклометазона снижается. При одновременном применении с метандиеноном, эстрогенами, бета₂-адреномиметиками, теофиллином, а также системными ГКС эффективность беклометазона повышается. При одновременном применении беклометазон усиливает эффект бета-адреномиметиков.

Из-за содержания этилового спирта возможно взаимодействие у особо чувствительных пациентов с дисульфирамом и метронидазолом.

Одновременное назначение с пероральными глюкокортикостероидами или калийнесберегающими диуретиками, такими как тиазиды или фуросемид, может вызывать чрезмерную потерю калия.

ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ

Перед применением препарата Беклоспир® необходимо убедиться в том, что пациент правильно использует ингаляционное устройство, чтобы гарантировать достаточное дозирование препарата.

Пациентов, применяющих препарат в домашних условиях, необходимо предупредить о том, что, если действие обычной дозы становится менее эффективным или менее продолжительным, нельзя самостоятельно увеличивать дозу или частоту применения препарата, а следует немедленно обратиться к врачу.

При длительном применении беклометазона в высоких дозах (более 400 мкг/сут) развивается кандидоз ротовой полости и глотки, особенно у пациентов, ранее перенесших грибковую инфекцию, что подтверждается высоким содержанием в крови преципитирующих антител против грибов *Candida*. Как правило, применение противогрибковых препаратов способствует быстрой ликвидации грибковой инфекции. Дозу беклометазона в этом случае изменять не

следует.

Если лечение ингаляционным беклометазоном начинается на фоне приема внутрь ГКС, то снижение дозы ГКС можно начать только через 1–2 недели после начала одновременного применения. Схема снижения дозы ГКС для приема внутрь зависит от дозы и продолжительности применения ГКС. Регулярное применение ингаляционного беклометазона в большинстве случаев позволяет снизить дозу ГКС для приема внутрь. Как правило, пациенты, принимающие не более 15 мг преднизолона, могут полностью перейти на прием только ингаляционного беклометазона. Первые месяцы после перехода на ингаляционную терапию беклометазоном необходимо тщательно следить за состоянием ГГНС, чтобы предотвратить ее угнетение.

Пациенты со сниженной функцией надпочечников, переведенные полностью на лечение ингаляционным беклометазоном, должны всегда иметь с собой запас ГКС и носить с собой предупреждающую карточку с информацией о том, что в стрессовых ситуациях они нуждаются в применении системных ГКС. После завершения стрессовой ситуации доза ГКС может быть уменьшена или ГКС может быть отменен.

Увеличение дозы ГКС требуется при внезапном и прогрессирующем ухудшении течения бронхиальной астмы. Косвенным показателем неэффективности терапии является более частое применение бета2-адреномиметиков короткого действия.

При переводе пациентов с приема ГКС внутрь на ингаляционные ГКС, в том числе беклометазон, могут проявиться различные аллергические реакции, в том числе аллергический ринит и аллергический дерматит, которые не проявлялись на фоне лечения системных ГКС.

Беклометазон для ингаляций предназначен для регулярного ежедневного применения, а не для купирования приступов бронхоспазма. Для купирования приступов бронхоспазма применяют бета2-адреномиметики, в том числе сальбутамол. При тяжелом течении бронхиальной астмы или недостаточной эффективности ингаляционного беклометазона необходимо увеличить его дозу, а также рассмотреть вопрос о применении ГКС внутрь или, например, применении антибиотиков в случае инфекционного воспаления.

При развитии парадоксального бронхоспазма следует беклометазон отменить, провести обследование пациента и рассмотреть возможность применения другого препарата.

Нельзя резко прекращать лечение ингаляционным беклометазоном.

При длительном применении ингаляционного беклометазона в дозе более чем 1,5 г/сут возможно развитие системных реакций различного характера, в том числе симптомы

угнетения функции коры надпочечников, снижения темпа роста у детей, снижение минеральной плотности костей, катаракта, глаукома, синдром Кушинга, характерные признаки кушингоида, психологические или поведенческие эффекты, включая психомоторную гиперактивность, нарушения сна, тревогу, депрессию или агрессию (особенно у детей). Поэтому при достижении терапевтического эффекта доза ингаляционного беклометазона должна быть снижена до минимальной эффективной дозы, контролирующей течение заболевания. Пациенты, имеющие высокий риск развития недостаточности коры надпочечников, должны находиться под контролем врача.

При длительном применении беклометазона у детей необходимо контролировать динамику их роста.

Следует соблюдать осторожность при применении ингаляционного ГКС у пациентов с активной и неактивной формами туберкулеза легких.

Сообщалось о нарушениях зрения при системном и местном применении глюкокортикостероидов. Если у пациента появляются такие симптомы, как нечеткость зрения или другие нарушения зрения, следует рассмотреть возможность направления пациента к офтальмологу для оценки возможных причин, которые могут включать катаракту, глаукому или редкие заболевания, такие как центральная серозная хориоретинопатия (ЦСР). Необходимо предохранять глаза от попадания препарата Беклоспир®.

Алюминиевый баллон с препаратом Беклоспир® нельзя прокалывать, разбирать и нагревать, даже в том случае, если он пуст.

ВЛИЯНИЕ НА СПОСОБНОСТЬ УПРАВЛЯТЬ ТРАНСПОРТНЫМИ СРЕДСТВАМИ, МЕХАНИЗМАМИ

Исследований влияния препарата на способность к управлению автотранспортом и пользованию механизмов не проводилось. Учитывая возможность развития таких побочных действий как головокружение, нервозность, повышенную возбудимость, тремор, нарушение аккомодации глаз и затуманивание зрения, в случае их появления следует воздержаться от вождения автотранспорта и занятия другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

ФОРМА ВЫПУСКА

Аэрозоль для ингаляций дозированный 50 мкг/доза, 100 мкг/доза и 250 мкг/доза.

По 200 доз в баллон металлический, снабженный дозирующим клапаном.

Каждый баллон вместе с распылителем для противоастматических препаратов со счетчиком доз или без, со спейсером или без и инструкцией по применению помещают в пачку из

картона.

УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ

Хранить при температуре не выше 30°C. Не замораживать. Хранить вдали от источников огня, отопительной системы и прямых солнечных лучей.

Хранить в недоступном для детей месте.

СРОК ГОДНОСТИ

3 года.

Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

УСЛОВИЯ ОТПУСКА

Отпускают по рецепту.

ПРОИЗВОДИТЕЛЬ

ОАО «Фармацевтическая фабрика Санкт-Петербурга»

г. Санкт-Петербург, ул. Моисеенко, д. 24-а, лит. Д, лит. 3

ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

ОАО «Фармацевтическая фабрика Санкт-Петербурга» Россия, 191144, г. Санкт-Петербург, ул. Моисеенко, д. 24-а,

тел/факс: +7 (812) 409 97 49

www.galenopharm.ru

ПРЕДСТАВИТЕЛЬ ДЕРЖАТЕЛЯ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Претензии потребителей направлять по адресу:

ОАО «Фармацевтическая фабрика Санкт-Петербурга» Россия, 191144, г. Санкт-Петербург, ул. Моисеенко, д. 24-а,

тел/факс: +7 (812) 409 97 49

www.galenopharm.ru