

**Інструкція**  
**для медичного застосування лікарського засобу**

**Ректодельт 100**  
**(Rectodelt® 100)**

**Склад:**

*діюча речовина:* prednisone;  
1 супозиторій містить 100 мг преднізону;  
*допоміжна речовина:* твердий жир.

**Лікарська форма.** Супозиторії ректальні.

*Основні фізико-хімічні властивості:* торпедоподібні супозиторії, з гладкою поверхнею.

**Фармакотерапевтична група.** Кортикостероїди для системного застосування.  
Глюкокортикоїди. Код АТХ N02A B07.

**Фармакологічні властивості.**

*Фармакодинаміка.*

Преднізон – глюкокортикоїд, який не містить фтору, призначений для системного застосування.

Преднізон має дозозалежний вплив на метаболізм майже усіх тканин. На фізіологічних рівнях його дія необхідна для підтримки гомеостазу організму у стані спокою та фізичного навантаження, а також для регуляції діяльності імунної системи.

При дозах, що перевищують рівень, необхідний для заміщення, преднізон проявляє швидку протизапальну дію (антиексудативна та антипроліферативна дія) та сповільнений імуносупресивний ефект. Він інгібує хемотаксис та активність клітин імунної системи, вивільнення та ефект медіатора запалення та імунних реакцій, наприклад, лізосомальні ферменти, простагландини, лейкотрієни.

При закупорці бронхів преднізон збільшує дію бета-міметиків із бронхорозширювальним ефектом (пермісивна дія).

Тривале лікування високими дозами призводить до інволюції імунної системи та кори надниркових залоз.

Мінералокортикоїдна дія (значна для гідрокортизону, відчутна для преднізону) може потребувати контролю електролітів сироватки крові.

Вплив преднізону на порушення прохідності дихальних шляхів балансується на уповільненні запальних процесів, пригніченні або профілактиці набряку слизової оболонки, гальмуванні бронхіального стенозу, гальмуванні або зменшенні утворення слизу та зменшенні в'язкості слизу. В основі даного ефекту лежить наступний механізм: зменшення проникності судин та стабілізація мембрани, нормалізація чутливості м'язів бронхів до  $\beta_2$ -симпатоміметиків, якщо вона зменшилася через їх постійне застосування, пригнічення реакції типу I, починаючи з другого тижня лікування.

*Фармакокінетика.*

Абсорбція: незабаром після введення супозиторія Ректодельт 100 можливо визначити рівень кортикоїдів у плазмі крові.

Метаболізм: після введення преднізон швидко метаболізується до преднізолону. Загалом преднізон і преднізолон в організмі взаємно конвертуються один в один, при цьому більшу частку становить преднізолон. Абсолютна біодоступність становить близько 29 %.

Розподіл: преднізолон зв'язується з транскортином та білками плазми. Об'єм розподілу становить приблизно 1,5 мл/хв/кг.

Виведення: близько 2-5 % абсорбованої дози виділяється із сечею у вигляді преднізону, приблизно 11-24 % – у вигляді преднізолону, а решта – у вигляді інших метаболітів.

**Клінічні характеристики.**

**Показання.** Супозиторії Ректодельт 100 призначати дітям для інтенсивної терапії псевдокрупу (гострий стенозний ларинготрахеїт), крупу, спастичного бронхіту.

**Противоказання.** Відома гіперчутливість до преднізону або до будь-якого інгредієнта препарату. При короткочасному застосуванні преднізону для лікування гострих, потенційно загрозливих для життя та ургентних станів інших протипоказань немає.

Для преднізолону:

гіперчутливість до компонентів препарату.

Паразитарні та інфекційні захворювання вірусної, грибкової або бактерійної етіології, що існують зараз або нещодавно перенесені: простий герпес, оперізувальний герпес (віремічна фаза), вітряна віспа, кір; амебіаз, стронгілоїдоз (встановлений або підозрюваний); системний мікоз; активний або латентний туберкульоз.

Поствакцинальний період (тривалість 10 тижнів: 8 тижнів до та 2 тижні після вакцинації), лімфаденіт після щеплення БЦЖ.

Імунодефіцитні стани, викликані ВІЛ-інфекцією.

Захворювання серцево-судинної системи: нещодавно перенесений інфаркт міокарда, декомпенсована хронічна серцева недостатність, артеріальна гіпертензія, схильність до тромбоемболічної хвороби.

Захворювання ендокринної системи: цукровий діабет та порушення толерантності до вуглеводів, тиреотоксикоз, гіпотиреоз, хвороба Іценка-Кушинга.

Тяжка хронічна ниркова і/або печінкова недостатність, нефроуролітиаз.

Гіпоальбумінемія. Системний остеопороз. Miasthenia gravis. Гострий психоз. Ожиріння (III-IV ст.). Поліомієліт (за винятком форми бульбарного енцефаліту). Відкрито- та закритокутова глаукома.

**Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.** Ферментативні індуктори, такі як барбітурати, фенітоїн, примідон, карбамазепін, рифампіцин, можуть послаблювати ефекти Ректодельту 100.

Естрогени можуть посилити клінічні та токсичні ефекти Ректодельту 100.

Одночасне застосуванні Ректодельту 100 та атропіну або інших антихолінергічних препаратів з антигістамінними лікарськими засобами, нітратами, може спричинити підвищення внутрішньоочного тиску, зниження ефективності антигістамінних препаратів.

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

Ефекти антидіабетичних засобів, інсуліну та похідних кумарину можуть послаблюватися при сумісному прийомі з Ректодельтом 100.

Одночасний прийом серцевих глікозидів може посилювати глікозидну активність, пов'язану з стероїдіндукованою втратою калію.

Одночасне застосування з антацидами знижує всмоктування преднізону та преднізолону.

При одночасному застосуванні з салуретичними засобами, проносними засобами, амфотерицином В можливе збільшення втрати калію. Посилює ризик розвитку остеопорозу при одночасному застосуванні з амфотерицином В та інгібіторами карбоангідази.

Кортикостероїди можуть призвести до зменшення концентрації ізоніазиду, мексилетину, празиквантелю в крові.

У випадку одночасного застосування інгібіторів АПФ збільшується ризик зміни гемограми. Зниження ефективності гіпотензивних препаратів.

Хлорокін, гідрохлорокін та мефлокін можуть збільшувати ризик виникнення міопатій, кардіоміопатій.

Ефект соматотропіну може зменшитися.

ТТГ-збільшувальний ефект протиреліну може зменшуватися.

Збільшується рівень циклоспорину в крові, збільшується ризик судом церебрального генезу.

Трициклічні антидепресанти можуть посилити ознаки депресії, спричиненої прийомом преднізолону, та підвищити внутрішньоочний тиск.

Імуносупресанти можуть підвищити ризик розвитку інфекцій та лімфоми або інших лімфопроліферативних порушень, пов'язаних з вірусом Епштейна-Барра.

Нейролептики, карбутамід, азатіоприн збільшують ризик розвитку катаракти.

Естрогени, анаболічні препарати, пероральні контрацептиви можуть спричинити прояви гірсутизму та вугрів.

Живі противірусні вакцини та на тлі інших видів імунізацій – можливе збільшення ризику активації вірусів та розвитку інфекцій.

Однчасне застосування з міорелаксантами на тлі гіпокаліємії – збільшення вираженості та тривалості м'язової блокади на тлі застосування міорелаксантів;

з антихолінергічними засобами – виникнення м'язової слабкості у хворих на міастенію (особливо у пацієнтів з *miasthenia gravis*);

з мітотаном та іншими інгібіторами функції кори надниркових залоз – можуть зумовлювати підвищення дози препарату;

з протиблювальними засобами – посилення протиблювального ефекту;

з фторхінолонами – пошкодження сухожилля.

При тривалій терапії преднізолон підвищує вміст фолієвої кислоти.

Препарат знижує вплив вітаміну D на всмоктування  $Ca^{2+}$  у порожнині кишечника.

**Особливості застосування.** Препарат Ректодельт 100 слід застосовувати у першу чергу при гострих станах. Як і щодо всіх інших глюкокортикоїдів, застосування Ректодельту 100 можливе тільки при ретельному аналізі співвідношення ризик/користь. Тривале застосування (більше 2 днів) можливе тільки під суворим контролем лікаря.

Під час прийому препарату Ректодельт 100 можливий позитивний тест на допінг.

**Застосування у період вагітності або годування груддю.** Немає достатніх даних щодо застосування Ректодельт 100 у період вагітності. У дослідженнях на тваринах систематичне застосування преднізону спричинило ембріотоксичний та тератогенний ефект. Типові ембріотоксичні та тератогенні ефекти, які спостерігалися у дослідженнях на тваринах з застосуванням інших глюкокортикоїдів, окрім преднізону, були вовча паща, аномалії розвитку скелета, уповільнення внутрішньоутробного розвитку, летальність в ембріональному періоді.

Також відзначалося збільшення ризику розвитку вовчої пащі зародка у людини у результаті системного застосування глюкокортикоїдів у період I триместру. Досліди на тваринах також показали, що застосування субтератогенних доз у період вагітності сприяє збільшенню ризику уповільнення внутрішньоутробного розвитку, серцево-судинним захворюванням та метаболічним розладам у дорослих та тривалим змінам щільності рецептора глюкокортикоїду, передачі нервових імпульсів та реакцій.

Якщо глюкокортикоїди застосовувати у III триместрі, існує ризик розвитку атрофії кори надниркових залоз. У даному випадку потрібно зменшити замісну терапію новонародженого. Таким чином, Ректодельт 100 можна застосовувати у період вагітності тільки після ретельного аналізу співвідношення ризик/користь.

Преднізон та преднізолон проникає у грудне молоко. Дані про негативний вплив на новонародженого відсутні. Якщо необхідне застосування більш високих доз, годування груддю необхідно припинити.

**Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.** Ректодельт 100 не впливає на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

**Спосіб застосування та дози.** Дітям віком від 6 місяців застосовувати 1 супозиторій на добу, що відповідає 100 мг преднізону. Термін застосування залежить від перебігу хвороби. При гострих станах загалом достатньо короткотермінової терапії. При необхідності лікування повторити один раз. Подальше застосування не рекомендується. Лікування

супозиторіями Ректодельт 100 не має перевищувати 2 днів (що відповідає 200 мг преднізону).

Супозиторії слід вводити глибоко у пряму кишку.

Ректальне застосування особливо рекомендується маленьким дітям, коли внутрішньовенне, внутрішньом'язове або пероральне введення глюкокортикоїдів спричиняє труднощі і додатковий стрес у дітей.

Забороняється перевищувати дозу препарату та тривалість лікування препаратом. У випадку недотримання рекомендацій можливе виникнення тяжких побічних реакцій (див. розділ «Побічні реакції»).

**Діти.** Препарат застосовувати дітям віком від 6 місяців.

**Передозування.** Гостра інтоксикація преднізоном до цього часу не описана. Ризик передозування збільшується при тривалому використанні препарату, особливо у великих дозах.

У випадку передозування слід врахувати можливість посилення прояву побічних реакцій, головним чином з боку ендокринної системи, порушення метаболізму та електролітного балансу.

**Симптоми:** підвищення артеріального тиску, периферичні набряки, збільшення побічних ефектів.

**Лікування передозування:** негайне промивання шлунка або викликання блювання. Специфічного антидоту немає.

**Побічні реакції.** У випадку невідкладної терапії єдиною можливою побічною реакцією може бути:

*з боку імунної системи:* гіперчутливість до Ректодельту 100.

Довготривале застосування глюкокортикоїдів може спричинити такі побічні реакції:

*з боку ендокринної системи:* синдром Іценка-Кушинга різної інтенсивності з такими проявами як місяцеподібне обличчя, ожиріння, можливий розвиток діабетичного метаболічного синдрому, гіперглікемія аж до розвитку стероїдного діабету, виснаження (аж до атрофії) функції кори надниркових залоз, затримка росту у дітей, порушення секреції статевих гормонів, гірсутизм, зміна гемограми;

*з боку обміну речовин:* гіпокаліємія, затримка натрію та рідини в організмі, негативний азотистий баланс;

*з боку серцево-судинної системи:* підвищення артеріального тиску;

*з боку системи зсідання крові:* підвищення зсідання крові;

*з боку кістково-м'язової системи:* асептичний некроз кісток, остеопороз, атрофія м'язів;

*з боку травної системи:* шлункові або кишкові виразки (внаслідок ульцерогенної дії на шлунково-кишковий тракт та підвищення кислотності шлункового соку), панкреатит;

*з боку шкіри:* зміни шкіри (атрофія шкіри, телеангіоектазії, стрії, вугрові висипання; гематоми, синці, зміна кольору шкіри);

*з боку серцево-судинної системи:* ламкість судин;

*з боку органів зору:* стероїдна катаракта, провокування латентної глаукоми;

*з боку центральної нервової системи:* психічні порушення.

Ефекти, зумовлені імунодепресивною дією: зниження опору інфекціям, уповільнене загоєння ран.

Для преднізолону:

Частота розвитку та вираженість побічних ефектів залежать від тривалості застосування, величини використовуваної дози та можливості дотримання циркадного ритму призначення:

*з боку серцево-судинної системи:* аритмія, брадикардія, артеріальна гіпертензія, розвиток або збільшення проявів хронічної серцевої недостатності, ЕКГ-зміни, характерні для гіпокаліємії. У хворих із гострим та підгострим інфарктом міокарда – розповсюдження вогнища некрозу, уповільнення формування рубця, що може призвести до розриву серцевого м'яза;

*з боку системи крові та лімфатичної системи:* лейкоцитурія, гіперкоагуляція, що приводить до тромбозів та тромбоемболій;

*з боку нервової системи:* головний біль, запаморочення, псевдопухлина мозочка, підвищення внутрішньочерепного тиску, судоми;

*з боку органів зору:* задня субкапсулярна катаракта, підвищення внутрішньоочного тиску з можливим пошкодженням зорового нерва, схильність до розвитку вторинних бактерійних, грибкових або вірусних інфекцій очей, трофічні зміни рогівки, екзофтальм;

*з боку травного тракту:* нудота, блювання, біль в епігастрії, діарея, панкреатит, «стероїдна» виразка шлунка та дванадцятипалої кишки, ерозивний езофагіт, кровотечі та перфорації шлунково-кишкового тракту, підвищення або зниження апетиту, метеоризм, гикавка. В окремих випадках – підвищення активності «печінкових» трансаміназ та лужної фосфатази;

*з боку шкіри та підшкірної клітковини:* сповільнення процесу регенерації, петехії, синці, гематоми, екхімози, стрії, потоншення шкіри, гіпер- або гіпопигментація, вугри, схильність до розвитку піодермії;

*з боку опорно-рухового апарату та сполучної тканини:* уповільнення росту та процесів окостеніння у дітей (передчасне закриття епіфізарних зон зросту), остеопороз, дуже рідко – патологічні переломи кісток, асептичний некроз голівки плечової або стегнової кістки; розрив сухожилків м'язів, «стероїдна» міопатія, зменшення м'язової маси (атрофія);

*з боку ендокринної системи:* зниження толерантності до глюкози, «стероїдний» цукровий діабет або маніфестація латентного цукрового діабету, пригнічення гіпоталамо-гіпофізарно-надниркової системи, порушення менструального циклу, уповільнення росту у дітей та підлітків, затримка статевого розвитку у дітей, синдром Іценка-Кушинга (місяцеподібне обличчя, ожиріння гіпофізарного типу, гірсутизм, підвищення артеріального тиску, дисменорея, аменорея, міастенія, стрії);

*з боку обміну речовин:* гіпокальціємія, негативний азотистий баланс (підвищений розпад білків), підвищення маси тіла. Побічні ефекти, зумовлені глюкокортикостероїдною активністю преднізолону: затримка рідини і  $\text{Na}^+$  (периферичні набряки), гіпернатріємія, гіпокаліємічний синдром – аритмія, міалгія або спазм м'язів, незвичайна слабкість і стомлюваність;

*інфекції та інвазії:* зниження стійкості до інфекцій;

*з боку імунної системи:* висип, свербіж, гіперемія, кропив'янка, набряк Квінке, анафілактичний шок;

*з боку психіки:* делірій, дезорієнтація, ейфорія, галюцинації, маніакально-депресивний психоз, депресія, параноя, нервозність, неспокій, безсоння;

*інше:* синдром відміни, набряки, афтозні виразки, підвищення ризику виникнення уролітів.

**Термін придатності.** 3 роки.

**Умови зберігання.** Зберігати при температурі не вище 25 °С.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

**Упаковка.** По 2 або 6 супозиторіїв у блістері, вкладеному у картонну коробку.

**Категорія відпуску.** За рецептом.

**Виробник.** Троммсдорфф ГмбХ енд Ко. КГ, Німеччина.

**Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.**

Троммсдорффштрассе 2-6, 52477, Алсдорф, Німеччина