Инструкция по применению
Рабепразол-СЗ Капсулы 20 мг 28 шт

Характеристики

Форма выпуска: Капсулы
Страна: Россия
Производитель: Северная Звезда
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Рабепразол
Количество в упаковке: 28
Дозировка действующего вещества: 20 мг



Описание

Средство понижающее секрецию желез желудка - протонной помпы ингибитор

Действующее вещество

Рабепразол

Состав

рабепразол пеллеты 236 мг, что соответствует содержанию рабепразола натрия 20 мг Вспомогательные вещества ядра пеллет: сахарная крупка (сахароза, патока крахмальная) - 142.94 мг, натрия карбонат - 3.3 мг, тальк - 3.54 мг, титана диоксид - 1.66 мг, гипромеллоза (гидроксиметилцеллюлоза) - 29.5 мг. Состав оболочки пеллет: гипромеллозы фталат (гидроксипропилметилфталатцеллюлоза) - 31.86 мг, цетиловый спирт - 3.2 мг. Состав корпуса капсулы: титана диоксид - 1%, железа оксид желтый - 0.192%, желатин - до 100%. Состав крышечки капсулы: железа оксид черный - 0.53%, железа оксид красный - 0.93%, титана диоксид - 0.3333%, железа оксид желтый - 0.2%, желатин - до 100%.

Форма выпуска

Капсулы

Фармакокинетика

Всасывание Рабепразол быстро абсорбируется из кишечника, Cmax в плазме

достигается примерно через 3.5 ч после приема в дозе 20 мг. Изменение Cmax в плазме и значений AUC рабепразола носят линейный характер в диапазоне доз от 10 до 40 мг. Абсолютная биодоступность после приема внутрь в дозе 20 мг (по сравнению с в/в введением) составляет около 52%. Кроме того, биодоступность не изменяется при многократном приеме рабепразола. Ни время приема препарата в течение суток, ни антациды не влияют на абсорбцию рабепразола. Прием препарата с жирной пищей замедляет абсорбцию рабепразола на 4 ч и более, однако ни Cmax, ни степень абсорбции не изменяются. Распределение У человека степень связывания рабепразола с белками плазмы составляет около 97%. Метаболизм и выведение У здоровых добровольцев T1/2 из плазмы составляет около 1 ч (варьируя от 0.7 до 1.5 ч), а суммарный клиренс составляет 3.8 мл/мин/кг. После приема однократной пероральной дозы 20 мг 14C-меченого рабепразола неизмененного препарата в моче найдено не было. Около 90% рабепразола выводится с мочой главным образом в виде двух метаболитов: конъюгата меркаптуровой кислоты (M5) и карбоновой кислоты (M6), а также в форме двух неизвестных метаболитов, выявленных в ходе токсикологического анализа. Оставшаяся часть принятого рабепразола выводится с калом. Суммарное выведение составляет 99.8%. Эти данные свидетельствуют о небольшом выведении метаболитов рабепразола с желчью. Основным метаболитом является тиоэфир (M1). Единственным активным метаболитом является десметил (M3), однако он наблюдался в низкой концентрации только у одного участника исследования после приема рабепразола в дозе 80 мг. Фармакокинетика у особых групп пациентов У пациентов со стабильной почечной недостаточностью в терминальной стадии, которым необходим поддерживающий гемодиализ (КК <5 мл /мин/1.73 м2), выведение рабепразола схоже с таковым для здоровых добровольцев. AUC и Cmax у этих пациентов были примерно на 35% ниже, чем у здоровых добровольцев. В среднем T1/2 рабепразола составлял 0.82 ч у здоровых добровольцев, 0.95 ч у пациентов во время гемодиализа и 3.6 ч после гемодиализа. Клиренс препарата у пациентов с заболеваниями почек, нуждающихся в гемодиализе, был приблизительно в 2 раза выше, чем у здоровых добровольцев. У пациентов с хроническим поражением печени AUC увеличена вдвое по сравнению со здоровыми добровольцами, что свидетельствует о снижении эффекта "первого прохождения", а T1 /2 из плазмы увеличен в 2-3 раза. Пациенты с хроническим компенсированным циррозом печени переносят рабепразол в дозе 20 мг 1 раз/сут, хотя AUC удвоена и Cmax увеличена на 50% по сравнению со здоровыми добровольцами соответствующего пола. У пожилых пациентов элиминация рабепразола несколько замедлена. После 7 дней приема рабепразола по 20 мг/сут у пожилых пациентов AUC была примерно вдвое больше, а Cmax повышена на 60% по сравнению с молодыми здоровыми добровольцами. Однако признаков кумуляции рабепразола не отмечалось. У пациентов с замедленным метаболизмом CYP2C19 после 7 дней приема

рабепразола в дозе 20 мг/сут AUC увеличивается в 1.9 раза, а T1/2 в 1.6 раза по сравнению с теми же параметрами у "быстрых метаболизаторов", в то время как Cmax увеличивается на 40%.

Показания

язвенная болезнь желудка в стадии обострения и язва анастомоза, язвенная болезнь двенадцатиперстной кишки в стадии обострения, эрозивная и язвенная гастроэзофагеальная рефлюксная болезнь (ГЭРБ) у взрослых и детей с 12 лет или рефлюкс-эзофагит, поддерживающая терапия гастроэзофагеальной рефлюксной болезни, неэрозивная гастроэзофагеальная рефлюксная болезнь, синдром Золлингера-Эллисона и другие состояния, характеризующиеся патологической гиперсекрецией, в комбинации с соответствующей антибактериальной терапией для эрадикации Helicobacter pylori у пациентов с язвенной болезнью.

Способ применения и дозы

Препарат принимают внутрь. Капсулы следует глотать целиком. Установлено, что ни время суток, ни прием пищи не влияют на активность рабепразола. При язвенной болезни желудка в стадии обострения и язве анастомоза рекомендуется принимать внутрь по 10 мг или по 20 мг 1 раз/сут. Обычно излечение наступает после 6 недель терапии, однако в некоторых случаях длительность лечения может быть увеличена еще на 6 недель. При язвенной болезни двенадцатиперстной кишки в стадии обострения рекомендуется принимать внутрь по 20 мг 1 раз/сут. В некоторых случаях лечебный эффект наступает при приеме 10 мг 1 раз/сут. Длительность лечения составляет от 2 до 4 недель. В случае необходимости длительность лечения может быть увеличена еще на 4 недели. При лечении эрозивной гастроэзофагеальной рефлюксной болезни (ГЭРБ) или рефлюкс-эзофагите рекомендуется принимать внутрь по 10 мг или 20 мг 1 раз/сут. Длительность лечения составляет от 4 до 8 недель. В случае необходимости длительность лечения может быть увеличена еще на 8 недель. При поддерживающей терапии гастроэзофагеальной рефлюксной болезни (ГЭРБ) рекомендуется принимать внутрь по 10 мг или 20 мг 1 раз/сут. Длительность лечения зависит от состояния пациента. При неэрозивной гастроэзофагеальной рефлюксной болезни (НЭРБ) без эзофагита рекомендуется принимать внутрь по 10 мг или 20 мг 1 раз/сут. Если после 4 недель лечения симптомы не исчезают, следует провести дополнительное исследование пациента. После купирования симптомов для предупреждения их последующего возникновения следует принимать препарат внутрь в дозе 10 мг 1 раз/сут по требованию. Для лечения синдрома Золлингера-Эллисона и других состояний, характеризующихся патологической гиперсекрецией, дозу подбирают индивидуально. Начальная доза - 60 мг/сут, затем дозу повышают и

назначают препарат в дозе до 100 мг/сут при однократном приеме или по 60 мг 2 раза /сут. Для некоторых пациентов дробное дозирование препарата является предпочтительным. Лечение должно продолжаться по мере клинической необходимости. У некоторых пациентов с синдромом Золлингера-Эллисона длительность лечения рабепразолом составляла до одного года. Для эрадикации Helicobacter pylori рекомендуется принимать внутрь 20 мг 2 раза/сут по определенной схеме с соответствующей комбинаций антибиотиков. Длительность лечения составляет 7 дней. Пациентам с почечной недостаточностью коррекции дозы не требуется. У пациентов с печеночной недостаточностью легкой и средней степени тяжести концентрация рабепразола в крови обычно выше, чем у здоровых добровольцев. При назначении препарата пациентам с тяжелой степенью печеночной недостаточности следует соблюдать осторожность. Коррекции дозы у пациентов пожилого возраста не требуется. Безопасность и эффективность рабепразола в дозе 20 мг для краткосрочного (до 8 недель) лечения ГЭРБ у детей в возрасте 12 лет и более подтверждена экстраполяцией результатов адекватных и хорошо контролируемых исследований, подкрепляющих эффективность рабепразола для взрослых и исследованиями безопасности и фармакокинетики для пациентов детского возраста. Рекомендуемая доза для детей в возрасте 12 лет и более составляет 20 мг 1 раз/сут продолжительностью до 8 недель. Безопасность и эффективность рабепразола для лечения ГЭРБ у детей в возрасте младше 12 лет не установлена. Безопасность и эффективность рабепразола для применения по другим показаниям не установлена для пациентов детского возраста.

Противопоказания

беременность, период грудного вскармливания, возраст до 18 лет, детский возраст до 12 лет (при ГЭРБ), дефицит сахаразы/изомальтазы, непереносимость фруктозы, глюкозо-галактозная недостаточность, повышенная чувствительность к рабепразолу, замещенным бензимидазолам или к вспомогательным компонентам препарата. С осторожностью: тяжелая почечная недостаточность, тяжелая печеночная недостаточность.

Применение при беременности и кормлении грудью

Данных по безопасности применения рабепразола при беременности нет. Исследования репродуктивности на крысах и кроликах не выявили признаков нарушения фертильности или дефектов развития плода, обусловленных рабепразолом, однако у крыс в небольших количествах препарат проникает через плацентарный барьер. Рабепразол не следует применять при беременности. Неизвестно, выделяется ли рабепразол с грудным молоком. Соответствующие исследования по применению препарата в период грудного вскармливания не проводились. Вместе с тем, рабепразол обнаружен в молоке лактирующих крыс, поэтому препарат не следует применять женщинам в период грудного вскармливания.

Побочные действия

В ходе клинических исследований отмечались следующие нежелательные реакции при приеме рабепразола: головная боль, головокружение, астения, боль в животе, диарея, метеоризм, сухость во рту, сыпь. Нежелательные реакции систематизированы в соответствии с Классификацией ВОЗ: очень часто (>1/10), часто (>1/100, 1/1000, 1 /10 000, <1/1000), очень редко (<1/10 000), частота неизвестна (невозможно определить исходя из доступных данных). Со стороны иммунной системы: редко - острые системные аллергические реакции (включая отек лица, гипотензию, одышку). Со стороны системы кроветворения: редко - тромбоцитопения, нейтропения, лейкопения. Со стороны обмена веществ и питания: редко - анорексия, частота неизвестна - гипонатриемия, гипомагниемия. Со стороны нервной системы: часто - бессонница, головная боль, головокружение, нечасто - сонливость, нервозность, редко - депрессия, частота неизвестна - спутанность сознания. Со стороны органа зрения: редко - нарушение зрения. Со стороны сердечно-сосудистой системы: частота неизвестна - периферический отек. Со стороны дыхательной системы: часто - кашель, фарингит, ринит, нечасто - синусит, бронхит. Со стороны пищеварительной системы: часто - боль в животе, диарея, метеоризм, тошнота, рвота, запор, нечасто - диспепсия, отрыжка, сухость во рту, редко - стоматит, гастрит, нарушение вкуса. Со стороны гепатобилиарной системы: редко - гепатит, желтуха, печеночная энцефалопатия. Со стороны мочевыделительной системы: нечасто - инфекция мочевыводящих путей, редко - интерстициальный нефрит. Со стороны кожи и подкожных тканей: редко - буллезные высыпания, крапивница, очень редко - многоформная эритема, токсический эпидермальный некролиз, синдром Стивенса-Джонсона. Со стороны костно-мышечной системы: часто - боль в спине, нечасто - миалгия, артралгия, судороги мышц ног, перелом костей бедра, запястья или позвоночника. Со стороны репродуктивной системы: частота неизвестна - гинекомастия. Со стороны лабораторных и инструментальных исследований: редко - повышение активности печеночных трансаминаз, увеличение массы тела. Прочие: часто - инфекции.

Передозировка

Данные о намеренной или случайной передозировке минимальны. Лечение: специфический антидот для рабепразола неизвестен. Рабепразол хорошо связывается с белками плазмы, поэтому слабо выводится при диализе. При передозировке необходимо проводить симптоматическое и поддерживающее лечение.

Взаимодействие с другими препаратами

Рабепразол замедляет выведение некоторых лекарственных средств, метаболизирующихся в печени путем микросомального окисления (диазепам, фенитоин, непрямые антикоагулянты). Совместное применение рабепразола с кетоконазолом или итраконазолом может привести к значительному снижению концентрации противогрибковых препаратов в плазме крови. Не рекомендуется совместное применение ингибиторов протоновой помпы с атаназавиром, т.к. значительно снижаются эффекты атаназавира. Рабепразол ингибирует метаболизм циклоспорина. При одновременном приеме ингибиторов протоновой помпы и метотрексата можно предположить повышение концентрации последнего и/или его метаболита гидроксиметотрексата и увеличение T1/2. При одновременном применении рабепразола, амоксициллина и кларитромицина показатели AUC и Cmax для кларитромицина и амоксициллина были схожими при сравнении комбинированной терапии с монотерапией. Показатели AUC и Cmax рабепразола увеличивались на 11% и 34% соответственно, а AUC и Cmax 14-гидроксикларитромицина (активного метаболита кларитромицина) увеличивались на 42% и 46% соответственно. Данное увеличение показателей не было признано клинически значимым. Одновременное применение рабепразола и суспензий антацидов, содержащих алюминия и/или магния гидроксид не приводит к клинически значимому взаимодействию.

Особые указания

Ответ пациента на терапию рабепразолом не исключает наличие злокачественных новообразований в желудке. В специальном исследовании у пациентов с легкими или умеренными нарушениями функции печени не было обнаружено значимого отличия частоты побочных эффектов препарата Рабепразол-СЗ от таковой у подобранных по полу и возрасту здоровых лиц, но, несмотря на это, рекомендуется соблюдать осторожность при первом назначении препарата Рабепразол-СЗ пациентам с тяжелыми нарушениями функции печени. Пациентам с нарушениями функции почек или печени коррекция дозы препарата Рабепразол-СЗ не требуется. AUC рабепразола у пациентов с тяжелым нарушением функции печени примерно в 2 раза выше, чем у здоровых пациентов. Гипомагниемия При лечении ингибиторами протоновой помпы на протяжении по крайней мере 3 месяцев в редких случаях были отмечены случаи симптоматической или асимптоматической гипомагниемии. В большинстве случаев эти сообщения поступали через год после проведения терапии. Серьезными побочными явлениями были тетания, аритмия и судороги. Большинству пациентов требовалось лечение гипомагниемии, включающей замещение магния и отмену терапии ингибиторами протоновой помпы. У пациентов, которые получают длительное лечение или которые принимают ингибиторы протоновой помпы с препаратами, такими как дигоксин, или препаратами, которые могут вызвать гипомагниемию (например, диуретики), следует контролировать содержание магния до начала лечения ингибиторами протоновой помпы и в период лечения. Переломы Терапия ингибиторами протоновой помпы может привести к возрастанию риска связанных с остеопорозом переломов костей бедра, запястья или позвоночника. Риск переломов был увеличен у пациентов, получавших ингибиторы протоновой помпы в высоких дозах длительно (год и более). Одновременное применение рабепразола с метотрексатом Согласно литературным данным, одновременный прием ингибиторов протоновой помпы с метотрексатом (прежде всего в высоких дозах), может привести к повышению концентрации метотрексата и/или его метаболита гидроксиметотрексата и увеличить T1/2, что может привести к проявлению токсичности метотрексата. При необходимости применения метотрексата в высоких дозах следует рассмотреть возможность временного прекращения терапии ингибиторами протоновой помпы. Инфекции, вызванные Salmonella, Campylobacter и Clostridium difficile Терапия ингибиторами протоновой помпы может приводить к возрастанию риска желудочно-кишечных инфекций, таких как инфекции, вызванные Salmonella, Campylobacter и Clostridium difficile. Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами Исходя из особенностей фармакодинамики рабепразола и его профиля нежелательных эффектов, маловероятно, что Рабепразол-СЗ оказывает влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами. Однако в случае появления сонливости следует избегать этих видов деятельности.