Урсосан (таблетки)



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, 250 мг. В блистере 10 шт.; в пачке картонной 1, 5 или 10 блистеров.

Состав:

Капсулы	1 капс.
активное вещество:	
урсодезоксихолевая кислота	250 мг
вспомогательные вещества: крахмал кукурузный — 49 мг; крахмал кукурузный прежелатинизированный — 24 мг; кремния диоксид коллоидный — 5 мг; магния стеарат — 3,65 мг	
оболочка капсулы: желатин — 98 мг; титана диоксид — 2 мг	

Описание:

Белые, твердые, непрозрачные желатиновые капсулы №0.

Содержимое капсул: белый или почти белый порошок либо белый или почти белый порошок с кусочками массы, либо белый или почти белый спрессованный порошок, распадающийся при надавливании.

Фармакотерапевтическая группа:

- Органотропные средства
- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакологическое действие — иммуномодулирующее, гипохолестеринемическое, гиполипидемическое, холелитолитическое, желчегонное, гепатопротективное.

Фармакодинамика

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

Обладая высокими полярными свойствами, урсодезоксихолевая кислота (УДХК) встраивается в мембрану гепатоцита, холангиоцита и эпителиоцита ЖКТ, стабилизирует ее структуру и защищает клетку от повреждающего действия солей токсичных желчных кислот, снижая т.о. их цитотоксический эффект. Образует нетоксичные смешанные мицеллы с аполярными (токсичными) желчными кислотами, что снижает способность желудочного рефлюктата повреждать клеточные мембраны при билиарном рефлюкс-гастрите и рефлюкс-эзофагите. Уменьшая концентрацию и стимулируя холерез, богатый бикарбонатами, УДХК эффективно способствует разрешению внутрипеченочного холестаза. При холестазе активирует Ca^{2+}-зависимую альфа-протеазу и стимулирует экзоцитоз, уменьшает концентрацию токсичных желчных кислот (хенодезоксихолевой, литохолевой, дезоксихолевой), 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. 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, увеличивает в ней концентрацию желчных кислот, вызывает усиление желудочной и панкреатической секреции, усиливает активность липазы, оказывает гипогликемическое действие. Уменьшение насыщенности желчи холестерином способствует его мобилизации из желчных камней, результатом чего является растворение холестериновых желчных камней и предупреждение образования новых конкрементов.

Иммуномодулирующее действие обусловлено угнетением экспрессии антигенов гистосовместимости (HLA-1 — на мембранах гепатоцитов и HLA-2 — на холангиоцитах), нормализацией естественной киллерной активности лимфоцитов, образованием ИЛ-2, уменьшением количества эозинофилов, подавлением иммунокомпетентных Ig, в первую очередь — IgM. Задерживает прогрессирование фиброза. Регулирует процессы апоптоза гепатоцитов, холангиоцитов и эпителиоцитов ЖКТ.

Фармакокинетика

Всасывание и распределение

УДХК абсорбируется в тощей и верхних отделах подвздошной кишки за счет пассивной диффузии (около 90%), а в терминальных отделах подвздошной кишки - посредством активного транспорта. Показатель резорбции обычно составляет 60-80%.

При приеме внутрь 50 мг УДХК C_{max} через 30, 60, 90 мин составляет 3.8 ммоль/л, 5.5 ммоль/л и 3.7 ммоль/л соответственно. Время достижения C_{max} составляет 1-3 ч. Связывание с белками плазмы высокое - до 96-99%. Проникает через плацентарный барьер.

При систематическом приеме препарата УДХК становится основной желчной кислотой в сыворотке крови.

Метаболизм и выведение

Метаболизируется в печени (клиренс при "первом прохождении" через печень составляет до 60%) в тауриновый и глициновый конъюгаты. Образующиеся конъюгаты секретируются в желчь. Около 50-70% общей дозы препарата выводится с желчью. Незначительное количество невсосавшейся в тонком отделе кишечника УДХК поступает в толстую кишку, где подвергается расщеплению бактериями (7-дегидроксилирование); образующаяся литохолевая кислота частично всасывается из толстой кишки, сульфатируется в печени и быстро экскретируется с желчью в виде

сульфолитохолилглицинового или сульфолитохолилтауринового конъюгата.

Показания к применению:

— неосложненная желчнокаменная болезнь: билиарный сладж; растворение холестериновых желчных камней при функционирующем желчном пузыре; профилактика рецидивов камнеобразования после холецистэктомии;

— хронические гепатиты различного генеза (в т.ч. токсические, лекарственные);

— холестатические заболевания печени различного генеза, в т.ч. первичный билиарный цирроз (при отсутствии признаков декомпенсации), первичный склерозирующий холангит, кистозный фиброз (муковисцидоз);

— неалкогольная жировая болезнь печени, в т.ч. неалкогольный стеатогепатит;

— алкогольная болезнь печени;

— хронические вирусные гепатиты;

— дискинезии желчевыводящих путей;

— билиарный рефлюкс-гастрит и рефлюкс-эзофагит.

Относится к болезням:

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

Противопоказания:

— повышенная чувствительность к активному и вспомогательным компонентам препарата;

— рентгенположительные (с высоким содержанием кальция) желчные камни;

— нефункционирующий желчный пузырь;

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

— цирроз печени в стадии декомпенсации;

— выраженные нарушения функции почек;

— выраженные нарушения функции печени;

— выраженные нарушения функции поджелудочной железы.

Урсодезоксихолевая кислота не имеет возрастных ограничений для применения, однако у детей в возрасте до 3 лет не рекомендуется применять препарат в данной лекарственной форме.

Способ применения и дозы:

Принимают внутрь, во время или после еды, не разжевывая, запивая достаточным количеством воды.

Для обеспечения рекомендованной дозы таблетку следует делить пополам, разламывая по риске. Сегменты,

сломанные неправильно, не должны использоваться. При удерживании сегмента в полости рта ощущается горький вкус.

Для *растворения холестериновых желчных камней* средняя суточная доза препарата составляет 10 мг/кг (до 12-15 мг/кг). Суточную дозу препарата принимают однократно на ночь. Курс лечения - 6-12 месяцев и более до полного растворения камней. В случае если камни в желчном пузыре не уменьшаются в размере после 12 месяцев лечения, препарат следует отменить.

Для *профилактики повторного образования камней* рекомендуется применение препарата в течение нескольких месяцев после растворения камней.

Для *профилактики повторного холелитиаза после холецистэктомии* назначают по 250 мг (1 капс. или 1/2 таб.) 2 раза/сут в течение нескольких месяцев.

При *хронических гепатитах различного генеза (в т.ч. токсические, лекарственные), хронических вирусных гепатитах, неалкогольной жировой болезни печени, в т.ч. неалкогольном стеатогепатите, алкогольной болезни печени* средняя суточная доза составляет 10-15 мг/кг в 2-3 приема. Длительность терапии составляет 6-12 месяцев и более.

При *холестатических заболеваниях печени различного генеза, в т.ч. первичном билиарном циррозе (при отсутствии признаков декомпенсации), первичном склерозирующем холангите, кистозном фиброзе (муковисцидозе)* средняя суточная доза составляет 12-15 мг/кг, при необходимости - 20-30 мг/кг. В течение первых 3 месяцев лечения суточную дозу препарата следует делить на 2-3 приема. В случае улучшения биохимических показателей крови суточную дозу препарата принимают однократно на ночь. Длительность терапии составляет от 6 месяцев до нескольких лет.

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

При *билиарном рефлюкс-гастрите и рефлюкс-эзофагите* средняя суточная доза составляет 250 мг (1 капс. или 1/2 таб.) 1 раз на ночь. Курс лечения - от 2 недель до 6 месяцев, при необходимости - до 2 лет.

Расчет суточного количества капсул и таблеток в зависимости от массы тела пациента и рекомендуемой дозы препарата на 1 кг массы тела, мг/кг/сут

Масса тела, кг	**10 мг/кг/сут**	**12 мг/кг/сут**	**15 мг/кг/сут**	**20 мг/кг/сут**	**30 мг/кг/сут**
1	**2**	**3**	**4**	**5**	**6**
19-25	1/2 таб. или 1 капс.	1/2 таб. или 1 капс.	1 таб. или 2 капс.	1 таб. или 2 капс.	1 и 1/2 таб. или 3 капс.
26-30	1/2 таб. или 1 капс.	1/2 таб. или 1 капс.	1 таб. или 2 капс.	1 таб. или 2 капс.	1 и 1/2 таб. или 3 капс.
31-35	1/2 таб. или 1 капс.	1 таб. или 2 капс.	1 таб. или 2 капс.	1 и 1/2 таб. или 3 капс.	2 таб. или 4 капс.
36-40	1 таб. или 2 капс.	1 таб. или 2 капс.	1 таб. или 2 капс.	1 и 1/2 таб. или 3 капс.	2 и 1/2 таб. или 5 капс.
41-45	1 таб. или 2 капс.	1 таб. или 2 капс.	1 и 1/2 таб. или 3 капс.	2 таб. или 4 капс.	2 и 1/2 таб. или 5 капс.
45-50	1 таб. или 2 капс.	1 таб. или 2 капс.	1 и 1/2 таб. или 3 капс.	2 таб. или 4 капс.	3 таб. или 6 капс.
51-55	1 таб. или 2 капс.	1 и 1/2 таб. или 3 капс.	1 и 1/2 таб. или 3 капс.	2 таб. или 4 капс.	3 и 1/2 таб. или 7 капс.
56-60	1 таб. или 2 капс.	1 и 1/2 таб. или 3 капс.	2 таб. или 4 капс.	2 и 1/2 таб. или 5 капс.	3 и 1/2 таб. или 7 капс.
61-65	1 и 1/2 таб. или 3 капс.	1 и 1/2 таб. или 3 капс.	2 таб. или 4 капс.	2 и 1/2 таб. или 5 капс.	4 таб. или 8 капс.
66-70	1 и 1/2 таб. или 3 капс.	1 и 1/2 таб. или 3 капс.	2 таб. или 4 капс.	3 таб. или 6 капс.	4 таб. или 8 капс.
71-75	1 и 1/2 таб. или 3 капс.	2 таб. или 4 капс.	2 и 1/2 таб. или 5 капс.	3 таб. или 6 капс.	4 и 1/2 таб. или 9 капс.
76-80	1 и 1/2 таб. или 3 капс.	2 таб. или 4 капс.	2 и 1/2 таб. или 5 капс.	3 таб. или 6 капс.	5 таб. или 10 капс.
81-85	1 и 1/2 таб. или 3 капс.	2 таб. или 4 капс.	2 и 1/2 таб. или 5 капс.	3 и 1/2 таб. или 7 капс.	5 таб. или 10 капс.

86-90	2 таб. или 4 капс.	2 таб. или 4 капс.	2 и 1/2 таб. или 5 капс.	3 и 1/2 таб. или 7 капс.	5 и 1/2 таб. или 11 капс.
91-95	2 таб. или 4 капс.	2 и 1/2 таб. или 5 капс.	3 таб. или 6 капс.	4 таб. или 8 капс.	5 и 1/2 таб. или 11 капс.
96-100	2 таб. или 4 капс.	2 и 1/2 таб. или 5 капс.	3 таб. или 6 капс.	4 таб. или 8 капс.	6 таб. или 12 капс.
101-105	2 таб. или 4 капс.	2 и 1/2 таб. или 5 капс.	3 таб. или 6 капс.	4 таб. или 8 капс.	6 и 1/2 таб. или 13 капс.
105-110	2 таб. или 4 капс.	2 и 1/2 таб. или 5 капс.	3 и 1/2 таб. или 7 капс.	4 и 1/2 таб. или 9 капс.	6 и 1/2 таб. или 13 капс.

Побочное действие:

Определение частоты побочных эффектов (количество случаев/число наблюдений): очень часто (≥1/10); часто (≥1/100 до < 1/10); нечасто (≥1/1000 до <1/100); редко (≥1/10 000 до <1/1000); очень редко (<1/10 000), частота не может быть подсчитана по доступным данным.

Со стороны пищеварительной системы: в клинических исследованиях на фоне лечения урсодезоксихолевой кислотой часто наблюдались диарея или пастообразный стул. При лечении первичного билиарного цирроза очень редко отмечалась сильная боль в верхней части живота.

Со стороны печени и желчевыводящих путей: на фоне лечения урсодезоксихолевой кислотой в очень редких случаях наблюдалось кальцинирование желчных камней. При лечении первичного билиарного цирроза на поздних стадиях в очень редких случаях отмечалась декомпенсация цирроза печени, которая регрессировала после прекращения лечения.

Со стороны кожи и подкожных тканей: в очень редких случаях может наблюдаться крапивница.

Передозировка:

Симптомы: в случае передозировки может возникнуть диарея. Другие симптомы передозировки маловероятны, поскольку резорбция урсодезоксихолевой кислоты ухудшается по мере увеличения дозы, что приводит к повышенной ее экскреции с калом.

Лечение: при установившейся длительной диарее терапию препаратом следует прекратить. Лечение - симптоматическое.

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 или новорожденнного (адекватных строго контролируемых исследований применения урсодеоксихолевой кислоты у беременных женщин не проводилось).

Женщинам репродуктивного возраста следует принимать препарат Урсосан при одновременном применении надежных средств контрацепции. Перед началом лечения следует исключить наличие беременности.

Данные о выделении урсодеоксихолевой кислоты с грудным молоком отсутствуют. При необходимости применения урсодеоксихолевой кислоты в период лактации следует прекратить грудное вскармливание.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Не следует применять препарат одновременно с антацидами, содержащими алюминий, ионообменные смолы (колестирамин, колестипол), поскольку указанные препараты могут снижать абсорбцию урсодезоксихолевой кислоты. В случае необходимости эти препараты следует принимать за 2 ч до или через 2 ч после приема УДХК.

Некоторые лекарственные препараты, такие как эстрогены, прогестогены (пероральные контрацептивы), неомицин, клофибрат, могут увеличивать холелитиаз, оказывая тем самым противоположный эффект способности урсодезоксихолевой кислоты растворять холестериновые желчные конкременты.

Урсодезоксихолевая кислота может повышать абсорбцию циклоспорина из кишечника, что требует проведения

мониторинга концентрации циклоспорина в плазме крови, а при необходимости - коррекции его режима дозирования.

В отдельных случаях урсодезоксихолевая кислота может снижать абсорбцию ципрофлоксацина.

Особые указания и меры предосторожности:

Применение препарата с целью растворения желчных камней возможно при соблюдении следующих условий: камни должны быть холестериновыми (рентгенонегативными), их размер - не более 15-20 мм, функционирующий желчный пузырь с сохраненной проходимостью пузырного и общего желчного протока, заполнен желчными камнями не более чем наполовину.

При длительном применении препарата с целью растворения желчных камней 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 желчного пузыря, желчевыводящих путей.

После полного растворения камней рекомендуется продолжать применение препарата в течение 3 месяцев для того, чтобы способствовать растворению остатков камней, размеры которых слишком малы для их обнаружения, и с целью профилактики рецидива камнеобразования.

Влияние на способность к управлению транспортными средствами и механизмами

Применение препарата Урсосан не влияет на выполнение потенциально опасных видов деятельности, требующих повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций (в т.ч. способность управлять автотранспортом, работа с движущимися механизмами).

Условия хранения:

Таблетки следует хранить в защищенном от света и месте при температуре от 15° до 25°C.

Капсулы следует хранить в сухом, защищенном от света и месте при температуре от 15° до 25°C. Срок годности - 4 года.

Не применять по истечении срока годности.

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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