Рабепразол-СЗ



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:

Капсулы кишечнорастворимые, 10 мг, 20 мг. По 10 или 14 капс. помещают в контурную ячейковую упаковку.

По 30, 60 или 100 капс. помещают в банку полимерную или во флакон полимерный.

Каждую банку или флакон, 2, 3, 6 контурных ячейковых упаковок по 10 капс., 1, 2, 4 контурные ячейковые упаковки по 14 капс. помещают в картонную пачку.

Состав:

Капсулы кишечнорастворимые	1 капс.
активное вещество:	
рабепразол пеллеты	118/236 мг
в пересчете на рабепразол натрия — 10/20 мг	
ядро пеллет: рабепразол натрия — 10/20 мг, сахарная	

крупка (сахароза, патока крахмальная) — 71,47/142,94 мг; натрия карбонат — 1,65/3,3 мг; тальк — 1,77/3,54 мг; титана диоксид — 0,83/1,66 мг; гипромеллоза (гидроксиметилцеллюлоза) — 14,75/29,5 мг	
оболочка пеллет: гипромеллозы фталат (гидроксипропилметилфталатцеллюлоза) — 15,93/31,86 мг; цетиловый спирт — 1,6/3,2 мг	
вспомогательные вещества	
капсулы твердые желатиновые №3 (дозировка 10 мг)/№1 (дозировка 20 мг)	
корпус: титана диоксид — 2/1%; железа оксид желтый —-/0,192%; желатин — до 100/до 100%	
крышечка: краситель азорубин (краситель кармазин) — 0,6619%/-; индигокармин — 0,0286%/-; титана диоксид — 0,6666/0,3333%; железа оксид черный — -/0,53%; железа оксид красный — -/0,93%; железа оксид желтый — -/0,2%; желатин — до 100/до 100%	

Описание:

Капсулы кишечнорастворимые, 10 мг: твердые, желатиновые, №3, корпус — белого цвета с крышечкой темно-красного цвета.

Капсулы кишечнорастворимые, 20 мг: твердые, желатиновые, №1, корпус — желтого цвета с крышечкой коричневого цвета.

Содержимое капсул — сферические пеллеты от почти белого до белого с кремоватым или желтоватым оттенком цвета.

Фармакотерапевтическая группа:

- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакологическое действие — противоязвенное, антистрессовое, ингибирующее протонный насос.

Фармакодинамика

Рабепразол относится к классу антисекреторных веществ, производных бензимидазола. Подавляет секрецию желудочного сока путем специфического ингибирования H+/K+-АТФазы на секреторной поверхности париетальных клеток желудка. Блокирует заключительную стадию секреции соляной кислоты, снижая базальную и стимулированную секрецию, независимо от природы раздражителя.

Обладая высокой липофильностью, легко проникает в париетальные клетки желудка, концентрируется в них, оказывая цитопротекторное действие и увеличивая секрецию гидрокарбоната.

Антисекреторное действие после перорального приема 20 мг рабепразола, наступает 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 составляет 62 и 82% соответственно и продолжается до 48 ч. При прекращении приема секреторная активность восстанавливается в течение 1–2 дней.

В течение первых 2–8 нед терапии рабепразолом концентрация гастрина в плазме крови увеличивается (что является отражением ингибирующего влияния на секрецию соляной кислоты) и возвращается к исходным уровням через 1–2 нед после его отмены.

Рабепразол не обладает антихолинергическими свойствами, не влияет на ЦНС, ССС и дыхательную систему.

На фоне приема рабепразола устойчивые изменения в морфологической структуре энтерохромафинноподобных клеток, степени выраженности гастрита, частоте атрофического гастрита, кишечной метаплазии или распространении инфекции *Helicobacter pylori* не обнаружены.

Фармакокинетика

После приема внутрь всасывается из ЖКТ. При дозе 20 мг C_{max} достигается через 3.5 ч. Изменения C_{max} и AUC носят линейный характер (в диапазоне доз от 10 до 40 мг). Абсолютная биодоступность составляет около 52% вследствие эффекта "первого прохождения" через печень. Биодоступность рабепразола не увеличивается при многократном приеме.

Прием пищи и время приема в течение суток не влияют на абсорбцию рабепразола.

Связывание с белками плазмы составляет 97%.

Рабепразол натрия подвергается эффекту "первого прохождения". Метаболизируется в печени при участии изоферментов системы CYP.

Основные метаболиты (тиоэфир и карбоновая кислота) и второстепенные метаболиты (сульфон, диметилтиоэфир и конъюгат меркаптопуровой кислоты) присутствуют в низких концентрациях.

У здоровых добровольцев $T_{1/2}$ составляет около 1 ч, общий клиренс - около 283 Примерно 90% выводится с мочой преимущественно в виде двух метаболитов: конъюгата меркаптопуровой кислоты и карбоновой кислоты. В токсикологических исследованиях у лабораторных животных найдены еще 2 неидентифицированных метаболита. Остальная часть выводится с калом.

У пациентов со стабильной терминальной стадией хронической почечной недостаточности, нуждающихся в гемодиализе (КК менее 5 мл/мин/1.73 $м^2$) AUC и C_{max} были 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. При заболеваниях почек клиренс рабепразола у пациентов на гемодиализе был приблизительно в 2 раза выше, чем у здоровых добровольцев.

У пациентов с хронической печеночной недостаточностью слабой или средней степени после однократного приема рабепразола наблюдалось увеличение C_{max}, $T_{1/2}$, AUC.

В случае замедленного метаболизма CYP2C19 после приема рабепразола по 20 мг/сут в течение 7 дней AUC и $T_{1/2}$ составляли 1.9 и 1.6 соответственно при экстенсивном метаболизме, в то время как C_{max} увеличивалась только на 40%.

У пациентов пожилого возраста выведение рабепразола несколько замедлено.

Показания к применению:

Язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки в фазе обострения; язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, ассоциированная с Helicobacter pylori (в комбинации с антибиотиками); гастроэзофагеальный рефлюкс.

Относится к болезням:

- Гастрит
- Язвенная болезнь
- Язвенная болезнь желудка

Противопоказания:

Беременность, период лактации (грудное вскармливание), повышенная чувствительность к рабепразолу натрия или замещенным бензимидазолам.

Способ применения и дозы:

Принимают внутрь. Разовая доза - 10-20 мг. Частота и длительность применения зависят от показаний и схемы лечения.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: диарея, тошнота, боли в животе, рвота, метеоризм, запор; редко - сухость во рту, диспепсия, отрыжка; в единичных случаях - анорексия, гастрит, стоматит, повышение активности печеночных трансаминаз.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: головная боль, астения, головокружение, бессонница; редко - нервозность, сонливость; в единичных случаях - депрессия, нарушения зрения и вкусовых ощущений.

Со стороны дыхательной системы: возможны - ринит, фарингит, кашель; редко - синусит, бронхит.

Аллергические реакции: редко - кожная сыпь; в единичных случаях - зуд.

Прочие: боли в спине, гриппоподобный синдром; редко - миалгия, боль в груди, озноб, судороги икроножных мышц, инфекция мочевыводящих путей, артралгия, лихорадка; в единичных случаях - увеличение массы тела, усиление потоотделения, лейкоцитоз.

Передозировка:

Симптомы: данные о намеренной или случайной передозировке минимальны.

Лечение: Рабепразол хорошо связывается с белками плазмы, и поэтому слабо выводится при диализе. При передозировке необходимо проводить симптоматическое и поддерживающее лечение. Специфический антидот для рабепразола неизвестен.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Диагнозы

- Болезнь Крона
- Боли в животе
- Гастрит
- Диарея

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с дигоксином возможно повышение (от небольшой до умеренной) концентрации дигоксина в плазме крови.

При одновременном применении с кетоконазолом уменьшается его биодоступность.

Особые указания и меры предосторожности:

Перед началом терапии необходимо исключить злокачественные новообразования желудка, т.к. применение рабепразола может маскировать симптомы и отсрочить правильную диагностику.

Пациентам с нарушениями функции печени или почек коррекции дозы не требуется, однако у пациентов с тяжелыми нарушениями функции печени рабепразол рекомендуется применять с осторожностью.

При одновременном применении с рабепразолом следует корректировать дозы кетоконазола и дигоксина.

В *экспериментальных исследованиях* не установлено канцерогенного действия рабепразола, однако при изучении мутагенности были получены неоднозначные результаты. Тесты на клетках лимфомы у мышей были положительными, при этом микроядерный тест in vivo и тест восстановления ДНК in vivo и in vitro были отрицательными.

Источник: http://drugs.thead.ru/Rabeprazol-SZ