Онтайм



Код АТХ:

- A02BC04

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Рабепразол

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые кишечнорастворимой оболочкой розового цвета с коричневым оттенком, круглые, двояковыпуклые, с надписью черного цвета "N" и "10" с одной стороны, со слабым специфическим запахом.

	1 таб.
рабепразол натрия	10 мг

Вспомогательные вещества: маннитол - 11.5 мг, гипролоза низкозамещенная - 13.15 мг, магния оксид - 30 мг, гипролоза - 2.75 мг, магния стеарат - 0.6 мг; оболочка сепифилм LP-761 белый (гипромеллоза 2910 15cP (E464) - 2.53 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 0.55 мг, стеариновая кислота - 0.96 мг, титана диоксид (E171) - 0.96 мг); кишечнорастворимая оболочка (гипромеллозы фталат (HP-55) - 12.7 мг, триэтилцитрат - 1.3 мг); оболочка опадрай II 31F24127 розовый (лактозы моногидрат - 0.36 мг, гипромеллоза 2910 15cP (E464) - 0.28 мг, титана диоксид (E171) - 0.23 мг, макрогол 4000 - 0.1 мг, краситель железа оксид желтый - 0.013 мг, краситель железа оксид красный - 0.017 мг).

10 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые кишечнорастворимой оболочкой желтого цвета, круглые, двояковыпуклые, с надписью черного цвета "93" и "64" с одной стороны, со слабым специфическим запахом.

	1 таб.
рабепразол натрия	20 мг

Вспомогательные вещества: маннитол - 23 мг, гипролоза низкозамещенная - 26.3 мг, магния оксид - 60 мг, гипролоза - 5.5 мг, магния стеарат - 1.2 мг; оболочка сепифилм LP-761 белый (гипромеллоза 2910 15cP (E464) - 5.06 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 1.1 мг, стеариновая кислота - 1.92 мг, титана диоксид (E171) - 1.92 мг); кишечнорастворимая оболочка (гипромеллозы фталат (HP-55) - 19 мг, триэтилцитрат - 2 мг); оболочка опадрай II 31F32870 желтый (лактозы моногидрат - 0.72 мг, гипромеллоза 2910 15cP (E464) - 0.56 мг, титана диоксид (E171) - 0.463 мг, макрогол 4000 - 0.2 мг, краситель железа оксид желтый - 0.056 мг, краситель железа оксид красный - 0.001 мг, краситель железа оксид черный - 0.001 мг).

10 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Рабепразол принадлежит к классу антисекреторных соединений, которые в химическом отношении являются замещенными бензимидазолами. Препарат не обладает антихолинергической активностью и не является блокатором H_2-рецепторов стенки желудка, но подавляет синтез соляной кислоты путем специфического ингибирования активности фермента H^+-K^+-АТФ-азы (кислотного или протонового насоса). Этот эффект носит дозозависимый характер и приводит к угнетению как базальной, так и стимулированной секреции соляной кислоты независимо от раздражителя. Как слабое основание рабепразол в любых дозах быстро абсорбируется и концентрируется в кислой среде париетальных клеток и, превращаясь в активную сульфенамидную группу, последовательно взаимодействует с цистеинами протонового насоса.

Антисекреторная активность. После перорального приема 20 мг рабепразола антисекреторный эффект возникает в течение 1 ч и достигает максимума через 2-4 ч. Угнетение базальной и стимулированной пищей секреции кислоты через 23 ч после приема первой дозы рабепразола составляло 62 и 82% соответственно, а продолжительность этого действия достигала 48 ч. Ингибирующий эффект рабепразола на секрецию соляной кислоты постепенно усиливается в результате ежедневного приема 1 таблетки, максимальный уровень угнетения секреции достигается через 3 дня после начала приема препарата. После прекращения приема рабепразола секреторная активность восстанавливается через 2-3 дня.

Влияние на концентрации гастрина в сыворотке крови. В ходе клинических испытаний пациенты принимали 10 мг или 20 мг рабепразола 1 раз/сут при продолжительности лечения до 43 месяцев. В первые 2-8 недель терапии рабепразолом концентрация гастрина в сыворотке увеличивалась как следствие его ингибирующего эффекта на секрецию соляной кислоты и возвращалась к исходному уровню, как правило, в течение 1-2 недель после прекращения лечения.

В специальных клинических исследованиях было доказано, что применение рабепразола в течение 36 месяцев не приводит к гистологическим изменениям энтерохромафинноподобных клеток биоптатов дна и антрального отдела желудка, не влияет на частоту развития атрофического гастрита, кишечной метаплазии, и ограничивает распространенность инфекции Helicobacter pylori .

Другие эффекты. В настоящее время нет данных о том, что рабепразол вызывает системные эффекты со стороны ЦНС, сердечно-сосудистой и дыхательной систем. Рабепразол в суточной дозе 20 мг на протяжении 2 недель не оказывает влияния на функцию щитовидной железы, обмен углеводов, а также на уровень в крови паратиреоидного гормона, кортизола, эстрогена, тестостерона, пролактина, холецистокинина, секретина, глюкагона, фолликулостимулирующего гормона, лютеинизирующего гормона, ренина, альдостерона и соматотропного гормона.

Фармакокинетика

Всасывание

Рабепразол расщепляется под действием соляной кислоты, поэтому его применяют в особой кишечно-растворимой лекарственной форме. Рабепразол быстро абсорбируется из кишечника. После приема 20 мг C_{max} рабепразола в плазме достигается примерно через 3.5 ч. Изменения C_{max} и AUC носят линейный характер в диапазоне доз от 10 до 40 мг. Абсолютная биодоступность после приема внутрь 20 мг (по сравнению с в/в введением) составляет приблизительно 52% благодаря эффекту "первого прохождения" через печень. Биодоступность не изменяется при повторном приеме рабепразола. Прием пищи и время приема препарата в течение суток не оказывают влияния на абсорбцию рабепразола.

Распределение

97% рабепразола находится в плазме в связанном с белками состоянии.

Метаболизм

Рабепразол метаболизируется в печени системой цитохрома P450 (CYP450). Биотрансформируется при участии ферментов CYP2C19 и CYP3A4 с образованием активных метаболитов - тиоэфира (M1) и карбоновой кислоты (M6), а также второстепенных метаболитов, присутствующих в низких концентрациях - сульфона (M2), диметилтиоэфира (M4) и конъюгата меркаптуровой кислоты (M5). Незначительной антисекреторной активностью обладает только диметиловый метаболит (M3), однако он не обнаружен в плазме. В исследованиях in vitro рабепразол не индуцирует и не ингибирует метаболизм изоэнзима CYP3A4, таким образом, любое взаимодействие рабепразола и циклоспорина можно исключить.

Выведение

У здоровых добровольцев $T_{1/2}$ составляет около 1 ч (0.7-1.5 ч), суммарный клиренс составляет 283±98 мл/мин.

После однократного приема внутрь 20 мг меченного 14C рабепразола выведения активного вещества в

неизмененном виде не происходит. Примерно 90% указанной дозы выводится с мочой преимущественно в виде двух метаболитов: конъюгата меркаптуровой кислоты (M5) и карбоновой кислоты (M6). Остальная часть препарата выводится с калом.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

После однократного приема рабепразола в дозе 20 мг при сходных массе тела и росте никаких значимых различий в фармакокинетических параметрах в зависимости от пола не отмечается.

У пациентов в терминальной стадии почечной недостаточности, нуждающихся в гемодиализе (КК менее 5 мл/мин) распределение рабепразола было очень близким к таковому у здоровых добровольцев. AUC и C_{max} у этих пациентов были примерно на 35% ниже, чем у здоровых добровольцев. В среднем $T_{1/2}$ 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.

После однократного приема рабепразола в дозе 20 мг у пациентов с умеренной хронической печеночной недостаточностью AUC увеличивалась в 2 раза и $T_{1/2}$ увеличивался в 2-3 раза по сравнению со здоровыми добровольцами. Однако после приема рабепразола по 20 мг/сут в течение 7 дней AUC увеличивалась только в 1.5 раза, а C_{max} - в 1.2 раза. $T_{1/2}$ у пациентов с печеночной недостаточностью составлял 12.3 ч по сравнению с 2.1 ч у здоровых добровольцев. Фармакодинамический ответ (контроль pH в желудке) в обеих группах был клинически сопоставим.

У пациентов пожилого возраста выведение рабепразола несколько замедлено. Через 7 дней после приема рабепразола по 20 мг/сут у данной категории пациентов AUC была примерно в 2 раза больше, а C_{max} - на 60% выше по сравнению с молодыми здоровыми добровольцами. Однако признаков кумуляции рабепразола не отмечалось.

В случае замедленного метаболизма CYP2C19 после приема рабепразола по 20 мг/сут в течение 7 дней AUC увеличивается в 1.9 раза, а $T_{1/2}$ - в 1.6 раза по сравнению с теми же параметрами у экстенсивных метаболизаторов, в то время как C_{max} увеличивается на 40%.

Показания к применению:

— язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки в фазе обострения;

— эрозивная или язвенная гастроэзофагеальная рефлюксная болезнь (ГЭРБ);

— длительная поддерживающая терапия ГЭРБ;

— симптоматическое лечение ГЭРБ;

— синдром Золлингера-Эллисона;

— эрадикация Helicobacter pylori в комбинации с антибактериальными средствами.

Относится к болезням:

- Гастрит
- Язвенная болезнь
- Язвенная болезнь желудка

Противопоказания:

— беременность;

— период грудного вскармливания;

— повышенная чувствительность к рабепразолу натрия или замещенным бензимидазолам, а также к любому ингредиенту этого препарата.

С осторожностью: нарушение функции печени.

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь. Если прием препарата проводится по показаниям, требующим приема препарата 1 раз/сут, следует принимать таблетки утром до еды. Установлено, что ни время суток, ни прием пищи не влияют на

активность препарата. Но рекомендуемое время приема таблеток способствует лучшему соблюдению пациентами схемы лечения. Таблетки следует проглатывать целиком, не разжевывая и не измельчая.

При *язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки в фазе обострения* рекомендуется принимать по 20 мг 1 раз/сут утром в течение 4-6 недель.

У большинства пациентов с язвенной болезнью двенадцатиперстной кишки заживление язвы происходит в течение 4 недель. Следует отметить, что некоторым пациентам для заживления язв приходится принимать препарат Онтайм еще в течение 4 недель.

У большинства пациентов с язвенной болезнью желудка заживление происходит в течение 6 недель, но некоторым пациентам для заживления язв может понадобиться дополнительный 6-недельный курс лечения препаратом Онтайм.

При *эрозивной или язвенной ГЭРБ* рекомендуется принимать по 1 таб. (20 мг) 1 раз/сут на протяжении 4-8 недель.

Для *длительной поддерживающей терапии ГЭРБ* рекомендуется принимать в дозе 10 или 20 мг 1 раз/сут. Продолжительность лечения зависит от самочувствия пациента.

Для *симптоматического лечения ГЭРБ* пациентам без эзофагита рекомендуется принимать в дозе 10 мг 1 раз/сут в течение 4 недель. Если после 4 недель лечения симптомы не исчезают, следует провести дополнительное обследование пациента. Если симптомы заболевания не имеют постоянного характера, рекомендуется прием препарата Онтайм по мере необходимости в дозе 10 мг 1 раз/сут.

При *синдроме Золлингера-Эллисона* дозу подбирают индивидуально. Начальная доза составляет 60 мг/сут, при необходимости суточную дозу можно увеличить до 120 мг/сут и разделить на 2 приема: по 60 мг 2 раза/сут. Максимальная разовая доза, как правило, составляет 100 мг. Лечение следует продолжать до достижения клинического эффекта.

Эрадикация Helicobacter pylori в комбинации с антибактериальными средствами: рекомендуется проводить курс лечения длительностью 7 дней следующей комбинацией препаратов: препарат Онтайм по 20 мг 2 раза/сут + кларитромицин по 500 мг 2 раза/сут и амоксициллин по 1 г 2 раза/сут.

Пациентам с нарушениями функции почек или печени коррекция дозы препарата Онтайм не требуется.

Побочное действие:

Препарат Онтайм обычно хорошо переносится. Побочные эффекты, как правило, носят преходящий характер.

Со стороны кроветворной и лимфатической систем: ≥1/10 000, но <1/1000 - лейкопения, нейтропения, тромбоцитопения.

Со стороны обмена веществ: ≥1/10 000, но <1/1000 - анорексия.

Со стороны иммунной системы: ≥1/10 000, но <1/1000 - аллергические реакции.

Со стороны нервной системы: ≥1/100, но <1/10 - бессонница, головная боль, головокружение; ≥1/1000, но <1/100 - раздражительность, сонливость; ≥1/10 000, но <1/1000 - депрессия.

Со стороны органов зрения: ≥1/10 000, но <1/1000 - снижение остроты зрения.

Со стороны дыхательной системы: ≥1/100, но <1/10 - кашель, ринит, фарингит; ≥1/1000, но <1/100 - бронхит, синусит.

Со стороны пищеварительной системы: ≥1/100, но <1/10 - тошнота, рвота, диарея, повышенное газообразование, абдоминальные боли, запоры; ≥1/1000, но <1/100 - диспепсия, отрыжка, сухость слизистой оболочки рта; ≥1/10000, но <1/1000 - гастриты, стоматиты, извращение вкуса.

Со стороны печени и желчевыводящих путей: ≥1/1000, но <1/100 - повышение активности трансаминаз в плазме крови; ≥1/10 000, но <1/1000 - гепатиты, желтуха, печеночная энцефалопатия.

Со стороны кожи и подкожно-жировой клетчатки: ≥1/1000, но <1/100 - сыпь, эритема; ≥1/10 000, но <1/1000 - зуд, повышенная потливость, буллезные реакции; <1/10 000 - многоформная эритема, токсический эпидермальный некролиз, синдром Стивенса-Джонсона.

Со стороны костно-мышечной системы: ≥1/100, но <1/10 - неспецифические боли в спине; ≥1/1000, но <1/100 - миалгии, артралгии, судороги в ногах.

Со стороны мочевыделительной системы: ≥1/100, но <1/10 - поллакиурия, задержка мочи; ≥1/1000, но <1/100 - интерстициальный нефрит.

Прочие: ≥1/100, но <1/10 - астения; ≥1/1000, но <1/100 - боли в груди, озноб, лихорадка.

Передозировка:

До настоящего времени сведений о случаях преднамеренной передозировки препарата Онтайм не поступало. Максимальная суточная доза не превышает, как правило, 160 мг/сут. Возникающие побочные эффекты обычно мало выражены и не требуют дополнительной терапии.

В случае случайной передозировки следует проводить симптоматическую и поддерживающую терапию. Специфического антидота нет. Препарат Онтайм экстенсивно связывается с белками плазмы, поэтому практически не удаляется при диализе.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Специальных исследований по безопасности препарата Онтайм у беременных женщин не проводилось. Поэтому применение препарата при беременности не рекомендуется.

Экспериментальные исследования репродуктивности на крысах и кроликах не выявили признаков нарушения фертильности или дефектов развития плода, обусловленных препаратом Онтайм; однако у крыс в небольших количествах препарат проникает через плацентарный барьер.

Неизвестно, выделяется ли рабепразол с грудным молоком. Соответствующие исследования у кормящих женщин не проводились. Однако рабепразол обнаружен в молоке лактирующих крыс, поэтому препарат Онтайм не следует назначать в период грудного вскармливания.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Препарат Онтайм вызывает выраженное и длительное снижение выработки соляной кислоты, повышая pH содержимого желудка. Поэтому при одновременном применении с препаратами, абсорбция которых зависит от pH содержимого желудка, в т.ч. кетоконазол и итраконазол, необходимо корректировать их дозы с учетом того, что снижается концентрация этих препаратов в плазме крови.

В специальных исследованиях не было обнаружено взаимодействия препарата Онтайм с жидкими антацидными препаратами.

Особые указания и меры предосторожности:

Перед началом терапии препаратом Онтайм необходимо исключить наличие злокачественного новообразования желудка, т.к. прием препарата может маскировать симптомы и отсрочить постановку правильного диагноза.

Пациенты, вынужденные длительно принимать препарат Онтайм, должны быть под постоянным врачебным наблюдением.

У пациентов с легкими или умеренными нарушениями функции печени не было обнаружено значимого отличия частоты побочных эффектов препарата Онтайм от таковой у подобранных по полу и возрасту здоровых лиц, но, несмотря на это, рекомендуется соблюдать осторожность при первом назначении препарата пациентам с тяжелыми нарушениями функции печени.

Использование в педиатрии

Препарат Онтайм не рекомендуется назначать детям, так как опыт его применения в педиатрической практике в настоящее время отсутствует.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Исходя из особенностей фармакодинамики и профиля побочных реакций рабепразола, маловероятно, что препарат Онтайм оказывает влияние на способность управлять автомобилем и другими механизмами. Однако в случае появления сонливости и головокружения следует избегать этих видов деятельности.

При нарушениях функции почек

Пациентам с нарушениями функции почек коррекция дозы препарата Онтайм не требуется.

При нарушениях функции печени

У пациентов с легкими или умеренными нарушениями функции печени не было обнаружено значимого отличия

частоты побочных эффектов препарата Онтайм от таковой у подобранных по полу и возрасту здоровых лиц, но, несмотря на это, рекомендуется соблюдать осторожность при первом назначении препарата пациентам с тяжелыми нарушениями функции печени

Применение в детском возрасте

Препарат Онтайм не рекомендуется назначать детям, так как опыт его применения в педиатрической практике в настоящее время отсутствует.

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/Ontaym