Нео-Зекст



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки кишечнорастворимые, покрытые пленочной оболочкой светло-розового цвета, овальные; на поперечном разрезе - белого или почти белого цвета.

	1 таб.
эзомепразола магния дигидрат	21.7 мг,
что соответствует содержанию эзомепразола	20 мг

Вспомогательные вещества: гранулы сахарные сферические - 16.13 мг, гипролоза - 5.94 мг, повидон - 5.34 мг, тальк - 6.675 мг, титана диоксид (Е171) - 1.335 мг, сополимер метакриловой кислоты и этилакрилата (1:1) дисперсия 30% - 33.16 мг, стеариновой кислоты моноглицерид 40-55 тип II - 1.985 мг, пропиленгликоль - 5.93 мг, стеариновая кислота тип 50 - 4.64 мг, полисорбат 80 - 0.78 мг, симетикон - 0.045 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 240.12 мг, макрогол 6000 - 27.595 мг, кросповидон тип А - 6.9 мг, кремния диоксид коллоидный - 0.69 мг, магния стеарат - 0.69 мг.

Состав оболочки: гипромеллоза - 19.455 мг, макрогол 6000 - 4.785 мг, титана диоксид (Е171) - 4.245 мг, тальк - 1.44 мг, краситель железа оксид красный (Е172) - 0.0563 мг, краситель железа оксид желтый (Е172) - 0.0188 мг.
Состав гранул: сахароза - 80-91.5%, крахмал кукурузный - 8.5-20%, декстроза жидкая (декстроза, олиго- и полисахариды) - не более 5%.

7 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
7 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.

Таблетки кишечнорастворимые, покрытые пленочной оболочкой розового цвета со слабым коричневатым оттенком и вкраплениями более темного цвета, овальные, с риской с обеих сторон; на поперечном разрезе - белого или почти белого цвета.

	1 таб.
эзомепразола магния дигидрат	43.4 мг,
что соответствует содержанию эзомепразола	40 мг

Вспомогательные вещества: гранулы сахарные сферические - 32.26 мг, гипролоза - 11.88 мг, повидон - 10.68 мг, тальк - 13.35 мг, титана диоксид (Е171) - 2.67 мг, сополимер метакриловой кислоты и этилакрилата (1:1) дисперсия 30% - 66.32 мг, стеариновой кислоты моноглицерид 40-55 тип II - 3.97 мг, пропиленгликоль - 11.86 мг, стеариновая кислота тип 50 - 9.28 мг, полисорбат 80 - 1.56 мг, симетикон - 0.09 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 480.24 мг, макрогол 6000 - 55.19 мг, кросповидон тип А - 13.8 мг, кремния диоксид коллоидный - 1.38 мг, магния стеарат - 1.38 мг.

Состав оболочки: гипромеллоза - 34.35 мг, макрогол 6000 - 8.45 мг, титана диоксид (Е171) - 4.15 мг, тальк - 2.55 мг, краситель железа оксид красный (Е172) - 0.5 мг.
Состав гранул: сахароза - 80-91.5%, крахмал кукурузный - 8.5-20%, декстроза жидкая (декстроза, олиго- и полисахариды) - не более 5%.

7 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
7 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Эзомепразол является S-изомером омепразола и снижает секрецию соляной кислоты в желудке путем специфического ингибирования протонового насоса в париетальных клетках. Оба изомера омепразола, S- и R-изомеры, обладают сходной фармакодинамической активностью.

Механизм действия

Эзомепразол является слабым основанием, накапливается в секреторных канальцах париетальных клеток в высококислотной среде желудка, где активируется и ингибирует протоновый насос - фермент H^+/K^+-АТФазу. Эзомепразол ингибирует как базальную, так и стимулированную секрецию соляной кислоты.

Влияние на секрецию кислоты в желудке

Действие эзомепразола развивается в течение 1 ч после перорального приема 20 мг или 40 мг. При ежедневном приеме препарата в течение 5 дней в дозе 20 мг 1 раз/сут средняя максимальная концентрация соляной кислоты после стимуляции пентагастрином снижается на 90% (при измерении концентрации кислоты через 6-7 часов после приема препарата на 5-й день терапии).

У пациентов с гастроэзофагеальной рефлюксной болезнью (ГЭРБ) и наличием клинических симптомов через 5 дней ежедневного приема эзомепразола внутрь в дозе 20 мг или 40 мг pH в желудке был выше 4 в течение, в среднем, 13 и 17 часов из 24 ч. На фоне приема препарата в дозе 20 мг/сут значение внутрижелудочного pH выше 4 поддерживалось в течение 8, 12 и 16 ч у 76%, 54% и 24% пациентов, соответственно. Для 40 мг эзомепразола это соотношение составляет 97%, 92% и 56%, соответственно.

Выявлена корреляция между секрецией кислоты и концентрацией препарата в плазме (для оценки концентрации использовали параметр AUC).

Терапевтический эффект, достигаемый в результате ингибирования секреции кислоты

При приеме эзомепразола в дозе 40 мг/сут излечение рефлюкс-эзофагита наступает приблизительно у 78% пациентов через 4 недели терапии и у 93% - через 8 недель терапии.

Лечение эзомепразолом в дозе 20 мг 2 раза/сут в комбинации с соответствующими антибиотиками в течение одной недели приводит к успешной эрадикации Helicobacter pylori приблизительно у 90% пациентов.

Пациентам с неосложненной язвенной болезнью после недельного эрадикационного курса не требуется последующей монотерапии антисекреторными препаратами для заживления язвы и устранения симптомов.

Другие эффекты, связанные с ингибированием секреции кислоты

Во время лечения антисекреторными препаратами уровень гастрина в плазме повышается в результате снижения секреции кислоты. Вследствие снижения секреции соляной кислоты повышается концентрация хромогранина А (CgA). Повышение концентрации CgA может оказывать влияние на результаты обследований для выявления нейроэндокринных опухолей. Для предотвращения данного влияния необходимо временно прекратить прием эзомепразола за 5 дней до проведения исследования CgA.

У пациентов, длительное время получавших эзомепразол, отмечается увеличение количества энтерохромаффиноподобных клеток, вероятно, связанное с повышением уровня гастрина в плазме.

У пациентов, применявших антисекреторные препараты в течение длительного времени, чаще отмечается образование железистых кист в желудке. Это явление обусловлено физиологическими изменениями в результате ингибирования секреции кислоты. Кисты доброкачественные и подвергаются обратному развитию.

Применение лекарственных препаратов, подавляющих секрецию соляной кислоты в желудке, в т.ч. ингибиторов протонового насоса, сопровождается увеличением содержания в желудке микробной флоры, в норме присутствующей в ЖКТ. Применение ингибиторов протоновой помпы может приводить к незначительному увеличению риска инфекционных заболеваний ЖКТ, вызванного бактериями Salmonella spp. и Campilobacter spp. и, у госпитализированных пациентов, вероятно, Clostridium difficile.

В ходе двух проведенных сравнительных исследований с ранитидином эзомепразол показал лучшую эффективность в отношении заживления язв желудка у пациентов, получавших НПВС, включая, селективные ингибиторы ЦОГ-2.

В ходе двух исследований по оценке эффективности эзомепразол показал высокую эффективность в отношении профилактики язв желудка и дистрофических поражений кишечника у пациентов (возрастная группа старше 60 лет и/или с пептической язвой в анамнезе), получавших НПВС, включая прием селективных ингибиторов ЦОГ-2.

Фармакокинетика

Всасывание

Эзомепразол неустойчив в кислой среде, поэтому для перорального приема применяют таблетки, имеющие в своем составе гранулы с оболочкой, устойчивой к действию желудочного сока. Превращение эзомепразола в R-изомер в условиях in vivo является незначительным.

Абсорбция эзомепразола является быстрой, время достижения C_{max} составляет 1-2 ч после приема внутрь. Абсолютная биодоступность составляет 64% после однократного приема препарата в дозе 40 мг и повышается до 89% после повторного приема. Для эзомепразола в дозе 20 мг значения составили 50% и 68%, соответственно.

Прием пищи замедляет и снижает всасывание эзомепразола в желудке, однако это не оказывает существенного влияния на эффективность ингибирования секреции соляной кислоты.

Распределение

V_d - 0.22 л/кг. Связывание с белками плазмы - 97%.

Метаболизм и выведение

Эзомепразол полностью метаболизируется системой цитохрома P450 (CYP). Основная часть эзомепразола метаболизируется с помощью специфической полиморфной изоформы CYP2C19, при этом образуются гидрокси- и деметилированные метаболиты эзомепразола. Метаболизм оставшейся части осуществляется другой специфической изоформой CYP3A4; при этом образуется сульфопроизводное эзомепразола, являющееся основным метаболитом, определяемым в плазме.

У пациентов с активным изоферментом CYP2C19 ("быстрые" метаболизаторы) 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 в сутки. 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 изофермента CYP2C19 эзомепразолом и/или его сульфосодержащим метаболитом).

При ежедневном приеме 1 раз/сут эзомепразол полностью выводится из плазмы крови в перерыве между приемами и не кумулирует. Основные метаболиты эзомепразола не влияют на секрецию соляной кислоты в желудке. При пероральном применении до 80% принятой дозы выводится почками с мочой (менее 1% - в неизмененном виде), остальное количество выводится с фекалиями.

Фармакокинетика в некоторых группах пациентов

Примерно у 2.9±1.5% населения фермент CYP2C19 малоактивен (пациенты с неактивным метаболизмом) и метаболизм эзомепразола осуществляется в основном ферментом CYP3A4. При систематическом приеме 40 мг эзомепразола 1 раз/сут средняя AUC на 100% превышает значение этого параметра у пациентов с активным метаболизмом (при участии фермента CYP2C19). Средние значения C_{max} в плазме у пациентов с неактивным метаболизмом повышены приблизительно на 60%. Указанные особенности не влияют на дозировку и способ применения эзомепразола.

У пациентов пожилого возраста (71-80 лет) метаболизм эзомепразола не претерпевает значительных изменений.

После однократного приема 40 мг эзомепразола среднее значение AUC у женщин на 30% превышает таковое у мужчин. При ежедневном приеме препарата один раз в сутки различий в фармакокинетике у мужчин и женщин не отмечается.

Указанные особенности не влияют па дозировку и способ применения эзомепразола.

Метаболизм эзомепразола у пациентов с легкой или средней печеночной недостаточностью сходен с таковым у пациентов с нормальной функцией печени. При тяжелой печеночной недостаточности скорость метаболизма снижена, что сопровождается увеличением AUC в 2 раза, поэтому рекомендуется назначать максимальную суточную дозу препарата - 20 мг. Изучение фармакокинетики у пациентов с почечной недостаточностью не проводилось. Поскольку почками осуществляется выведение не самого эзомепразола, а его метаболитов, можно полагать, что метаболизм эзомепразола у пациентов с почечной недостаточностью не изменяется.

У детей в возрасте 12-18 лет после повторного приема 20 мг и 40 мг эзомепразола значение AUC и T_{max} в плазме крови было сходно со значениями AUC и T_{max} у взрослых.

Показания к применению:

Гастроэзофагеальная рефлюксная болезнь:

— лечение эрозивного рефлюкс-эзофагита;

— длительное поддерживающее лечение после заживления эрозивного рефлюкс-эзофагита для предотвращения

рецидива;

— симптоматическое лечение гастроэзофагеальной рефлюксной болезни.

Язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки в составе комбинированной терапии:

— лечение язвы двенадцатиперстной кишки, ассоциированной 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.

Синдром Золлингера-Эллисона или другие состояния, характеризующиеся патологической гиперсекрецией.

Относится к болезням:

- Гастрит
- Рефлюкс-эзофагит
- Эзофагит

Противопоказания:

— повышенная чувствительность к эзомепразолу, замещенным бензимидазолам и другим компонентам, входящим в состав препарата;

— наследственная непереносимость фруктозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция или сахаразо-изомальтазная недостаточность;

— детский возраст до 12 лет (эффективность и безопасность не установлены);

— детский возраст старше 12 лет по другим показаниями, кроме гастроэзофагеальной рефлюксной болезни;

— эзомепразол, как и другие ингибиторы протоновой помпы, не следует применять совместно с атазанавиром и нелфинавиром;

— период лактации.

С осторожностью

— беременность;

— тяжелая почечная недостаточность (опыт применения ограничен).

Способ применения и дозы:

Внутрь. Таблетку следует проглатывать целиком, запивая жидкостью.

Таблетки нельзя разжевывать или разламывать.

Для пациентов с затруднением глотания можно растворять таблетки в половине стакана негазированной воды (не следует использовать другие жидкости, так как защитная оболочка микрогранул может раствориться), размешивая до распадения таблетки, после чего взвесь микрогранул следует выпить сразу или в течение 15 минут, после чего снова наполнить стакан водой наполовину, размешать остатки и выпить. Не следует разжевывать или дробить микрогранулы. Для пациентов, которые не могут глотать, таблетки следует растворять в негазированной воде и вводить через желудочный зонд.

Важно, чтобы выбранные шприц и зонд были тщательно протестированы.

Указания по подготовке и введению препарата через желудочный зонд приведены в данном разделе ниже.

Взрослые и дети с 12 лет

Гастроэзофагеальная рефлюксная болезнь:

— лечение эрозивного рефлюкс-эзофагита - по 40 мг 1 раз/сут в течение 4-х недель. Рекомендуется дополнительный 4-недельный курс лечения в случаях, когда после первого курса заживление эзофагита не наступает или сохраняются симптомы;

— длительное поддерживающее лечение после заживления эрозивного рефлюкс-эзофагита для предотвращения рецидива - по 20 мг 1 раз/сут;

— симптоматическое лечение гастроэзофагеальной рефлюксной болезни - 20 мг 1 раз/сут пациентам без эзофагита. Если после 4-х недель лечения симптомы не исчезают, следует провести дополнительное обследование пациента. После устранения симптомов можно перейти на режим приема препарата "при необходимости", т.е. принимать эзомепразол по 20 мг 1 раз/сут при возобновлении симптомов. Для пациентов, принимающих НПВП и относящихся к группе риска развития язвы желудка или двенадцатиперстной кишки, не рекомендуется лечение в режиме "при необходимости".

Взрослые

Язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки в составе комбинированной терапии для эрадикации с Heilcobacter pylori:

— лечение язвы двенадцатиперстной кишки, ассоциированной с Helicobacter pylori - эзомепразол 20 мг, амоксициллин 1 г и кларитромицин 500 мг. Все препараты принимаются 2 раза/сут в течение 7 дней;

— профилактика рецидивов пептических язв, ассоциированных с Helicobacter pylori - эзомепразол 20 мг, амоксициллин 1 г и кларитромицин 500 мг. Все препараты принимаются 2 раза/сут в течение 7 дней.

Пациенты, длительно принимающие НПВП:

— заживление язвы желудка, связанной с приемом НПВП - 20 мг или 40 мг 1 раз/сут. Длительность лечения составляет 4-8 недель;

— профилактика язвы желудка и двенадцатиперстной кишки, связанной с приемом НПВП, у пациентов, относящихся к группе риска - 20 мг или 40 мг 1 раз/сут.

Синдром Золлингера-Эллисона или другие состояния, характеризующиеся патологической гиперсекрецией

Рекомендуемая начальная доза эзомепразола 40 мг 2 раза/сут. В дальнейшем доза подбирается индивидуально, длительность лечения определяется клинической картиной заболевания. Есть опыт применения в диапазоне от 80 мг до 120 мг эзомепразола в сутки. При применении препарата в дозе выше 80 мг необходимо разбить прием препарата дважды в день.

Почечная недостаточность: коррекция дозы препарата не требуется.

Печеночная недостаточность: при легкой и умеренной печеночной недостаточности коррекция дозы препарата не требуется. Для пациентов с тяжелой печеночной недостаточностью не следует превышать максимальную суточную дозу - 20 мг.

Пациенты пожилого возраста: коррекция дозы препарата не требуется.

Введение препарата через желудочный зонд

При назначении препарата через желудочный зонд

1. Поместите таблетку в шприц и заполните шприц 25 мл воды и приблизительно 5 мл воздуха. Для некоторых зондов может потребоваться разведение препарата в 50 мл питьевой воды для того, чтобы предотвратить засорение зонда гранулами таблетки.

2. Немедленно взболтайте шприц в течение примерно двух минут для растворения таблетки.

3. Держите шприц наконечником вверх и убедитесь, что наконечник не засорился.

4. Введите наконечник шприца в зонд, продолжая удерживать его направленным вверх.

5. Встряхните шприц и переверните его наконечником вниз. Немедленно введите 5-10 мл растворенного препарата в зонд. После введения верните шприц в прежнее положение и взболтайте (шприц должен удерживаться наконечником вверх для того, чтобы предотвратить засорение наконечника).

6. Переверните шприц наконечником вниз и введите еще 5-10 мл препарата в зонд. Повторите данную операцию, пока шприц не будет пуст.

7. В случае остатка части препарата в виде осадка в шприце, заполните шприц 25 мл воды и 5 мл воздуха и повторите операции, описанные в пунктах 5 и 6. Для некоторых зондов для этой цели может понадобиться 50 мл питьевой воды.

Побочное действие:

Определение частоты побочных реакций (ВОЗ): очень часто (≥1/10), часто (≥1/100, <1/10), нечасто (≥1/1000, <1/100), редко (≥1/10 000, <1/1000), очень редко (<1/10 000), частота неизвестна (невозможно оценить на основании имеющихся данных).

Со стороны системы кроветворения: редко - лейкопения, тромбоцитопения; очень редко - агранулоцитоз, панцитопения.

Со стороны нервной системы: часто - головная боль; нечасто - бессонница, головокружение, парестезия, сонливость, нечеткость зрения; редко - ажитация, спутанность сознания, депрессия; очень редко - агрессия, галлюцинации.

Со стороны пищеварительной системы: часто - боль в животе, запор, диарея, метеоризм, тошнота/рвота; нечасто - сухость во рту; редко - нарушение вкуса, стоматит, желудочно-кишечные кандидозы, гепатит с или без желтухи; очень редко - печеночная недостаточность, энцефалопатия у пациентов, прежде имевших болезни печени; частота неизвестна - микроскопический колит (подтвержденный гистологически).

Со стороны дыхательной системы: редко - бронхоспазм.

Со стороны кожных покровов: нечасто - дерматит, зуд, сыпь, крапивница; редко - алопеция, фоточувствительность, недомогание, повышенная потливость; очень редко - многоформная эритема, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз.

Со стороны костно-мышечной системы: редко - артралгия, миалгия; очень редко - мышечная слабость.

Со стороны мочеполовой системы: очень редко - интерстициальный нефрит.

Со стороны репродуктивной системы и молочных желез: очень редко - гинекомастия.

Аллергические реакции: редко - реакции гиперчувствительности, например, лихорадка, ангионевротический отек и анафилактическая реакция/шок.

Со стороны обмена веществ: нечасто - периферический отек; редко - гипонатриемия; очень редко - гипомагниемия; тяжелая гипомагниемия может коррелировать с гипокальциемией.

Лабораторные показатели: нечасто - повышение активности печеночных трансаминаз.

Передозировка:

На настоящий момент описаны крайне редкие случаи умышленной передозировки. Пероральный прием эзомепразола в дозе 280 мг сопровождался общей слабостью и симптомами со стороны ЖКТ. Разовый прием эзомепразола в дозе 80 мг не вызывал каких-либо отрицательных последствий.

Специфические антидоты неизвестны. Эзомепразол связывается с белками плазмы, поэтому диализ малоэффективен. В случае передозировки необходимо проводить симптоматическое и общее поддерживающее лечение.

Применение при беременности и кормлении грудью:

В настоящее время нет достаточного количества данных о применении эзомепразола при беременности.

При введении эзомепразола животным не выявлено какого-либо прямого или косвенного отрицательного воздействия на развитие эмбриона или плода. Введение рацемического препарата также не оказывало какого-либо отрицательного воздействия на животных в период беременности, родов, а также в период постнатального развития.

Назначать препарат беременным следует только в том случае, когда ожидаемая польза для матери превышает возможный риск для плода.

Применение препарата в период лактации противопоказано.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Влияние эзомепразола на фармакокинетику других лекарственных препаратов

Пониженная кислотность в желудке при лечении эзомепразолом может привести к снижению или повышению всасывания других лекарственных средств, механизм всасывания которых зависит от кислотности среды. Также как и при использовании других препаратов, подавляющих секрецию соляной кислоты, или антацидных средств, лечение эзомепразолом может привести к снижению всасывания кетоконазола, итраконазола и эрлотиниба и повышению абсорбции таких препаратов как дигоксин. Одновременное применение омепразола в дозе 20 мг 1 раз/сут и дигоксина повышает биодоступность дигоксина на 10% (биодоступность дигоксина повышалась на величину до 30% у 2 из 10 пациентов).

Было показано, что омепразол взаимодействует с некоторыми антиретровирусными препаратами. Механизмы и клиническое значение этого взаимодействия не всегда известны. Увеличение значения pH на фоне терапии омепразолом может влиять на всасывание антиретровирусных препаратов. Также возможно взаимодействие на уровне изофермента CYP2C19. При совместном применении омепразола и некоторых антиретровирусных препаратов, таких как атазанавир и нелфинавир, на фоне терапии омерпазолом отмечается снижение их концентрации в сыворотке. Поэтому их одновременное применение не рекомендуется. Совместное назначение омепразола (40 мг 1 раз/сут) с атазанавиром 300 мг/ритонавиром 100 мг здоровым добровольцам приводило к существенному уменьшению биодоступности атазанавира (AUC, C_{max} и C_{min} в плазме крови уменьшались приблизительно на 75%). Увеличение дозы атазанавира до 400 мг не компенсировало воздействия омепразола на биодоступность атазанавира. При одновременном применении омепразола и саквинавира было отмечено повышение концентрации саквинавира в сыворотке, при назначении с некоторыми другими антиретровирусными препаратами их концентрация не менялась. Учитывая сходные фармакокинетические и фармакодинамические свойства омепразола и эзомепразола, совместное применение эзомепразола с антиретровирусными препаратами, такими как атазанавир и нелфинавир, не рекомендуется.

Эзомепразол ингибирует CYP2C19 - основной изофермент, участвующий в его метаболизме. Одновременное применение эзомепразола с другими препаратами, в метаболизме которых принимает участие изофермент CYP2C19, такими как диазепам, циталопрам, имипрамин, клопирамин, фенитоин, может привести к повышению концентрации этих препаратов в плазме крови и потребовать снижения дозы. Об этом взаимодействии особенно важно помнить при применении эзомепразола по необходимости.

При одновременном приеме внутрь эзомепразола в дозе 30 мг и диазепама на 45% снижается клиренс диазепама, который является субстратом CYP2C19.

При одновременном приеме внутрь эзомепразола в дозе 40 мг и фенитоина у пациентов с эпилепсией на 13% повышалась остаточная концентрация фенитоина в плазме. В связи с этим рекомендуется контроль концентрации фенитоина в плазме в начале лечения эзомепразолом и при его отмене.

Применение омепразола в дозе 40 мг 1 раз/сут приводило к увеличению AUC и C_{max} вориконазола (субстрат изофермента CYP2C19) на 15% и 41% соответственно.

При применении эзомепразола внутрь в дозе 40 мг у пациентов, получающих варфарин, время коагуляции оставалось в пределах допустимых значений. Однако сообщалось о нескольких случаях клинически значимого повышения индекса МНО при совместном применении варфарина и эзомепразола. В связи с этим рекомендуется мониторинг МНО в начале и по окончании совместного применения эзомепразола и варфарина или других производных кумарина.

Применение омепразола у здоровых добровольцев в дозе 40 мг 1 раз/сут приводило к увеличению C_{max} и AUC цилостазола на 18% и 26% соответственно; для одного из активных метаболитов цилостазола увеличение составило 29% и 69% соответственно.

У здоровых добровольцев при одновременном приеме внутрь эзомепразола в дозе 40 мг и цизаприда на 32% повышалась величина AUC и на 31% увеличивалось $T_{1/2}$ цизаприда; C_{max} цизаприда в плазме при этом значительно не изменялась. Незначительное удлинение интервала QT, которое наблюдалось при монотерапии цизапридом, при добавлении эзомепразола не увеличивалось.

У некоторых пациентов отмечалось повышение концентрации метотрексата на фоне совместного применения с ингибиторами протонового насоса. При назначении метотрексата в высоких дозах следует рассмотреть возможность временной отмены эзомепразола.

Показано, что эзомепразол не вызывает клинически значимых изменений фармакокинетики амоксициллина и хинидина.

Исследования по оценке краткосрочного одновременного применения эзомепразола и напроксена или рофекоксиба не выявили клинически значимого фармакокинетического взаимодействия.

Влияние лекарственных препаратов на фармакокинетику эзомепразола

В метаболизме эзомепразола участвуют изоферменты CYP2C19 и CYP3A4. Совместное пероральное применение эзомепразола и кларитромицина, ингибитора изофермента CYP3A4, (500 мг 2 раза/сут) приводит к двукратному увеличению значения AUC для эзомепразола. Одновременное применение эзомепразола и комбинированного ингибитора изоферментов CYP3A4 и CYP2C19, например, вориконазола, может приводить к увеличению AUC эзомепразола более чем в 2 раза. Как правило, в таких случаях не требуется коррекции дозы эзомепразола. Коррекция дозы эзомепразола может потребоваться у пациентов с тяжелым нарушением функции печени и при длительном его применении.

Лекарственные препараты, индуцирующие изоферменты CYP2C19 и CYP3A4, такие как рифампицин и препараты

зверобоя продырявленного, при совместном применении с эзомепразолом могут приводить к снижению концентрации эзомепразола в плазме крови за счет ускорения метаболизма эзомепразола.

Особые указания и меры предосторожности:

При наличии любых тревожных симптомов (например, значительная спонтанная потеря массы тела, частая рвота, дисфагия, рвота с кровью или мелена), а также при наличии язвы желудка (или при подозрении на язву желудка) следует исключить возможность злокачественного новообразования, поскольку лечение эзомепразолом может привести к сглаживанию симптоматики и таким образом задержать постановку правильного диагноза.

Пациенты, принимающие препарат в течение длительного периода (особенно более 1 года), должны находиться под регулярным наблюдением врача.

Были зафикисированы случаи выраженной гипомагниемии у пациентов, принимающих блокаторы протонового насоса, такие как эзомепразол, на протяжении, по меньшей мере, 3 месяцев, а в большинстве случаев - года. Отмечались серьезные проявления гипомагниемии, такие как хроническая усталость, делирий, судороги, головокружение и желудочковая аритмия, однако они могут начаться постепенно и оставаться незамеченными. У большинства пациентов гипомагниемия исчезала после дополнительного приема магния и прекращения приема ингибиторов протонового насоса.

Для пациентов, которым может потребоваться длительное лечение, или принимающих ингибиторы протонового насоса совместно с дигоксином или другими препаратами, способными вызывать гипомагниемию (например, диуретиками), врачи должны рассмотреть возможность измерения концентрации магния перед началом приема ингибиторов протонового насоса и периодически во время проведения лечения. Применение ингибиторов протонового насоса, особенно в высоких дозах и в течение продолжительного периода (больше 1 года), может привести к умеренному повышению риска возникновения перелома бедра, запястья и тел позвонков, особенно у пациентов пожилого возраста и при наличии других известных факторов риска. Проведенные исследования позволяют предположить, что прием данных препаратов может повышать общий риск переломов на 10-40%. В определенной степени это повышение риска может быть следствием воздействия других факторов. Пациенты, подверженные риску развития остеопороза, должны проходить лечение в соответствии с применимыми клиническими рекомендациями и получать в необходимом количестве витамин D и кальций.

Во время лечения ингибиторами протонового насоса концентрация гастрина в плазме повышается в результате сниженной внутрижелудочной секреции соляной кислоты.

У пациентов, принимающих ингибиторы протонового насоса в течение длительного времени, чаще отмечается образование железистых кист в желудке. Эти явления обусловлены физиологическими изменениями в результате ингибирования секреции соляной кислоты. Кисты доброкачественные и проявляют тенденцию к исчезновению.

Пациенты, находящиеся на режиме терапии "по необходимости", должны быть проинструктированы о необходимости связаться со своим врачом при изменении характера симптомов. Принимая во внимание колебания концентрации эзомепразола в плазме при назначении препарата в режиме терапии "по необходимости", следует учитывать взаимодействие препарата с другими лекарственными средствами.

При назначении эзомепразола для эрадикации Helicobacter pylori следует учитывать возможность лекарственного взаимодействия для всех компонентов тройной терапии. Кларитромицин является сильным ингибитором CYP3A4, поэтому при назначении эрадикационной терапии пациентам, получающим другие препараты, метаболизирующиеся с участием CYP3A4 (например, цизаприда), необходимо учитывать возможные противопоказания и взаимодействие кларитромицина с этими лекарственными средствами.

Таблетки содержат сахарозу, поэтому не следует назначать эзомепразол пациентам с наследственной непереносимостью фруктозы, глюкозо-галактозной мальабсорбцией или сахаразо-изомальтазной недостаточностью.

Специальные меры предосторожности при уничтожении неиспользованного лекарственного препарата.

Нет необходимости в специальных мерах предосторожности при уничтожении неиспользованного препарата Нео-зекст.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения эзомепразолом необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

При тяжелой почечной недостаточности опыт применения ограничен, применять с осторожностью.

Применение в пожилом возрасте

Пациенты пожилого возраста: коррекция дозы препарата не требуется.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском возрасте до 12 лет (эффективность и безопасность не установлены); в детском возрасте старше 12 лет по другим показаниями, кроме гастроэзофагеальной рефлюксной болезни.

Условия хранения:

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

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Neo-Zekst