Инструкция по применению
Эманера Капсулы 20 мг 28 шт

Характеристики

Форма выпуска: Капсулы
Страна: Словения
Производитель: KPKA
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Эзомепразол
Количество в упаковке: 28
Дозировка действующего вещества: 20 мг
Срок годности: 24.0



Действующее вещество

Эзомепразол

Состав

Активное вещество: эзомепразол магния 40 мг. Вспомогательные вещества: сахарная крупка (содержит сахарозу и патоку крахмальную) - 71,16 мг; повидон К30 - 15 мг; натрия лаурилсульфат - 1,8 мг. Оболочка пеллет: Opadry II белый 85F28751 (поливиниловый спирт - 18,752 мг; титана диоксид (Е171) - 11,72 мг; макрогол 3000 - 9,47 мг; тальк - 6,938 мг) - 46,88 мг; магния гидроксикарбонат (магния карбонат тяжелый) - 6 мг; метакриловой кислоты и этилакрилата сополимер (1:1); дисперсия 30%* - 254,98 мг; тальк - 23,85 мг; макрогол 6000 - 7,65 мг; титана диоксид (Е171) - 7,65 мг; полисорбат 80 - 3,44 мг. Пустые желатиновые капсулы корпус: краситель железа оксид красный (Е172) - 0,114 мг; титана диоксид (Е171) - 0,458 мг; желатин** - 45,028 мг. Крышечка: краситель железа оксид красный (Е172) - 0,076 мг; титана диоксид (Е171) - 0,305 мг; желатин** - 30,019 мг. *дисперсия Eudragit L30D содержит помимо метакриловой кислоты, этилакрилата сополимера и воды, также натрия лаурилсульфат (0,7% из расчета на твердое вещество в дисперсии) и полисорбат 80 (2,3% из расчета на твердое вещество в дисперсии) в качестве эмульгаторов **содержит в среднем 14,5% воды (потеря в массе при высушивании)

Форма выпуска

Капсулы

Фармакокинетика

Всасывание и распределение Эзомепразол неустойчив в кислой среде, поэтому принимается внутрь в виде кишечнорастворимых капсул, содержащих пеллеты препарата, оболочка которых также устойчива к действию желудочного сока. В условиях in vivo незначительная часть эзомепразола переходит в R-изомер. Эзомепразол быстро всасывается, достигая Cmax в плазме крови примерно через 1–2 ч после приема внутрь. Абсолютная биодоступность составляет 64% после приема однократной дозы 40 мг и возрастает до 89% на фоне ежедневного приема эзомепразола 1 раз в сутки. Биодоступность для эзомепразола в дозе 20 мг составляет 50 и 68% соответственно. Vss у здоровых добровольцев составляет примерно 0,22 л /кг. Связь с белками плазмы крови - 97%. Прием пищи замедляет и снижает всасывание эзомепразола, что не имеет существенного клинического значения. Метаболизм и выведение Эзомепразол полностью метаболизируется с участием системы изоферментов цитохрома Р450 в печени. Бóльшая часть метаболизируется с участием полиморфного изофермента CYP2C19, который отвечает за образование гидрокси- и деметилированных метаболитов. Остальная часть эзомепразола метаболизируется изоферментом CYP3A4, отвечающего за образование сульфона эзомепразола, основного метаболита в плазме крови. Общий плазменный клиренс после приема однократной дозы составляет примерно 17 и 9 л/ч - после многоразового приема. T1/2 составляет 1,3 ч при длительном приеме препарата 1 раз в сутки. AUC увеличивается при повторном приеме. Дозозависимое увеличение AUC при повторном применении носит нелинейный характер вследствие снижения метаболизма при первом прохождении через печень, снижения клиренса, вероятно вызванного ингибированием изофермента CYP2C19 эзомепразолом и/или его сульфосодержащим метаболитом. При однократном ежедневном приеме эзомепразол полностью выводится из плазмы крови в перерыве между приемами. Эзомепразол не кумулирует. Основные метаболиты эзомепразола не влияют на секрецию соляной кислоты в желудке. Почти 80% принятой внутрь дозы эзомепразола выводится почками в виде метаболитов, а остальная часть - через кишечник. В моче обнаруживается менее 1% неизмененного эзомепразола. Фармакокинетика у отдельных групп пациентов Примерно у (2,9±1,5)% населения снижена активность изофермента CYP2C19. У таких пациентов метаболизм эзомепразола осуществляется преимущественно изоферментом CYP3A4. После многократного приема эзомепразола в дозе 40 мг 1 раз в сутки среднее значение AUC примерно в 2 раза выше, чем у пациентов со сниженной активностью CYP2C19. Среднее значение плазменной Cmax

при этом увеличивается примерно на 60%. У пациентов пожилого возраста (71–80 лет) метаболизм эзомепразола существенно не изменяется. После однократного приема 40 мг эзомепразола среднее значение AUC у женщин примерно на 30% выше, чем у мужчин. В дальнейшем при систематическом ежедневном приеме эзомепразола 1 раз в сутки различий в фармакокинетике у пациентов обоих полов не наблюдалось. Указанные особенности не влияют на дозу и способ применения препарата. Метаболизм эзомепразола может быть нарушен у людей с легкими или умеренными нарушениями функции печени. Скорость метаболизма снижена при тяжелых нарушениях функции печени, что сопровождается двукратным увеличением AUC. Поэтому максимальная суточная доза эзомепразола у этих пациентов составляет 20 мг. Изучение у пациентов со сниженной функцией почек не проводилось. Поскольку через почки происходит выведение не самого эзомепразола, а его метаболитов, метаболизм эзомепразола у этих пациентов не изменяется. После повторного приема 20 и 40 мг эзомепразола уровни AUC и времени достижения Cmax у детей в возрасте 12–18 лет и взрослых были одинаковы.

Показания

Гастроэзофагеальная рефлюксная болезнь (ГЭРБ): - лечение эрозивного рефлюкс-эзофагита; - длительное поддерживающее лечение после заживления эрозивного рефлюкс-эзофагита с целью профилактики рецидивов; - симптоматическое лечение ГЭРБ; язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки; в составе комбинированной антибактериальной терапии с целью эрадикации Helicobacter pylori: - язвенная болезнь двенадцатиперстной кишки, ассоциированная с Helicobacter pylori; - профилактика рецидивов пептической язвы, ассоциированной с Helicobacter pylori; пациенты, длительно принимающие НПВП: - заживление язвы желудка, связанной с приемом НПВП; - профилактика язвы желудка и двенадцатиперстной кишки, связанной с приемом НПВП, у пациентов, относящихся к группе риска; длительная профилактика рецидивов повторных кровотечений из пептических язв (после в/в применения ЛС, понижающих секрецию желудочных желез); синдром Золлингера-Эллисона и другие состояния, характеризующиеся повышенной желудочной секрецией, в т.ч. идиопатическая гиперсекреция.

Способ применения и дозы

Внутрь, не разжевывая, запивая небольшим количеством жидкости. Для пациентов с затрудненным глотанием содержимое капсул высыпать в половину стакана негазированной воды, размешать и выпить сразу или в течение 30 мин. Затем снова наполнить стакан водой наполовину, ополоснуть стенки стакана и выпить. Не следует смешивать препарат с другими жидкостями, т.к. это может привести к растворению

защитной оболочки пеллет. Пеллеты не следует разжевывать или раздавливать. Пациентам, которые не могут самостоятельно глотать, содержимое капсул следует растворить в негазированной воде и ввести эзомепразол через назогастральный зонд. Необходимо проверить соответствие шприца для введения препарата и зонда. Указания по подготовке и введению препарата через назогастральный зонд приведены в подразделе «Введение препарата через назогастральный зонд». Взрослые и подростки старше 12 лет ГЭРБ: - Эрозивный рефлюксный эзофагит (лечение): 40 мг 1 раз в сутки в течение 4 нед. Если после первого курса терапии заживление эзофагита не наступает или сохраняются симптомы, рекомендуется дополнительный 4-недельный курс лечения эзомепразолом. - Длительное поддерживающее лечение после заживления эрозивного рефлюкс-эзофагита для предотвращения рецидива: 20 мг 1 раз в сутки. - Симптоматическое лечение ГЭРБ: 20 мг 1 раз в сутки - пациентам без эзофагита. Если после 4 нед. терапии не удалось добиться контроля симптомов, необходимо провести повторное обследование пациента. После устранения симптомов можно продолжить прием препарата Эманера по требованию, т.е. принимать по 20 мг препарата 1 раз в сутки при возникновении симптомов. Пациентам, принимающим НПВП, относящимся к группе риска развития язвы желудка или двенадцатиперстной кишки, не рекомендуется лечение в режиме по требованию. Взрослые пациенты Язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки В составе комбинированной антибактериальной терапии с целью эрадикации Helicobacter pylori: - Язвенная болезнь двенадцатиперстной кишки, ассоциированная с Helicobacter pylori и профилактика рецидивов пептической язвы, ассоциированной с Helicobacter pylori (в состав комбинированной эрадикационной терапии Helicobacter pylori входят: Эманера 20 мг, амоксициллин 1 г и кларитромицин 500 мг). Все препараты принимаются 2 раза в сутки 7–14 дней. Пациенты, длительно принимающие НПВП: - Заживление язвы желудка, связанной с приемом НПВП: 20 мг или 40 мг 1 раз в сутки в течение 4–8 нед. - Профилактика язвы желудка и двенадцатиперстной кишки, связанной с приемом НПВП у пациентов, относящихся к группе риска: препарат Эманера 20 мг или 40 мг 1 раз в сутки. Длительная профилактика рецидивов повторных кровотечений из пептических язв (после внутривенного применения ЛС, понижающих секрецию желудочных желез): препарат Эманера 40 мг 1 раз в сутки в течение 4 нед. после начатой в/в профилактики повторных кровотечений. Синдром Золлингера-Эллисона и другие состояния, характеризующиеся повышенной желудочной секрецией, в т.ч. идиопатическая гиперсекреция: начальная доза препарата Эманера 40 мг 2 раза в сутки. Дозу препарата и длительность лечения подбирают индивидуально в зависимости от клинической картины заболевания. Заболевание у большинства пациентов контролируется приемом препарата в дозе от 80 до 160 мг/сут. При необходимости применения препарата Эманера свыше 80 мг/сут, суточная доза делится на два

приема. Нарушение функции почек. Пациентам с нарушением функции почек изменения дозы не требуется. Опыт применения эзомепразола у пациентов с тяжелой почечной недостаточностью ограничен; в связи с этим при назначении препарата таким пациентам следует соблюдать осторожность. Нарушение функции печени. Пациентам с легкими или умеренными нарушениями функции печени изменения дозы не требуется. При тяжелой печеночной недостаточности максимальная суточная доза не должна превышать 20 мг. Пациенты пожилого возраста. Пациентам пожилого возраста коррекция дозы не требуется. Введение препарата через назогастральный зонд При назначении препарата через назогастральный зонд необходимо: 1. Открыть капсулу и высыпать содержимое капсулы в специальный шприц. Добавить в шприц 25 мл питьевой воды и примерно 5 мл воздуха. Для некоторых зондов может потребоваться разведение препарата в 50 мл питьевой воды для того, чтобы предотвратить засорение зонда пеллетами, содержащимися в капсуле. 2. После добавления воды сразу же встряхнуть шприц до получения суспензии. 3. Убедиться, что наконечник не засорился (немного надавив на поршень, держа шприц в положении наконечником вверх). 4. Ввести наконечник шприца в зонд, продолжая удерживать его направленным вверх. 5. Встряхнуть шприц и перевернуть его наконечником вниз. Немедленно ввести 5–10 мл растворенного препарата в зонд. После введения раствора вернуть шприц в прежнее положение и встряхнуть (шприц должен удерживаться наконечником вверх, чтобы избежать засорения наконечника). 6. Вновь опустить шприц наконечником вниз и ввести еще 5–10 мл раствора в зонд. Повторить процедуру, пока шприц не будет пуст. 7. В случае остатка части препарата в виде осадка в шприце: наполнить шприц 25 мл воды и 5 мл воздуха и повторите процедуры, описанные в пунктах 5 и 6. Для некоторых зондов для этой цели может понадобиться 50 мл питьевой воды.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к эзомепразолу, замещенным бензимидазолам или компонентам препарата; одновременный прием с атазанавиром и нелфинавиром; наследственная непереносимость фруктозы; синдром глюкозо-галактозной мальабсорбции или дефицит сахарозы-изомальтозы; детский возраст до 12 лет (отсутствуют данные об эффективности и безопасности) и старше 12 лет - по другим показаниям, кроме гастроэзофагеальной рефлюксной болезни (ГЭРБ). С осторожностью: тяжелая почечная недостаточность (опыт применения ограничен).

Применение при беременности и кормлении грудью

Применение препарата Эманера при беременности возможно только в том случае, если ожидаемая польза для матери превышает возможный риск для плода, т.к. недостаточно данных о применении эзомепразола у беременных женщин. В эпидемиологических исследованиях во время применения рацемической смеси омепразола не выявлено фетотоксических эффектов или нарушений развития плода. В исследованиях с эзомепразолом у животных не выявлено прямое или опосредованное отрицательное воздействие на развитие эмбриона или плода; также не выявлено прямое или опосредованное отрицательное влияние на течение беременности, родов и постнатальный период новорожденного. В настоящее время неизвестно, выделяется ли эзомепразол с грудным молоком, поэтому не следует применять препарат Эманера в период кормления грудью.

Побочные действия

Со стороны нервной системы: часто - головная боль; нечасто - бессонница, головокружение, парестезии, сонливость; редко - депрессия, возбуждение, замешательство; очень редко - галлюцинации, агрессивное поведение. Со стороны дыхательной системы: редко - бронхоспазм. Со стороны пищеварительной системы: часто - боль в животе, запор, диарея, метеоризм, тошнота, рвота; нечасто - сухость слизистой оболочки полости рта, повышение активности печеночных ферментов; редко - стоматит, кандидоз ЖКТ, гепатит (с желтухой или без); очень редко - печеночная недостаточность, печеночная энцефалопатия у пациентов с заболеваниями печени в анамнезе. Со стороны мочевыделительной системы: очень редко - интерстициальный нефрит. Со стороны репродуктивной системы: очень редко - гинекомастия. Со стороны опорно-двигательного аппарата: редко - артралгия, миалгия; очень редко - мышечная слабость. Со стороны кожных покровов: нечасто - дерматит, кожная сыпь, кожный зуд, крапивница; редко - алопеция, фотосенсибилизация; очень редко - мультиформная эритема, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз. Со стороны органов кроветворения: редко - лейкопения, тромбоцитопения; очень редко - агранулоцитоз, панцитопения. Со стороны органов чувств: нечасто - нечеткость зрения; редко - изменение вкуса. Аллергические реакции: редко - реакции гиперчувствительности (например, лихорадка, ангионевротический отек, анафилактическая реакция/анафилактический шок). Лабораторные данные: редко - гипонатриемия; очень редко - гипомагниемия, гипокальциемия вследствие тяжелой гипомагниемии, гипокалиемия вследствие тяжелой гипомагниемии. Прочие: нечасто - периферические отеки; редко - потливость; очень редко - слабость (недомогание).

Передозировка

До настоящего времени случаи передозировки препарата Эманера не описаны. Прием внутрь эзомепразола в дозе 280 мг сопровождался общей слабостью и симптомами со стороны ЖКТ. Однократный прием внутрь 80 мг эзомепразола не сопровождался какими-либо симптомами. Специфический антидот не существует. Эзомепразол активно связывается с белками плазмы крови, поэтому гемодиализ малоэффективен. Лечение: в случае передозировки следует проводить симптоматическую терапию

Взаимодействие с другими препаратами

Лекарственные препараты, всасывание которых зависит от уровня pH. Снижение секреции соляной кислоты в желудке на фоне лечения эзомепразолом и другими ингибиторами протонного насоса может привести к изменению абсорбции препаратов, всасывание которых зависит от кислотности среды. Подобно антацидам и другим препаратам, снижающим кислотность желудочного сока, применение эзомепразола может приводить к снижению всасывания кетоконазола, итраконазола и эрлотиниба, и повышению всасывания таких препаратов, как дигоксин. Одновременный прием омепразола в дозе 20 мг 1 раз в сутки и дигоксина повышает биодоступность дигоксина на 10% (биодоступность дигоксина повышалась на величину до 30% у 2 из 10 пациентов). Известно о взаимодействии омепразола с некоторыми антиретровирусными препаратами. Механизм и клиническое значение этих взаимодействий не всегда известны. Снижение кислотности желудочного сока на фоне терапии омепразолом может влиять на всасывание антиретровирусных препаратов. Также возможно взаимодействие на уровне изофермента CYP2C19. На фоне терапии омепразолом отмечается снижение концентрации в сыворотке крови некоторых антиретровирусных препаратов (атазанавир и нелфинавир). Поэтому одновременное применение не рекомендуется. Одновременное применение омепразола (40 мг один раз в сутки) с атазанавиром 300 мг/ритонавиром 100 мг) у здоровых добровольцев сопровождается выраженным уменьшением экспозиции атазанавира (AUC, Cmax и Cmin в плазме крови снизились примерно на 75%). Увеличение дозы атазанавира до 400 мг не компенсировало воздействия омепразола на биодоступность атазанавира. При одновременном применении омепразола с саквинавиром повышается концентрация саквинавира в сыворотке крови. Учитывая сходные фармакокинетические и фармакодинамические свойства омепразола и эзомепразола, одновременное применение эзомепразола с антиретровирусными препаратами, такими как атазанавир и нелфинавир, не рекомендуется. Лекарственные препараты, метаболизирующиеся CYP2C19. Эзомепразол ингибирует CYP2C19, основной изофермент метаболизма эзомепразола. Таким образом, при

одновременном применении эзомепразола с препаратами, в метаболизме которых участвует изофермент CYP2C19, такими как диазепам, циталопрам, имипрамин, кломипрамин, фенитоин и т.д., может увеличиться концентрация этих препаратов в плазме крови и, соответственно, потребоваться уменьшение их дозы. Это особенно необходимо учитывать при назначении препарата Эманера в режиме по необходимости. Так, при одновременном применении с 30 мг эзомепразола снижается клиренс диазепама (субстрат изофермента CYP2C19) на 45%. Одновременное применение эзомепразола в дозе 40 мг приводит к повышению концентрации фенитоина в плазме крови у пациентов с эпилепсией на 13%. Рекомендуется контролировать концентрации фенитоина в плазме крови в начале терапии эзомепразолом и при его отмене. При применении омепразола в дозе 40 мг увеличивается Cmax и AUC вориконазола (субстрат изофермента CYP2C19) на 15 и 41%, соответственно. Время коагуляции при одновременном длительном приеме варфарина и эзомепразола в дозе 40 мг остается в допустимых пределах. Однако сообщалось о нескольких случаях клинически значимого повышения индекса МНО. Рекомендуется контролировать МНО в начале и по окончании одновременного применения эзомепразола и варфарина или других производных кумарина. Применение омепразола в дозе 40 мг приводило к увеличению Cmax и AUC цилостазола на 18 и 26 % соответственно; для одного из активных метаболитов цилостазола увеличение составило 29 и 69% соответственно. Одновременное применение эзомепразола в дозе 40 мг с цизапридом приводит к повышению значений фармакокинетических параметров цизаприда у здоровых добровольцев: AUC - на 32% и T1/2 - на 31%, однако Cmax при этом значительно не изменяется. Незначительное удлинение интервала QT на ЭКГ, которое наблюдается при монотерапии цизапридом, не увеличивалось при добавлении эзомепразола. У некоторых пациентов отмечали повышение концентрации метотрексата в сыворотке крови на фоне одновременного применения с ингибиторами протонного насоса. При применении высоких доз метотрексата следует рассмотреть возможность временной отмены эзомепразола. Эзомепразол не вызывает клинически значимых изменений фармакокинетики амоксициллина и хинидина. Одновременное непродолжительное применение эзомепразола и напроксена или рофекоксиба не выявило клинически значимого фармакокинетического взаимодействия. В клиническом исследовании изучали взаимодействие при применении клопидогрела (300 мг - нагрузочная доза, затем - 75 мг/сут) с омепразолом (80 мг) одномоментно, в одно и то же время в течение 5 дней. Активность тиолового метаболита (активного метаболита) клопидогрела была снижена на 46% (1-й день терапии) и 42% (5-й день терапии), при приеме клопидогрела и омепразола в одно время. При приеме клопидогрела и омепразола в одно время среднее подавление агрегации тромбоцитов (IPA) было уменьшено на 47% (в течение 24 ч терапии) и 30% (5-й день терапии). По результатам

другого исследования: омепразол при применении с клопидогрелом не одномоментно, в разное время, не оказывает ингибирующего действия на изофермент CYP2C19. В исследованиях были зарегистрированы противоречивые данные клинических проявлений взаимодействия с клопидогрелом по основным сердечно-сосудистым событиям. При одновременном применении с такролимусом возможно увеличение сывороточных концентраций такролимуса. Влияние лекарственных препаратов на фармакокинетику эзомепразола В метаболизме эзомепразола принимают участие изоферменты CYP2C19 и CYP3A4. При одновременном применении эзомепразола с кларитромицином (500 мг 2 раза в день) (ингибитор изофермента CYP3A4), увеличивается значение AUC эзомепразола в 2 раза. Одновременное применение эзомепразола и комбинированного ингибитора изоферментов CYP2C19 и CYP3A4, например вориконазола может сопровождаться увеличением AUC эзомепразола более чем в 2 раза. Обычно в таких ситуациях не требуется изменения дозы эзомепразола. У пациентов с тяжелыми нарушениями функции печени или при необходимости длительной терапии следует решить вопрос о снижении дозы эзомепразола. Лекарственные препараты, индуцирующие изоферменты CYP2C19 и CYP3A4, такие как рифампицин и препараты зверобоя продырявленного, при одновременном применении с эзомепразолом могут приводить к снижению концентрации эзомепразола в плазме крови за счет ускорения метаболизма эзомепразола.

Особые указания

При появлении тревожных симптомов (например таких как значительная спонтанная потеря массы тела, повторная рвота, дисфагия, рвота с примесью крови или мелена), а также при подозрении или выявлении язвы желудка необходимо исключить злокачественное новообразование, поскольку применение препарата Эманера может уменьшить выраженность симптомов и отсрочить постановку диагноза. Пациенты, длительно (особенно более года) принимающие препарат Эманера должны находиться под регулярным медицинским наблюдением. Пациенты, принимающие препарат по требованию должны быть информированы о необходимости обращения к врачу при изменении характера симптомов. Учитывая колебания концентрации эзомепразола в плазме крови при применении препарата в режиме по требованию, следует учитывать взаимодействия с другими лекарственными препаратами (см. «Взаимодействие»). При применении эзомепразола с целью эрадикации Helicobacter pylori следует учитывать возможное взаимодействие между компонентами тройной терапии. Кларитромицин является мощным ингибитором CYP3A4, поэтому следует учитывать противопоказания и лекарственное взаимодействие кларитромицина при назначении тройной терапии пациентам, одновременно принимающим препараты, метаболизирующиеся CYP3A4, такие как цизаприд. Препарат Эманера содержит сахарозу, поэтому его применение противопоказано пациентам с наследственной непереносимостью фруктозы, синдромом глюкозо-галактозной мальабсорбции или дефицитом сахарозы-изомальтазы. Влияние на способность управлять автотранспортом и другими сложными механизмами. Препарат Эманера не влияет на управление транспортными средствами и работу с другими техническими устройствами, требующую повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций

Условия хранения

Беречь от детей