

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

РАБЕЛОК®

Регистрационный номер:

Торговое название: Рабелок®

Международное непатентованное название: рабепразол

Лекарственная форма: таблетки покрытые кишечнорастворимой оболочкой

Состав:

В 1 таблетке содержится:

Активное вещество: рабепразол натрия 10 мг.

Вспомогательные вещества: маннитол 44,50 мг; магния оксид 40,0 мг; гипромеллоза 2,5 мг; целлюлоза микрокристаллическая 10,0 мг; крахмал 10,0 мг; кармеллоза 10,0 мг; тальк 1,5 мг; магния стеарат 3,0 мг; кремния диоксид коллоидный 1,5 мг.

Оболочка: гипромеллоза 4,75 мг; пропиленгликоль 0,75 мг;

Кишечнорастворимая оболочка: метакриловой кислоты и этилакрилата сополимер (тип С) (1:1) 6,975 мг; полисорбат 80 0,1045 мг; дибутилфталат 1,0450 мг; натрия гидроксид 0,0595 мг; краситель железа оксид желтый 0,3915 мг; тальк 2,815 мг; титана диоксид 0,605 мг.

Описание

Круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые оболочкой от светло-желтого до желтого цвета, гладкие с обеих сторон.

Фармакотерапевтическая группа: средство понижающее секрецию желез желудка – протонного насоса ингибитор.

Код АТХ: А02ВС04

Фармакологическое действие

Фармакодинамика

Противоязвенное средство из группы ингибиторов протонного насоса (Н+/К+-АТФ-азы), метаболизируется в париетальных клетках желудка до активных сульфонамидных производных, которые инактивируют сульфгидрильные группы Н+/К+-АТФ-азы.

Блокирует заключительную стадию секреции соляной кислоты, снижая содержание базальной и стимулированной секреции, независимо от природы раздражителя. Обладает высокой липофильностью, легко проникает в париетальные клетки желудка и концентрируется в них, оказывая цитопротекторное действие и увеличивая секрецию гидрокарбоната. Антисекреторный эффект после перорального приема 20 мг наступает в течение 1 часа и достигает максимума через 2-4 часа; угнетение базальной и стимулированной пищей секреции кислоты через 23 часа после приема первой дозы составляет 62 и 82% соответственной, продолжительность действия – 48 часов. После окончания приема секреторная активность нормализуется в течение 2-3 дней. В первые 2-8 недель терапии концентрация гастрина в сыворотке крови увеличивается и возвращается к исходным уровням в течение 1-2 нед после отмены. Не влияет на центральную нервную систему (ЦНС), сердечно-сосудистую и дыхательную системы. На фоне приема рабепразола устойчивые изменения в морфологической структуре энтерохромафинноподобных клеток, в степени выраженности гастрита, в частоте атрофического гастрита, кишечной метаплазии или распространении инфекции *Helicobacter pylori* не обнаружены.

Влияние на концентрацию гастрина в плазме крови. В начале терапии рабепразолом концентрация гастрина в плазме крови увеличивается, что является отражением ингибирующего влияния на секрецию соляной кислоты. Концентрация гастрина возвращается к исходному уровню обычно в течение 1-2 недель после прекращения лечения.

Фармакокинетика

Абсорбция – высокая, время достижения максимальной концентрации (T_{max}) – 3,5 часа. Максимальная концентрация (C_{max}) и площадь под фармакокинетической кривой (AUC) в плазме крови носят линейный характер в диапазоне доз от 10 до 40 мг. Метаболизируется в печени с участием изоферментов цитохрома CYP2C9 и CYP3A. Биодоступность – 52%, не увеличивается при многократном приеме. Период полувыведения ($T_{1/2}$) – 0.7-1.5 часа, клиренс – 283 ± 98 мл/мин. У пациентов с печеночной недостаточностью площадь под фармакокинетической кривой (AUC) увеличивается в 2 раза. Период полувыведения ($T_{1/2}$) – в 2-3 раза. У пожилых пациентов концентрация в плазме крови увеличивается в 2 раза. Максимальная концентрация (C_{max}) – на 60%. Связь с белками плазмы – 97%. Выводится почками – 90% в виде 2 метаболитов: конъюгата меркаптуровой кислоты (M5) и карбоновой кислоты (M6); через кишечник – 10%.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Почечная недостаточность

У пациентов со стабильной почечной недостаточностью в терминальной стадии, которым необходим поддерживающий гемодиализ (клиренс креатинина < 5 мл/мин/1,73м²) выведение рабепразола схоже с таковым для 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 часа у здоровых добровольцев, 0,95 часа – у пациентов во время гемодиализа и 3,6 часа после гемодиализа. Клиренс препарата у пациентов с заболеваниями почек, нуждающихся в гемодиализе, был приблизительно в два раза выше, чем у здоровых добровольцев.

Печеночная недостаточность

Пациенты с хроническим компенсированным циррозом печени хорошо переносят рабепразол в дозе 20 мг 1 раз в день, хотя AUC удвоена и C_{max} увеличена на 50% по сравнению со здоровыми добровольцами.

Пожилые пациенты

У пожилых пациентов элиминация рабепразола несколько замедлена. После 7 дней приема рабепразола в дозе по 20 мг 1 раз в день у пожилых лиц AUC была примерно вдвое больше, а C_{max} повышена на 60% по сравнению с молодыми здоровыми добровольцами; признаков кумуляции рабепразолом не отмечалось.

CYP2C19 полиморфизм

У пациентов с замедленным метаболизмом CYP2C19 после 7 дней приема рабепразола в дозе 20 мг в сутки AUC увеличивается в 1,9 раза, а период полувыведения в 1,6 раза, по сравнению с теми же параметрами у «быстрых метаболизаторов», в то время как C_{max} увеличивается на 40%.

Показания к применению

Симптомы диспепсии, связанной с повышенной кислотностью желудочного сока, в т.ч. симптомы гастроэзофагеальной рефлюксной болезни (изжога, кислая отрыжка).

Противопоказания

Индивидуальная повышенная чувствительность к рабепразолу, замещенным бензимидазолам или к вспомогательным компонентам препарата, беременность, период лактации, детский возраст до 12 лет.

С осторожностью

Тяжелая почечная недостаточность, тяжелая печеночная недостаточность, детский возраст.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Рабелок® противопоказан в период беременности. При необходимости применения препарата в период лактации грудное вскармливание следует прекратить.

Способ применения и дозы

Внутрь, в дозе 10 мг один раз в сутки. Таблетки принимают внутрь целиком, не разжевывая и не измельчая. Время суток и прием пищи не влияют на активность рабепразола.

При отсутствии эффекта в течение первых трех дней лечения необходим осмотр специалиста.

Максимальный курс лечения без консультации врача - 14 дней.

Побочное действие

Для определения частоты возникновения побочных эффектов препарата применяют следующую классификацию:

Очень часто ($\geq 1/10$); часто ($\geq 1/100$ и $< 1/10$); нечасто ($\geq 1/1000$ и $< 1/100$); редко ($\geq 1/10000$ и $< 1/1000$); очень редко ($< 1/10000$); частота неизвестна (на основании доступных данных установление частоты возникновения невозможно).

Со стороны органов кроветворения: редко: нейтропения, лейкопения, тромбоцитопения, лейкоцитоз.

Аллергические реакции: редко: гиперчувствительность (отек лица, эритема), острые системные аллергические реакции.

Со стороны нервной системы: часто: бессонница; нечасто: повышенная возбудимость; редко: головная боль, головокружение, сонливость, слабость, депрессия; частота неизвестна: спутанность сознания.

Со стороны пищеварительной системы: часто: диарея, тошнота, рвота, абдоминальные боли, запоры, метеоризм; нечасто: диспепсия; сухость во рту, отрыжка; редко: анорексия, гастрит, стоматит, расстройства вкуса, гепатит, желтуха.

Со стороны мочевыделительной системы: не часто: инфекции мочевыводящих путей; редко – интерстициальный нефрит.

Со стороны кожных покровов: нечасто: сыпь, эритема; редко: кожный зуд, повышенное потоотделение, буллезные реакции; очень редко: полиморфная эритема, токсический эпидермальный некролиз, синдром Стивенса-Джонсона.

Прочие: часто: неспецифические боли, боли в спине, астения, гриппоподобный синдром; нечасто: миалгии, артралгии, боли в грудной клетке, судороги икроножных мышц, ознобы,

лихорадка, увеличение активности «печеночных» ферментов; редко: нарушение зрения, увеличение массы тела; частота неизвестна: гипонатриемия, периферические отеки, гинекомастия, гипомагниемия (при длительном применении).

При приеме ингибиторов протонной помпы возможно увеличение риска возникновения переломов.

Передозировка

Симптомы. Сведения о передозировке минимальны. Сообщалось о приеме рабепразола в дозе 60 мг 2 раза в сутки и 160 мг однократно. Побочные эффекты были минимальны и не требовали медицинского вмешательства.

Лечение. Специфический антидот неизвестен. Рабепразол хорошо связывается с белками плазмы и поэтому слабо выводится при диализе.

При передозировке необходимо проводить симптоматическое лечение.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Замедляет выведение некоторых лекарственных средств, метаболизирующихся в печени путем микросомального окисления (диазепам, фенитоин, непрямые антикоагулянты). Совместное назначение с рабепразолом натрия кетоконазола или итраконазола может привести к значительному снижению концентрации противогрибковых препаратов в плазме крови. Не рекомендуется совместное применение рабепразола с атаназавиром, так как значительно снижаются эффекты атаназавира. Рабепразол ингибирует метаболизм циклоспорина. Одновременный прием ингибиторов протонной помпы и метотрексата может привести к повышению концентрации и/или его метаболита гидроксиметотрексата и увеличить период полувыведения.

При одновременном применении рабепразола и кларитромицина показатели AUC и C_{max} рабепразола увеличивались на 11% и 34% соответственно, а AUC и C_{max} 14-гидроксикларитромицина (активного метаболита кларитромицина) увеличивались на 42% и 46% соответственно. Данное увеличение показателей не было признано клинически значимым.

Особые указания

До и после лечения обязателен эндоскопический контроль для исключения злокачественного новообразования, т.к. лечение может замаскировать симптоматику и отсрочить правильную диагностику. Препарат не оказывает влияния на функцию щитовидной железы, метаболизм углеводов, на концентрацию в крови паратиреоидного

гормона, кортизола, эстрогена, тестостерона, пролактина, холецистокинина, секретина, глюкагона, ФСГ, ЛГ, ренина, альдостерона и соматотропного гормона.

Согласно данным наблюдательных исследований терапия ингибиторами протонной помпы может привести к возрастанию риска связанных с остеопорозом переломов бедра, запястья, позвоночника. Риск переломов был увеличен у пациентов, получавших высокие дозы ингибиторов протонной помпы в течение года и более.

Влияние на способность управления транспортными средствами и механизмами

В период лечения следует воздержаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания (вождение автомобиля, работа с механизмами) и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Таблетки, покрытые кишечнорастворимой оболочкой.

14 таблеток в блистер или в контурную безъячейковую упаковку из фольги алюминиевой Al/Al. По 1 или 2 блистера или контурной безъячейковой упаковке из фольги алюминиевой Al/Al помещают в пачку из картона вместе с инструкцией по медицинскому применению.

Условия хранения

В сухом защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте!

Срок годности

2 года.

Не применять после истечения срока годности.

Условия отпуска

Отпускают без рецепта.

Производитель

«Кадила Фармасьютикалз Лтд»

1389, Дхолка – 387810, район Ахмедабад, штат Гуджарат, Индия.

Претензии потребителей направлять в адрес Представительства фирмы в РФ:

119571, г. Москва, Ленинский проспект 148, офис 205.

Тел.: (495) 937-57-36, факс: (495) 937-57-38.

Уполномоченный представитель

Кадила Фармасьютикалз Лимитед, Индия



Истратов С.Ю.

МИНЗДРАВ РОССИИ
ЛП-002044- 211116
СОЗДАН

Пропито и пронумеровано и скреплено

Печатью 6 листа(ов).

Руководитель _____ отдела

Исрагов С.Ю. _____

(подпись)

« 21 » _____ 20 16 года

МЛР

