Урсосан



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 Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Капсулы твердые желатиновые, белого цвета, непрозрачные, размер №0; содержимое капсул - белый или почти белый порошок, либо белый или почти белый порошок с кусочками массы, либо белый или почти белый порошок, спрессованный столбиком и распадающийся при надавливании.

	1 капс.
урсодезоксихолевая кислота*	250 мг

Вспомогательные вещества: крахмал кукурузный, магния стеарат, кремния диоксид коллоидный, титана диоксид, желатин.

* - *непатентованное международное наименование, рекомендованное ВОЗ, в РФ принято написание международного наименования - урсодеоксихолевая кислота.*

10 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (5) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (10) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Метаболики
- Органотропные средства

- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Гепатопротектор. Оказывает также желчегонное, холелитолитическое, гиполипидемическое, гипохолестеринемическое и некоторое иммуномодулирующее действие.

Обладая высокими полярными свойствами, урсодеоксихолевая кислота образует нетоксичные смешанные мицеллы с аполярными (токсичными) желчными кислотами, что снижает способность желудочного рефлюктата повреждать клеточные мембраны при билиарном рефлюкс-гастрите и рефлюкс-эзофагите. Кроме того, урсодеоксихолевая кислота образует двойные молекулы, способные включаться в состав клеточных мембран гепатоцитов, холангиоцитов, эпителиоцитов ЖКТ, стабилизировать их и делать невосприимчивыми к действию цитотоксичных мицелл.

Уменьшая концентрацию токсичных для гепатоцитов желчных кислот и стимулируя холерез, богатый бикарбонатами, урсодеоксихолевая кислота эффективно способствует разрешению внутрипеченочного холестаза. Уменьшает насыщенность желчи холестерином за счет угнетения его абсорбции в кишечнике, подавления синтеза в печени и понижения секреции в желчь; повышает растворимость холестерина в желчи, образуя с ним жидкие кристаллы; уменьшает литогенный индекс желчи. Результатом является растворение холестериновых желчных камней и предупреждение образования новых конкрементов.

Иммуномодулирующее действие обусловлено угнетением экспрессии антигенов HLA-1 на мембранах гепатоцитов и HLA-2 на холангиоцитах, нормализацией естественной киллерной активности лимфоцитов и др. Достоверно задерживает прогрессирование фиброза у больных первичным билиарным циррозом, муковисцидозом и алкогольным стеатогепатитом; уменьшает риск развития варикозного расширения вен пищевода. Урсодеоксихолевая кислота замедляет процессы преждевременного старения и гибели клеток (гепатоцитов, холангиоцитов).

Фармакокинетика

Всасывание и распределение

Урсодеоксихолевая кислота абсорбируется из тонкой кишки за счет пассивной диффузии (около 90%), а в подвздошной кишке посредством активного транспорта. При этом величина концентрации урсодеоксихолевой кислоты при приеме препарата внутрь в дозе 50 мг через 30, 60, 90 мин составляет 3.8 ммоль/л, 5.5 ммоль/л и 3.7 ммоль/л соответственно. C_{max} достигается через 1-3 ч.

Связывание с белками плазмы высокое - до 96-99%. Проникает через плацентарный барьер. При систематическом приеме Урсосана урсодеоксихолевая кислота становится основной желчной кислотой в сыворотке крови и составляет около 48% от общего количества желчных кислот в крови. Терапевтический эффект препарата зависит от концентрации урсодеоксихолевой кислоты в желчи.

Метаболизм и выведение

Метаболизируется в печени (клиренс при первичном прохождении через печень) в тауриновый и глициновый конъюгаты. Образующиеся конъюгаты секретируются в желчь. Около 50-70% общей дозы препарата выводится с желчью. Незначительное количество невсосавшейся урсодеоксихолевой кислоты поступает в толстую кишку, 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 конъюгата.

Показания к применению:

— неосложненная желчнокаменная болезнь: билиарный сладж; растворение холестериновых желчных камней в желчном пузыре, при невозможности их удаления хирургическим или эндоскопическим методами; профилактика рецидивов камнеобразования после холецистэктомии;

— хронический активный гепатит;

— острый гепатит;

— токсические (в т.ч. лекарственные) поражения печени;

— алкогольная болезнь печени;

— неалкогольный стеатогепатит;

— первичный билиарный цирроз печени;

— первичный склерозирующий холангит;

— кистозный фиброз (муковисцидоз) печени;

— атрезия внутрипеченочных желчных путей (в т.ч. врожденная атрезия желчного протока);

— дискинезии желчевыводящих путей;

— билиарный рефлюкс-гастрит и рефлюкс-эзофагит;

— билиарный диспептический синдром (при холецистопатии и дискинезии желчевыводящих путей);

— профилактика поражений печени при использовании гормональных контрацептивов и цитостатиков.

Относится к болезням:

- Алкогольная болезнь печени
- Гастрит
- Гепатит
- Гепатоз
- Дискинезия желчевыводящих путей
- Желчнокаменная болезнь
- Муковисцидоз
- Рефлюкс-эзофагит
- Склерит
- Фиброз
- Фиброма
- Холангит
- Холера
- Холецистит
- Цирроз печени
- Эзофагит

Противопоказания:

— рентгенположительные (с высоким содержанием кальция) желчные камни;

— не функционирующий желчный пузырь;

— желчно-желудочно-кишечный свищ;

— острый холецистит;

— острый холангит;

— цирроз печени в стадии декомпенсации;

— печеночная недостаточность;

— почечная недостаточность;

— обтурация желчевыводящих путей;

— острые инфекционные заболевания желчного пузыря и желчных протоков;

— эмпиема желчного пузыря;

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью* применяют Урсосан у детей в возрасте от 2 до 4 лет, т.к. возможно затруднение при проглатывании капсул, хотя урсодеоксихолевая кислота не имеет возрастных ограничений в применении.

Способ применения и дозы:

Капсулы Урсосана принимают внутрь, запивая достаточным количеством воды.

При *диффузных заболеваниях печени, желчнокаменной болезни (холестериновые желчные камни и билиарный сладж)* препарат назначают непрерывно в течение длительного времени (от нескольких месяцев до нескольких лет) в суточной дозе от 10 мг/кг массы тела до 12-15 мг/кг (2-5 капс.).

При *диффузных заболеваниях печени* суточная доза Урсосана делится на 2-3 приема, капсулы принимают вместе с едой.

При *желчнокаменной болезни* вся суточная доза принимается однократно на ночь. Продолжительность приема препарата для *растворения камней* - до полного растворения, а затем еще 3 мес для профилактики рецидивов камнеобразования.

При *билиарном рефлюкс-гастрите и рефлюкс-эзофагите* препарат назначают по 250 мг (1 капс.) в сутки, перед сном. Курс лечения - от 10-14 дней до 6 мес, при необходимости - до 2 лет.

После *холецистэктомии, для профилактики повторного холелитиаза* рекомендуемая доза - 250 мг 2 раза/сут в течение нескольких месяцев.

При *токсических, лекарственных поражениях печени, алкогольной болезни печени и атрезии желчных путей* суточную дозу устанавливают из расчета 10-15 мг/кг/ в 2-3 приема. Длительность терапии составляет 6-12 мес и более.

При *первичном билиарном циррозе* препарат назначают из расчета 10-15 мг/кг/сут (при необходимости - до 20 мг/кг) в 2-3 приема. Длительность терапии составляет от 6 мес до нескольких лет.

При *первичном склерозирующем холангите* - 12-15 мг/кг/сут (до 20 мг/кг) в 2-3 приема. Длительность терапии составляет от 6 мес до нескольких лет.

При *неалкогольном стеатогепатите* - 13-15 мг/кг/сут в 2-3 приема. Длительность терапии составляет от 6 мес до нескольких лет.

При *муковисцидозе* доза устанавливается из расчета 20-30 мг/кг/сут в 2-3 приема. Длительность терапии составляет от 6 мес до нескольких лет.

Детям в возрасте старше 2 лет дозу препарата устанавливают индивидуально из расчета 10-20 мг/кг/сут.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, диарея (может быть дозозависимой), запоры, преходящее (транзиторное) повышение активности печеночных трансаминаз; редко - кальцинирование желчных камней.

Прочие: боль в спине, аллергические реакции, обострение ранее имевшегося псориаза, алопеция; редко - кальцинирование желчных камней..

Передозировка:

Случаи передозировки урсодеоксихолевой кислотой не известны.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение урсодеоксихолевой кислоты при беременности возможно только в том случае, когда ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода (адекватных строго контролируемых исследований применения урсодеоксихолевой кислоты у беременных женщин не проводилось).

Данные о выделении урсодеоксихолевой кислоты с грудным молоком в настоящее время отсутствуют. При необходимости применения урсодеоксихолевой кислоты в период лактации следует решить вопрос о прекращении грудного вскармливания.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При совместном применении антациды, содержащие алюминий, и ионообменные смолы (колестирамин), снижают абсорбцию УДХК.

При одновременном применении гиполипидемические лекарственные средства (особенно клофибрат), эстрогены, неомицин или прогестины увеличивают насыщение желчи холестерином и могут снижать способность УДХК растворять холестериновые желчные конкременты.

Особые указания и меры предосторожности:

При применении препарата с целью растворения желчных камней необходимо соблюдение следующих условий: камни должны быть холестериновыми (рентгенонегативными), их размер не должен превышать 15-20 мм, желчный пузырь должен оставаться функциональным и должен быть наполнен камнями не более чем на половину, проходимость пузырного и общего желчного протока должна быть сохранена.

При длительном (более 1 мес) приеме препарата каждые 4 недели в первые 3 мес лечения, в дальнейшем - каждые 3 мес следует проводить биохимический анализ крови для определения активности печеночных трансаминаз. Контроль эффективности лечения следует проводить каждые 6 мес по данным УЗИ желчевыводящих путей.

После полного растворения камней рекомендуется продолжать применение Урсосана в течение, по крайней мере, 3 мес для того, чтобы способствовать растворению остатков камней, размеры которых слишком малы для их обнаружения и для профилактики рецидива камнеобразования.

В *экспериментальных исследованиях* на животных не выявлено мутагенного и канцерогенного действия урсодеоксихолевой кислоты.

При нарушениях функции почек

Противопоказан при почечной недостаточности.

При нарушениях функции печени

Противопоказан при печеночной недостаточности.

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить в сухом, защищенном от света и недоступном для детей месте при температуре от 15° до 25°С.

Срок годности:

4 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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