

## ИНСТРУКЦИЯ по медицинскому применению лекарственного средства

**Торговое название:** Эзолект.

**Международное непатентованное название:** Эзомепразол.

**Лекарственная форма:** таблетки, покрытые кишечнорастворимой оболочкой.

**Состав:**

**Эзолект 20 мг:** каждая таблетка, покрытая кишечнорастворимой оболочкой, содержит:

Эзомепразол магния USP (в виде тригидрата) экв. эзомепразолу 20 мг.

Утвержденные цвета, используются для покрытия таблеток.

**Эзолект 40 мг:** каждая таблетка, покрытая кишечнорастворимой оболочкой, содержит:

Эзомепразол магния USP (в виде тригидрата) экв. эзомепразолу 40 мг.

Утвержденные цвета, используются для покрытия таблеток.

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

**Код АТХ:** A02BC05.

**Фармакологические свойства:**

**Фармакодинамика:**

Антисекреторное средство — ингибитор H<sup>+</sup>, K<sup>+</sup>- АТФазы (протонного насоса). Снижает секрецию кислоты в желудке путем специфического ингибирования протонного насоса в париетальных клетках. Является S-изомером омепразола. S- и R-изомеры которого обладают сходной фармакологической активностью. Являясь слабым основанием, накапливается и переходит в активную форму в сильноокислой среде секреторных канальцев париетальных клеток слизистой оболочки желудка и ингибирует протонный насос — фермент H<sup>+</sup>, K<sup>+</sup>- АТФазу. Ингибирует как базальную, так и стимулированную секрецию соляной кислоты в желудке.

**Фармакокинетика:**

Эзомепразол устойчив в кислой среде, поэтому для перорального применения используют таблетки, покрытые оболочкой, устойчивой к действию желудочного сока. Препарат быстро всасывается, максимальные концентрации в плазме достигаются через 1—2 ч после приема. Биодоступность после однократного приема в дозе 40 мг составляет 64 % и возрастает до 89 % на фоне ежедневного приема один раз в сутки. Для дозы 20 мг эзомепразола эти показатели составляют 50 % и 68 % соответственно. Прием пищи одновременно с эзомепразолом замедляет и снижает его всасывание в желудке, однако не оказывает значительного влияния на эффект препарата в отношении желудочной кислотности. Связывание с белками плазмы — 97 %. Полностью метаболизируется с участием системы цитохрома P450 (CYP). Основная часть метаболизируется при участии специфической полиморфной изоформы CYP2C19, при этом образуются гидрокси- и диметилированные метаболиты эзомепразола. Метаболизм оставшейся части осуществляется изоформой CYP3A4 с образованием сульфопроизводного эзомепразола.

Параметры, приведенные ниже, отражают, в основном, характер фармакокинетики у пациентов с активным ферментом CYP2C19 (пациенты с быстрым метаболизмом). Общий клиренс составляет примерно 17 л/ч после однократного приема препарата и 9 л/ч — после многократного приема. Период полувыведения — 1,3 ч. Площадь под кривой «концентрация — время» (параметр AUC) дозозависимо возрастает при многократном приеме. При однократном ежедневном приеме эзомепразол полностью выводится из плазмы в интервале между дозами и не проявляет тенденции к накоплению. Ни один из основных метаболитов эзомепразола не влияет на секрецию желудочной кислоты. При пероральном применении до 80% дозы выводится в виде метаболитов почками, остальное количество — кишечником. В моче обнаруживается менее 1 % неизмененного эзомепразола.

У пациентов со сниженной активностью фермента CYP2C19 (пациенты с медленным метаболизмом — 1—2 % населения) метаболизм эзомепразола в основном осуществляется ферментом CYP3A4, вследствие чего при многократном приеме препарата в дозе 40 мг в сутки средняя площадь под кривой «концентрация — время» на 100 % выше, чем у пациентов с активным ферментом CYP2C19. Средние значения пиковых концентраций в плазме у пациентов с медленным метаболизмом повышены примерно на 60 %.

У пациентов пожилого возраста (71—80 лет) метаболизм эзомепразола не претерпевает значительных изменений.

У женщин после однократного приема 40 мг эзомепразола средняя площадь под кривой «концентрация — время» на 30 % выше, чем у мужчин. В дальнейшем при систематическом ежедневном приеме препарата различий фармакокинетики у пациентов обоих полов не наблюдалось.

У пациентов с тяжелой дисфункцией печени скорость метаболизма понижена, что приводит к удвоению площади под кривой «концентрация — время», поэтому высшая суточная доза эзомепразола у таких больных составляет 20 мг. Фармакокинетика у пациентов с дисфункцией почек не изучалась. Поскольку почками осуществляется выведение не самого эзомепразола, а его метаболитов, можно предположить, что метаболизм эзомепразола у пациентов с недостаточной функцией почек не изменяется.

**Показания к применению:**

Гастро-эзофагеальная рефлюксная болезнь:

- лечение эрозивного рефлюкс-эзофагита;
- длительное поддерживающее лечение после заживления эрозивного рефлюкс-эзофагита для предотвращения рецидива;
- симптоматическое лечение гастро-эзофагеальной рефлюксной болезни.

Язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки в составе комбинированной терапии:

- лечение язвы двенадцатиперстной кишки, ассоциированной с *Helicobacter pylori*;
- профилактика рецидивов пептической язвы, ассоциированной с *Helicobacter pylori*.

Пациенты, длительно принимающие НПВП:

- заживление язвы желудка, связанной с приёмом НПВП;
- профилактика язвы желудка и двенадцатиперстной кишки, связанной с приёмом НПВП у пациентов, относящихся к группе риска.

Синдром Золлингера-Эллисона или другие состояния, характеризующиеся патологической гиперсекрецией, в том числе, и идиопатическая гиперсекреция.

**Противопоказания:**

- повышенная чувствительность к эзомепразолу, замещенным бензимидазолам или другим ингредиентам, входящим в состав препарата;
  - наследственная непереносимость фруктозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция или сахарозо-изомальтазная недостаточность;
  - детский возраст до 12 лет (в связи с отсутствием данных об эффективности и безопасности применения препарата у данной группы пациентов) и детский возраст старше 12 лет по другим показаниям кроме гастро-эзофагеальной рефлюксной болезни;
  - эзомепразол, как и другие ингибиторы протонной помпы, не должен приниматься совместно с атазанавиром.
- С осторожностью* - тяжелая почечная недостаточность (опыт применения ограничен).

**Беременность и период лактации:**

Данные о безопасности применения препарата Эзолект при беременности отсутствуют. Применение возможно в случаях, когда ожидаемая польза терапии для матери превышает возможный риск для плода. Противопоказан в период лактации.

**Способы применения и дозы:**

Применяют внутрь. Таблетку Эзолект глотают целиком, запивая водой. Таблетку нельзя разжевывать или дробить.

Доза и длительность приема зависят от показаний и эффективности терапии.

**Взрослым и детям старше 12 лет:**

**Лечение эрозивного рефлюкс-эзофагита:** по 40 мг один раз в сутки в течение 4-х недель. Дополнительный 4-недельный курс лечения рекомендуется у пациентов, у которых не был излечен эзофагит или сохраняются его симптомы.

**Длительная профилактика рецидивов у пациентов с излеченным эзофагитом:** по 20 мг один раз в сутки.

**Симптоматическое лечение рефлюкс-эзофагита:** пациентам без эзофагита по 20 мг один раз в сутки на протяжении 4 недель (если после 4 недель лечения симптомы не исчезают, следует провести дополнительное обследование пациента). После устранения симптомов можно перейти на режим приема препарата «по требованию»; по 20 мг один раз в сутки при появлении симптомов. У пациентов, которые получали лечение НПВС и у которых существует риск развития язв желудка или двенадцатиперстной кишки, дальнейший контроль симптомов с использованием схемы «по требованию» не рекомендован.

**Эрадикация *Helicobacter pylori* (в комбинации с антибактериальными средствами):** по 20 мг два раза в сутки в течение 7 дней.

**Лечение язв желудка и двенадцатиперстной кишки, ассоциированных с лечением НПВС:** рекомендованная доза составляет 20 мг 1 раз в день. Продолжительность лечения — 4—8 недель.

**Профилактика язв желудка и двенадцатиперстной кишки, ассоциированных с лечением НПВС у пациентов группы риска:** по 20 мг 1 раз в день.

**Синдром Золлингера-Эллисона:** по 40 мг 2 раза в сутки. При необходимости дозу повышают, длительность лечения обусловлена клиническими показаниями.

Пациентам с нарушением функции почек и лицам пожилого возраста корректирования дозы не требуется.

У пациентов с нарушением функции печени легкой и средней степени тяжести корректирования дозы не требуется. При тяжелых нарушениях функции печени высшая суточная доза составляет 20 мг.

**Побочные действия:**

Головная боль, боль в брюшной полости, диарея, вздутие, тошнота, рвота, запор, дерматит, высыпание, крапивница, сухость во рту, головокружение.

**Редко:** реакции гиперчувствительности, такие как ангионевротический отек, анафилактические реакции, повышение уровней печеночных ферментов.

Не было выявлено дозозависимых эффектов.

Следующие побочные реакции наблюдались при применении рацемата (омепразола) и могут возникнуть при применении эзомепразола: парестезия, сонливость, бессонница, головокружение, обратимая спутанность сознания, тревожность, возбуждение, депрессия, галлюцинации (преимущественно у тяжелобольных пациентов), стоматит и желудочно-кишечные кандидоз, повышение уровня печеночных ферментов, энцефалопатия у пациентов с длительными тяжелыми заболеваниями печени; гепатит с (или без) желтухой, печеночная недостаточность, лейкопения, тромбоцитопения, агранулоцитоз, панцитопения, боли в суставах, мышечная слабость и миалгия, сыпь, фотосенсибилизация, мультиформная эритема, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз, алопеция, реакции гиперчувствительности (ангионевротический отек, лихорадка, бронхоспазм, интерстициальный нефрит и анафилактический шок), общая слабость, повышенная потливость, периферические отеки, нарушение зрения, изменения вкуса, гипонатриемия, гинекомастия.

**Передозировка:**

**Симптомы:** На настоящий момент описаны крайне редкие случаи умышленной передозировки. Пероральный прием эзомепразола в дозе 280 мг сопровождался общей слабостью и симптомами со стороны желудочно-кишечного тракта. Разовый прием 80 мг препарата Эзолект не вызывал каких-либо отрицательных последствий.

**Лечение:** симптоматическая и общая поддерживающая терапия. Гемодиализ малоэффективен. Специфического антидота нет.

**Взаимодействие с другими лекарственными средствами:**

Пониженная кислотность в желудке при лечении эзомепразолом может привести к снижению или повышению всасывания других лекарств, механизм всасывания которых зависит от кислотности среды. Совместное применение эзомепразола с другими препаратами, в метаболизме которых принимает участие CYP2C19 (диазепам, циталопрам, имипрамин, кломипрамин, фенитоин), может привести к повышению их концентраций в плазме крови и потребовать снижения их дозы. При одновременном приеме возможно уменьшение концентраций в плазме и эффективности итраконазола и кетоконазола.

При одновременном применении эзомепразола и варфарина следует контролировать показатели коагуляции, в связи со значительным увеличением времени коагуляции. При применении цизаприда в комбинации с эзомепразолом на ЭКГ наблюдался умеренно пролонгированный QT-интервал.

Эзомепразол не влияет на фармакокинетику амоксициллина или хинидина. При кратковременном применении эзомепразола и напроксена или рофекоксиба клинически значащих фармакокинетических взаимодействий не отмечалось.

При одновременном применении с кларитромицином отмечалось увеличение площади под кривой «концентрация — время» эзомепразола вследствие угнетения его метаболизма; коррекции дозы при этом не требуется.

**Особые указания:**

При наличии любых тревожных симптомов (например, таких как значительная спонтанная потеря массы тела, повторная рвота, дисфагия, рвота с примесью крови или мелена), а также при наличии язвы желудка (или при подозрении на язву желудка) следует исключить наличие злокачественного новообразования, поскольку лечение препаратом Эзолект может привести к сглаживанию симптоматики и отсрочить постановку диагноза.

Пациенты, принимающие препарат в течение длительного периода (особенно более года), должны находиться под регулярным наблюдением врача. Пациенты, принимающие Эзолект «по необходимости», должны быть проинструктированы о необходимости связаться со своим врачом при изменении характера симптомов. Принимая во внимание колебания концентрации эзомепразола в плазме при назначении терапии «по необходимости», следует учитывать взаимодействие препарата с другими лекарственными средствами. При назначении Эзолекта для эрадикации *Helicobacter pylori* должна учитываться возможность лекарственных взаимодействий для всех компонентов тройной терапии. Кларитромицин является мощным ингибитором CYP3A4. Поэтому при назначении эрадикационной терапии пациентам, получающим другие препараты, метаболизирующиеся с участием CYP3A4 (например, цизаприда), необходимо учитывать возможные противопоказания и взаимодействия кларитромицина с этими лекарственными средствами.

**Влияние на способность управлять автомобилем и другими механизмами:**

Препарат не влияет на способность управлять автомобилем и другими механизмами.

**Форма выпуска:**

**Эзолект 20 или 40 мг:** 10 кишечнорастворимых таблеток в каждом блистере алу /алу . 2 блистера вместе с инструкцией по применению в картонной упаковке.

**Условия хранения:**

Хранить в сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25°С и в местах, недоступных для детей.

**Срок годности:**

Указано на упаковке. Не использовать по истечении срока годности.

**Условия отпуска:**

По рецепту врача.

**Belinda**

Произведено для:  
**BELINDA Laboratories**  
Лондон, Великобритания  
Производитель:  
Браун Лабораторис Лтд.,  
Индия

belinda.tj