Эзомепразол



Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр Википедия Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противоязвенное средство - ингибитор протонового насоса, правовращающий изомер омепразола. Снижает секрецию соляной кислоты в желудке путем специфического ингибирования протонного насоса в париетальных клетках. Являясь слабым основанием и переходя в активную форму в кислой среде секреторных канальцев париетальных клеток слизистой оболочки желудка, активируется и ингибирует протоновый насос - фермент H^+-K^+-АТФ-азу. Ингибирует как базальную, так и стимулированную секрецию хлороводородной (соляной) кислоты. Действие наступает через 1 ч после перорального приема 20 мг или 40 мг. При ежедневном применении в течение 5 дней в дозе 20 мг 1 раз/сут, средняя максимальная концентрация хлороводородной кислоты после стимуляции пентагастрином снижается на 90%.

Фармакокинетика

Неустойчив в кислой среде. In vivo лишь незначительная часть эзомепразола превращается в R-изомер. После приема внутрь быстро абсорбируется из ЖКТ. C_{max} в плазме крови достигается через 1-2 ч. Абсолютная биодоступность при повторном приеме в дозе 20 мг 1 раз/сут - 89%. V_d – 0.22 л/кг. Связывание с белками плазмы - 97%. Полностью метаболизируется при участии изоферментов системы цитохрома P_{450}. Основная часть метаболизируется при участии CYP2C19 с образованием гидрокси- и деметилированных метаболитов эзомепразола. Метаболизм оставшейся части осуществляется другим изоферментом CYP3A4; при этом образуется сульфопроизводное эзомепразола, являющееся основным метаболитом, определяемым в плазме. Все метаболиты фармакологически неактивны. У пациентов с активным изоферментом CYP2C19 (пациенты с активным метаболизмом) системный клиренс - 17 л/ч после однократного приема и 9 л/ч - после многократного приема. $T_{1/2}$ – 1.3 ч при систематическом приеме в режиме дозирования 1 раз/сут. AUC возрастает на фоне многократного приема (нелинейная зависимость дозы и AUC при систематическом приеме, что является следствием снижения метаболизма при "первом прохождении" через печень, а также снижения системного клиренса, вызванного ингибированием фермента CYP2C19 эзомепразолом и/или его сульфосодержащим метаболитом). Не кумулирует. Выводится до 80% дозы в виде метаболитов почками (менее 1% - в неизмененном виде), остальное количество - с желчью.

У пациентов с неактивным метаболизмом (1-2%) метаболизм эзомепразола в основном осуществляется при участии изофермента CYP3A4. При систематическом приеме в дозе 40 мг 1 раз/сут, средняя AUC на 100% превышает значение этого параметра у пациентов с активным метаболизмом. Средние значения C_{max} в плазме у пациентов с неактивным метаболизмом повышены приблизительно на 60%.

При тяжелой печеночной недостаточности скорость метаболизма снижена, что сопровождается увеличением AUC в 2 раза.

Показания к применению:

Гастроэзофагеальная рефлюксная болезнь: эрозивный рефлюкс-эзофагит (лечение), профилактика рецидивов у

пациентов с излеченным эзофагитом, симптоматическое лечение ГЭРБ.

В составе комбинированной терапии: эрадикация Helicobacter pylori, язвенная болезнь двенадцатиперстной кишки, ассоциированная с Helicobacter pylori, профилактика рецидива пептических язв у пациентов с язвенной болезнью, ассоциированной с Helicobacter pylori.

Относится к болезням:

- Рефлюкс-эзофагит
- Эзофагит
- Язвенная болезнь
- Язвенная болезнь двенадцатиперстной кишки

Противопоказания:

Период лактации, повышенная чувствительность к эзомепромазолу.

Способ применения и дозы:

Принимают внутрь. Доза составляет 20-40 мг 1 раз/сут. Длительность приема зависит от показаний, схемы лечения, эффективности.

При тяжелой печеночной недостаточности максимальная доза - 20 мг/сут.

Побочное действие:

Часто: головная боль, боли в животе, диарея, метеоризм, тошнота, рвота, запор.

Редко: дерматит, зуд, крапивница, головокружение, сухость во рту.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Данные о безопасности применения эзомепразола при беременности отсутствуют. Применение возможно в случаях, когда ожидаемая польза терапии для матери превышает возможный риск для плода.

В *экспериментальных исследованиях* на животных не выявлено какого-либо прямого или косвенного отрицательного воздействия на развитие эмбриона или плода. Введение рацемического вещества также не оказывало какого-либо отрицательного воздействия на животных при беременности, в период родов, а также в период постнатального развития.

Противопоказан в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Полагают, что при одновременном применении возможно повышение концентраций в плазме крови и усиление эффектов имипрамина, кломипрамина, циталопрама.

Полагают, что при одновременном применении возможно уменьшение концентраций в плазме крови и клинической эффективности итраконазола и кетоконазола.

При одновременном применении с кларитромицином описан случай значительного увеличения AUC эзомепразола вследствие угнетения его метаболизма под влиянием кларитромицина.

При одновременном применении возможно повышение концентраций в плазме крови диазепама и фенитоина, что, по-видимому, не имеет клинического значения.

Особые указания и меры предосторожности:

При наличии таких симптомов как значительная спонтанная потеря массы тела, частая рвота, дисфагия, рвота с

кровью или мелена, а также при наличии (или подозрении) язвы желудка следует исключить возможность злокачественного новообразования, поскольку лечение эзомепразолом может привести к сглаживанию симптоматики и, таким образом, задержать постановку правильного диагноза.

При длительной терапии следует регулярно контролировать состояние пациента.

Во время лечения ингибиторами протонного насоса уровень гастрина в плазме повышается в результате сниженной внутрижелудочной секреции хлористоводородной кислоты. У пациентов, принимающих ингибиторы протонного насоса в течение длительного времени, чаще отмечается образование железистых кист в желудке. Эти явления обусловлены физиологическими изменениями в результате ингибирования секреции хлористоводородной кислоты.

При нарушениях функции печени

При тяжелой печеночной недостаточности максимальная доза - 20 мг/сут.

Источник: http://drugs.thead.ru/Ezomeprazol