ГРИНТЕРОЛ



Код АТХ:

- A05AA02

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Урсодезоксихолевая кислота

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Капсулы, 250 мг. По 10 капс. в контурной ячейковой упаковке из пленки ПВХ и фольги алюминиевой. По 5 или 10 контурных ячейковых упаковок помещают в пачку из картона.

Состав:

Капсулы	1 капс.
активное вещество:	
урсодезоксихолевая кислота	250 мг
вспомогательные вещества: крахмал кукурузный — 73 мг; кремния диоксид — 5 мг; магния стеарат — 2 мг	
капсула (корпус и крышечка): титана диоксид (Е171) — 2%; желатин — до 100%	

Описание:

Твердые желатиновые капсулы №0, корпус и крышечка белого цвета. Содержимое — порошок белого или почти белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа:

- Органотропные средства
- Органотропные средства
- Метаболики

Фармакологические свойства:

Фармакологическое действие — холелитолитическое, желчегонное, гепатопротекторное.

Фармакодинамика

Гепатопротекторное средство, оказывает также желчегонное, холелитолитическое, гиполипидемическое, гипохолестеринемическое и некоторое иммуномодулирующее действие.

Встраивается в мембрану гепатоцита, стабилизирует ее структуру и защищает гепатоцит от повреждающего действия солей желчных кислот, снижая т.о. их цитотоксический эффект. При холестазе активирует Ca^{2+}-зависимую альфа-протеазу и стимулирует экзоцитоз, уменьшает концентрацию токсичных желчных кислот (в т.ч. хенодезоксихолевая, литохолевая, дезоксихолевая), концентрации которых у больных с хроническими заболеваниями печени повышены.

Конкурентно снижает всасывание липофильных желчных кислот в кишечнике, повышает их фракционный оборот при энтерогепатической циркуляции, индуцирует холерез, стимулирует пассаж желчи и выведение токсичных желчных кислот через кишечник. Экранирует неполярные желчные кислоты (хенодезоксихолевая), благодаря чему формируются смешанные (нетоксичные) мицеллы.

Снижает насыщение желчи Хс путем уменьшения синтеза и секреции Хс в печени и ингибирования его всасывания в кишечнике.

Повышает растворимость Хс в желчевыводящей системе, стимулирует образование и выделение желчи. Уменьшает литогенность желчи, увеличивает в ней концентрацию желчных кислот, вызывает усиление желудочной и панкреатической секреции, усиливает активность липазы, оказывает гипогликемическое действие. Вызывает частичное или полное растворение Хс-желчных камней при применении внутрь, уменьшает насыщенность желчи Хс, что способствует его мобилизации из желчных камней.

Оказывает иммуномодулирующее действие, влияет на иммунологические реакции в печени — уменьшает экспрессию некоторых антигенов гистосовместимости (HLA-1 на мембране гепатоцитов и HLA-2 на холангиоцитах), влияет на количество Т-лимфоцитов, образование ИЛ-2, уменьшает количество эозинофилов, подавляет иммунокомпетентные Ig (в первую очередь IgM).

Фармакокинетика

Всасывание и распределение

Абсорбция из тонкой кишки – высокая (около 90 %). Проникает через плацентарный барьер. C_{max} при приеме внутрь 50 мг через 30, 60, 90 мин – 3.8; 5.5; 3.7 ммоль/л соответственно. Время достижения C_{max} – 1-3 часа. Связывание с белками плазмы высокое.

Метаболизм и выведение

Метаболизируется в печени (клиренс при "первом прохождении" через печень) в тауриновый и глициновый конъюгаты, которые секретируются в желчь. Выводится на 50-70% через кишечник. Незначительное количество невсосавшейся урсодезоксихолевой кислоты поступает в толстый кишечник, где подвергается расщеплению бактериями (7-дегидроксилирование); образующаяся литохолевая кислота частично всасывается из толстой кишки, но сульфатируется в печени и быстро выводится в виде сульфолитохолилглицинового или сульфолитохолилтауринового конъюгатов.

Показания к применению:

— растворение мелких и средних холестериновых камней при функционирующем желчном пузыре;

— билиарный рефлюкс-гастрит;

— первичный билиарный цирроз печени при отсутствии признаков декомпенсации (симптоматическая терапия);

— хронические гепатиты различного генеза;

— первичный склерозирующий холангит;

— кистозный фиброз (муковисцидоз);

— неалкогольный стеатогепатит;

— алкогольная болезнь печени (АБП);

— дискинезия желчевыводящих путей.

Относится к болезням:

- Алкогольная болезнь печени
- Гастрит
- Гепатит
- Гепатоз
- Дискинезия желчевыводящих путей
- Муковисцидоз
- Склерит
- Фиброз
- Фиброма
- Холангит
- Холера
- Цирроз печени

Противопоказания:

— повышенная чувствительность к компонентам препарата;

— рентгеноположительные (с высоким содержанием Ca^{2+}) желчные камни;

— нефункционирующий желчный пузырь;

— острые воспалительные заболевания желчного пузыря, желчных протоков и кишечника;

— цирроз печени в стадии декомпенсации;

— выраженная печеночная и/или почечная недостаточность;

— панкреатит;

— детский возраст до 3 лет (для капсул).

С осторожностью применять у детей в возрасте от 3 до 4 лет, т. к. возможно затруднение при проглатывании капсул.

Способ применения и дозы:

Внутрь. Капсулы принимают вечером, не разжевывая, запивая небольшим количеством воды.

Растворение холестериновых камней желчного пузыря: средняя суточная доза – 10 мг/кг, что соответствует:

Масса тела (кг)	**Количество капсул**
До 60	2
61-80	3
81-100	4
Свыше 100	5

Курс лечения – 6-12 месяцев. Для профилактики повторного образования камней рекомендуется прием препарата в течение еще нескольких месяцев после растворения камней.

Лечение билиарного рефлюкс-гастрита: по одной капсуле 250 мг 1 раз/сут вечером. Курс лечения – от 10-14 дней до 6 месяцев, при необходимости – до 2 лет.

Симптоматическое лечение первичного билиарного цирроза при отсутствии признаков декомпенсации: 10-15 мг/кг (при необходимости – до 20 мг/кг) в сут в 2-3 приема в первые 3 месяца лечения. После улучшения печеночных

показателей суточную дозу можно применять один раз вечером.

Рекомендуется следующий режим применения:

Масса тела (кг)	**Суточная доза (кол-во капсул)**	**Утром**	**Днем**	**Вечером**
47-62	3	1	1	1
63-78	4	1	1	2
79-93	5	1	2	2
94-109	6	2	2	2
Свыше 100	7	2	2	3

Продолжительность курса лечения неограничена. В редких случаях в начале лечения могут ухудшиться клинические симптомы (участиться зуд). В этом случае следует применять по одной капсуле ежедневно, далее следует постепенно повышать дозировку (еженедельно увеличивая суточную дозу на одну капсулу) до тех пор, пока не будет достигнут рекомендованный режим дозирования.

Симптоматическое лечение хронических гепатитов различного генеза: суточная доза составляет 10-15 мг/кг в 2-3 приема. Длительность лечения – 6-12 месяцев и более.

Первичный склерозирующий холангит: по 12-15 мг/кг (до 20 мг/кг) массы тела в сут в 2-3 приема. Длительность применения – от 6 месяцев до нескольких лет.

Кистозный фиброз (муковисцидоз): по 20-30 мг/кг в сут в 2-3 приема. Длительность применения – от 6 месяцев до нескольких лет.

Неалкогольный стеатогепатит: средняя суточная доза составляет 10-15 мг/кг в 2-3 приема. Длительность применения – от 6-12 месяцев и более.

Детям в возрасте от 3 лет назначают индивидуально, из расчета 10-20 мг/кг в сут.

Алкогольная болезнь печени: средняя суточная доза – 10-15 мг/кг в 2-3 приема. Длительность терапии составляет 6-12 месяцев и более.

Дискинезия желчевыводящих путей: средняя суточная доза 10 мг/кг в 2 приема в течение от 2 недель до 2 месяцев. При необходимости курс лечения рекомендуется повторить.

Детям и взрослым с массой тела менее 47 кг рекомендуется применять препарат в суспензии других производителей.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: неоформленный стул или диарея. При лечении первичного билиарного цирроза могут наблюдаться острые боли в правой верхней части живота.

Со стороны печени и желчевыводящих путей: кальцинирование желчных камней. При лечении первичного билиарного цирроза может наблюдаться преходящая декомпенсация цирроза печени (проходит после отмены препарата).

Со стороны кожи и подкожных тканей: аллергические реакции (в т.ч. крапивница).

Передозировка:

Случаи передозировки урсодезоксихолевой кислоты не известны.

Применение при беременности и кормлении грудью:

В исследованиях на животных не выявлено мутагенного и канцерогенного действия, однако из-за отсутствия клинических исследований на беременных женщинах применение во время беременности возможно только в случае, если ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

Данные о выделении с грудным молоком отсутствуют, поэтому при необходимости применения в период лактации следует отказаться от кормления грудью.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Антациды, содержащие алюминия гидроксид, алюминия оксид и ионообменные смолы (колестирамин, колестипол),

снижают абсорбцию урсодезоксихолевой кислоты в кишечнике, таким образом, уменьшая ее эффективность; поэтому перечисленные препараты следует применять за 2 ч до приема урсодезоксихолевой кислоты.

Урсодезоксихолевая кислота может усилить поглощение циклоспорина из кишечника, поэтому при одновременном применении следует скорректировать дозу циклоспорина.

Урсодезоксихолевая кислота может снижать всасывание ципрофлоксацина.

Гиполипидемические лекарственные средства (особенно клофибрат), эстрогены, неомицин или прогестины, пероральные контрацептивы увеличивают насыщение желчи холестерином и могут снижать способность растворять холестериновые желчные конкременты.

Особые указания и меры предосторожности:

Лечение должно осуществляться под наблюдением врача.

При назначении с целью растворения желчных камней необходим контроль активности печеночных трансаминаз и ЩФ, ГГТ, концентрации билирубина. Холецистографию следует проводить каждые 4 недели в первые 3 месяца лечения, в дальнейшем – каждые 3 месяца. Контроль эффективности лечения проводить каждые 6 месяцев в ходе УЗИ в течение первого года терапии.

При сохранении повышенных показателей препарат следует отменить.

Для успешного растворения необходимо, чтобы камни были чисто холестериновые, размером не более 15-20 мм, желчный пузырь заполнен камнями не более чем на половину и желчевыводящие пути полностью сохраняли свою функцию.

После полного растворения конкрементов рекомендуется продолжать применение в течение по крайней мере 3 месяцев, для того чтобы способствовать растворению остатков конкрементов, размеры которых слишком малы для их обнаружения.

Если в течение 6-12 месяцев после начала терапии частичного растворения конкрементов не произошло, маловероятно, что лечение будет эффективным.

Обнаружение во время лечения не визуализируемого желчного пузыря является свидетельством того, что полного растворения конкрементов не произошло, и лечение следует прекратить.

У пациентов с диареей следует уменьшить дозировку урсодезоксихолевой кислоты. При персистирующей диарее следует прекратить лечение.

Длительная терапия высокими дозами урсодезоксихолевой кислоты (28-30 мг/кг/день) может привести к развитию серьезных побочных явлений у пациентов с первичным склерозирующим холангитом.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и механизмами

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами не выявлено.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°С.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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