

**ИНСТРУКЦИЯ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ
ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА (Листок-вкладыш)**

УТВЕРЖДЕНА
Приказом Председателя
РГУ «Комитет медицинского и
фармацевтического контроля
Министерства здравоохранения
Республики Казахстан
от «16» мая 2023 г.
NN063255

Торговое наименование
Эзолект

Международное непатентованное название
Эзомепразол

Лекарственная форма, дозировка
Лиофилизированный порошок для приготовления раствора для инъекций и инфузий, 40 мг

Фармакотерапевтическая группа
Пищеварительный тракт и обмен веществ. Препараты для лечения заболеваний, связанных с нарушением кислотности. Противоязвенные препараты и препараты для лечения гастроэзофагеальной рефлюксной болезни (gastro-oesophageal reflux disease – GORD). Протонового насоса ингибиторы. Эзомепразол

Код АТХ A02BC05

Показания к применению
Взрослые

- применяется, как альтернативное лечение при невозможности проведения пероральной терапии:
- гастроэзофагеальной рефлюксной болезни у пациентов с эзофагитом и/или выраженными симптомами рефлюкса
- для заживления пептических язв желудка, вызванных приёмом нестероидных противовоспалительных препаратов (НПВП)
- для профилактики образования пептических язв желудка и двенадцатиперстной кишки, при приёме НПВП у пациентов из группы риска
- для профилактики хронического кровотечения у пациентов после эндоскопического лечения острого кровотечения из язвы желудка или двенадцатиперстной кишки.

Дети и подростки, в возрасте от 1 до 18 лет:

- для антисекреторного лечения желудка, когда невозможен пероральный прием препарата, например, при гастроэзофагеальной рефлюксной болезни (ГЭРБ) у пациентов с эрозивным рефлюкс-эзофагитом и/или тяжелыми симптомами рефлюкса.

Перечень сведений, необходимых до начала применения
Противопоказания

- гиперчувствительность к бензимидазолам, а также к вспомогательным компонентам препарата
- совместное применение с нефлимавром.

Необходимые меры предосторожности при применении
Пациенты пожилого возраста

Коррекция дозы не требуется.
Нарушение функции почек
Коррекция дозы не требуется. В связи с ограниченным опытом применения эзомепразола у пациентов с тяжелой почечной недостаточностью, при лечении таких пациентов необходимо соблюдать осторожность.

Нарушение функции печени у пациентов с ГЭРБ

У пациентов с нарушением функции печени легкой и средней степени тяжести коррекция дозы препарата Эзолект не требуется. Пациентам с тяжелым нарушением функции печени, максимальная суточная доза составляет 20 мг.

Нарушение функции печени у пациентов с кровотокащими язвами желудочно-кишечного тракта

У пациентов с нарушением функции печени легкой и средней степени тяжести, коррекция дозы препарата Эзолект не требуется. У пациентов с тяжелым нарушением функции печени после первоначальной быстрой внутривенной инфузии дозы 80 мг, дозу для длительной внутривенной инфузии в течение 71,5 часов необходимо ограничить до 40 мг/ч.

Взаимодействия с другими лекарственными препаратами
Инегибиторы протонной помпы

Комбинация с атазанавиром и нефлимавром не рекомендуется из-за возможного снижения их концентрации в плазме. В период комбинированного лечения омепразолом (40 мг в день) сообщалось о повышении (80-100%) в сыворотке крови уровня саквинавира (при одновременном применении с ритонавиром). Применение дозы омепразола 20 мг в день не влияло на уровень дарунавира (комбинация с ритонавиром) и ампренавира (комбинация с ритонавиром). Применение омепразола в дозе 20 мг в сутки не влияло на уровень ампренавира (с ритонавиром или без него). Применение омепразола в дозе 40 мг в день не влияло на уровень лопинавира (с однократным приемом ритонавира).

Метотрексат

У некоторых пациентов возможно повышение уровня метотрексата, поэтому при применении больших доз метотрексата, применение препарата Эзолект необходимо приостановить.

Такролимус

Возможно усиление действия такролимуса, поэтому при одновременном применении с препаратом Эзолект, требуется усиленный контроль концентрации такролимуса в крови, контроль функции почек и при необходимости изменение дозировки такролимуса.

Лекарственные препараты, всасывание которых зависит от уровня кислотности в желудке

Эзомепразол, как и другие средства, снижающие секрецию кислоты в желудке, может приводить к снижению всасывания и ослаблению действия кетоназола, итраконазола и эрлотиниба, а всасывание и действие дигоксина в период лечения эзомепразолом может увеличиваться. Токсическое действие дигоксина наблюдалось редко. Следует соблюдать осторожность при назначении высоких доз препарата Эзолект пожилым.

Лекарственные препараты, влияющие на работу ферментов печени

При одновременном применении с диазепамом, циталопрамом, имипрамино, клопирамином, фенитоином и другими, возможно повышение концентрации этих препаратов в плазме крови, что может потребовать снижения дозы препарата Эзолект. Не проводились исследований лекарственных взаимодействий с применением высоких доз эзомепразола для внутривенного введения (80 мг + 8 мг/ч), поэтому в течение 3-дневного периода внутривенного введения препарата Эзолект, необходим тщательный контроль состояния из-за возможного развития нежелательных побочных эффектов.

Диазепам

При одновременном приеме с диазепамом, возможно ослабление действия диазепам.

Фенитоин

Назначенные дозы эзомепразола 40 мг и фенитоина пациентам с эпилепсией приводило к повышению концентрации фенитоина в крови, поэтому рекомендуется контроль концентрации фенитоина в плазме крови в начале лечения препаратом Эзолект и при его отмене.

Вориконазол

Омепразол (40 мг один раз в сутки) вызывал повышение уровня вориконазола в крови.

Циклостазол

Омепразол и эзомепразол могут повышать уровень циклостазола и одного из основных его метаболитов в крови.

Цизаприд

Одновременный прием цизаприда с 40 мг эзомепразола приводил к повышению фармакокинетических параметров цизаприда, однако максимальная концентрация цизаприда в плазме изменялась незначительно. Небольшое удлинение интервала QT, которое наблюдалось при лечении только цизапридом, не отмечалось при назначении комбинации цизаприда с эзомепразолом.

Варфарин

При одновременном применении варфарина и эзомепразола отмечалось несколько случаев клинически значимого повышения индекса МНО (показатель свертывания крови), поэтому рекомендуется наблюдение в начале и при завершении одновременного применения этих двух препаратов или эзомепразола с другими производными кумарина.

Клопидогрел

Одновременное применение приводит к уменьшению действия клопидогрела. В клинических исследованиях получены противоречивые данные о клинических последствиях лекарственных взаимодействий с эзомепразолом с точки зрения основных сердечно-сосудистых побочных эффектов. В качестве меры предосторожности не рекомендуется одновременный прием с клопидогрелем.

Изученные лекарственные препараты, не вызывающие клинически значимых взаимодействий
Амоксициллин и хинидин

Не отмечалось клинически значимых взаимодействий с эзомепразолом.

Напроксен и рофекоксиб

Не отмечалось клинически значимых взаимодействий с эзомепразолом в ходе краткосрочных исследований.

Лекарственные препараты, угнетающие ферменты печени

Одновременное применение с кларитромицином и вориконазолом приводило к повышению уровня эзомепразола в крови в 2 и более раз. В подобных ситуациях, коррекция дозы препарата Эзолект обычно не требуется, однако у пациентов с тяжелой печеночной недостаточностью и при длительном лечении следует учитывать необходимость коррекции дозы.

Рифампицин и зверобой прохлявельный

Могут привести к повышению в крови уровня препарата Эзолект.

Дети

Исследования взаимодействий проводились только на взрослых.

Специальные предупреждения
Эпизодические новообразования

При появлении любых тревожных симптомов (таких как, выраженная резкая потеря массы тела, повторяющаяся рвота, дисфагия, рвота с кровью или мелена), а также при наличии язвы желудка (или подозрения на язву желудка), следует исключить наличие злокачественного новообразования, потому что лечение препаратом Эзолект может привести к сглаживанию симптоматики и отсрочить постановку правильного диагноза.

Длительное применение

Пациенты, получающие длительное лечение (особенно те, которые лечились более года), должны находиться под регулярным наблюдением врача.

Лечение по требованию

Пациенты, получающие лечение по требованию, должны быть проинструктированы о необходимости связаться со своим врачом, при изменении симптомов заболевания. Следует учитывать последствия взаимодействия с другими фармацевтическими препаратами из-за колебаний концентрации эзомепразола в плазме.

Необходимость обращения к врачу

При изменении симптомов заболевания, необходимо обратиться к врачу.

Эрадикация Helicobacter pylori

При назначении эзомепразола для эрадикации *Helicobacter pylori* следует учитывать взаимодействие всех компонентов тройной терапии. Кларитромицин является мощным ингибитором CYP3A4, поэтому противопоказан и взаимодействие кларитромицина следует учитывать при применении тройной терапии у пациентов одновременно принимающие принимающих другие препараты, метаболизирующиеся через CYP3A4, такие как цизаприд.

Желудочно-кишечные инфекции

Лечение эзомепразолом может привести к незначительному повышению риска развития желудочно-кишечных инфекций, вызываемых сальмонеллами и кампилобактериями. У пациентов, длительно принимающих антисекреторные препараты, в желудке чаще образуются железистые кисты, связанные с физиологическими изменениями из-за выраженного угнетения секреции кислоты. Эти кисты доброкачественные и имеют обратимый характер.

Всасывание витамина B12

Из-за снижения уровня кислотности в желудке, возможно уменьшение всасывания витамина B12 (цианокобаламина). Это следует учитывать при длительном лечении у пациентов с малым весом или факторами риска по снижению всасывания витамина B12.

Гипомагниемия

У пациентов, получающих эзомепразол в течение как минимум трех месяцев, а в большинстве случаев - в течение года наблюдалось снижение уровня магния. Могут отмечаться такие серьезные проявления *снижения магния*, как усталость, тетания, бред, судороги, головокружение и нарушение сердечного ритма, которые могут начаться внезапно и остаться незамеченными. У большинства таких пациентов, после введения магния и прекращения применения эзомепразола, уровень магния повысился. Для пациентов, которые предположительно будут получать длительное лечение или которые получают эзомепразол с дигоксином или препаратами, вызывающими гипомагниемия (например, мочегонные), необходимо рассмотреть возможность измерения уровня магния до начала лечения препаратом Эзолект и периодически в период лечения.

Риск развития переломов

Препараты данной группы, особенно если они применяются в больших дозах и длительно (более 1 года), могут незначительно повышать риск переломов (общий риск переломов на 10-40%) бедренной кости, костей запястья или позвоночника, преимущественно у пожилых людей или при наличии других факторов риска. Пациенты с риском остеопороза, должны получать необходимое лечение в соответствии с действующими клиническими рекомендациями, и принимать достаточно витамина D и кальция.

Подострая кожная форма красной волчанки

Очень редко отмечались случаи подострой кожной формы красной волчанки. Если появляются такие поражения, особенно на незащищенных от солнца участках кожи и они сопровождаются болями в суставах, необходимо срочно обратиться к врачу. В таких случаях может появиться необходимость отмены препарата Эзолект. Если ранее, после применения препаратов данной группы у пациента уже отмечалась подострая кожная форма красной волчанки, риск развития этого заболевания при повторном применении подобных препаратов повышается.

Комбинация с другими лекарственными препаратами

Одновременное применение эзомепразола и атазанавира не рекомендуется. Если комбинация с атазанавиром неизбежна, рекомендуется тщательный клинический контроль в сочетании с увеличением дозы атазанавира до 400 мг + 100 мг ритонавира; дозу препарата Эзолект 20 мг превышать не следует.

В начале или после окончания лечения препаратом Эзолект необходимо учитывать возможность взаимодействия с другими лекарственными препаратами. Отмечалось взаимодействие между клопидогрелем и эзомепразолом. Клиническая значимость этого взаимодействия неизвестна. В качестве меры предосторожности не рекомендуется одновременный прием эзомепразола и клопидогреля.

Серьезные кожные реакции

О серьезных кожных нежелательных реакциях, таких как мультиформная эритема, синдром Стивенса-Джонсона, токсической эпидермальной некролиз и лекарственная реакция с эозинофилией и системными симптомами (DRESS-синдром), которые могут быть опасными для жизни, сообщалось очень редко в связи с лечением эзомепразолом.

Пациенты должны быть проинформированы о признаках и симптомах тяжелой кожной реакции вышеперечисленных заболеваний и должны немедленно обратиться за медицинской помощью к своему врачу при появлении любых характерных признаков или симптомов.

При появлении признаков и симптомов тяжелых кожных реакций следует немедленно прекратить прием эзомепразола и при необходимости обеспечить дополнительную медицинскую помощь/тщательный мониторинг. Повторная провокация не должна проводиться у пациентов с вышеперечисленными кожными заболеваниями.

Влияние на результаты лабораторных исследований

Повышение уровня хромогранина А (СgА) может затруднить изучение нейронэндокринных опухолей. Чтобы избежать этого влияния, лечение препаратом Эзолект следует прекратить как минимум за 5 дней до измерения СgА. Если после первоначального измерения уровня СgА и гастрина не возвращаются к контрольным показателям, данные измерения следует повторить через 14 дней после прекращения лечения препаратом Эзолект.

Вспомогательные вещества

Этот лекарственный препарат (40 мг) содержит менее 23 мг натрия, т.е. практически его не содержит.

Во время беременности и лактации

Клинические данные по применению эзомепразола при беременности недостаточны. Имеющиеся данные по беременным женщинам не указывают на пороки развития плода или влияния на здоровье новорожденного ребенка. Доклинические исследования не указывают на прямое или косвенное вредное воздействие, возможность иметь потомство, внутриутробное развитие плода, течение беременности, родов или развитие потомства после рождения. Следует соблюдать осторожность при назначении эзомепразола беременным женщинам.

Неизвестно, выделяется или нет эзомепразол с грудным молоком, информации о влиянии эзомепразола на новорожденных/грудных детей недостаточно, поэтому не следует назначать препарат Эзолект в период кормления грудью.

Особенности влияния препарата на способность управлять транспортным средством или потенциально опасными механизмами

Эзомепразол оказывает незначительное влияние на способность управлять автомобилем или проводить работы с движущимися механизмами. Поступали сообщения о таких нечастых побочных реакциях, как головокружение и помутнение зрения, в таких случаях не следует управлять автомашиной или использовать механизмы.

Рекомендации по применению
Режим дозирования
Взрослые

При невозможности проведения пероральной терапии, пациентам может быть парентерально назначен препарат Эзолект в дозе 20 - 40 мг 1 раз в сутки. Пациентам с рефлюкс-эзофагитом показано введение препарата Эзолект в дозе 40 мг 1 раз в сутки. Для симптоматической терапии ГЭРБ препарат Эзолект применяется в дозе 20 мг 1 раз в сутки. Для лечения и профилактики пептических язв, связанных с приёмом НПВП, рекомендуется препарат Эзолект в дозе 20 мг 1 раз в сутки.

Профилактика развития повторного кровотечения у пациентов, после эндоскопического лечения острого кровотечения из язвы желудка или двенадцатиперстной кишки: для профилактики развития повторного кровотечения у пациентов после эндоскопического лечения острого кровотечения из язвы желудка или двенадцатиперстной кишки доза препарата составляет 80 мг. Эту дозу вводят внутривенно медленно в течение 30 минут, после чего в течение 3 дней (72 часа)

проводят непрерывную внутривенную инфузию препарата в дозе 8 мг/ч. Как правило, период внутривенного введения препарата Эзолект непрерывно, рекомендуется быстрый перевод пациента на пероральные формы эзомепразола. Период парентерального лечения должен сопровождаться пероральным приемом антисекреторных лекарственных препаратов.

Метод и путь введения
Введение препарата путем инъекции

Доза 40 мг: 5 мл приготовленного раствора препарата Эзолект (8 мг/мл) необходимо вводить внутривенно в течение не менее 3 минут.

Доза 20 мг: 2,5 мл приготовленного раствора препарата Эзолект (8 мг/мл) необходимо вводить внутривенно в течение не менее 3 минут, неиспользованные остатки раствора следует уничтожить.

Введение препарата путем инфузии

Доза 40 мг: приготовленный раствор препарата Эзолект вводится в виде внутривенной инфузии в течение 10 - 30 минут.

Доза 20 мг: 1/2 часть приготовленного раствора препарата Эзолект вводится в виде внутривенной инфузии в течение 10 - 30 минут, неиспользованные остатки раствора следует уничтожить.

Болусная доза 80 мг: приготовленный раствор препарата Эзолект вводится в виде внутривенной медленной инфузии - в течение 30 минут.

Доза 8 мг/ч: приготовленный раствор препарата Эзолект вводится в виде длительной внутривенной инфузии в течение 71,5 часов (расчетная скорость инфузии – 8 мг/ч, срок годности восстановленного раствора см. в разделе «Условия хранения»).

Дети и подростки 1-18 лет

Антисекреторное лечение заболеваний желудка, когда пероральная терапия невозможна в качестве альтернативы

Препарат Эзолект 40 мг, порошок для приготовления раствора для инъекций и инфузии, может применяться у детей и подростков в возрасте от 1 до 18 лет, в случае, когда они не могут принимать пероральные препараты (как часть полного периода лечения ГЭРБ) (см. дозы в таблице ниже). На начальном этапе лечения, препарат вводится один раз в день, парентерально. Обычно, продолжительность внутривенного лечения должна быть короткой и переход на пероральное лечение необходимо сделать как можно быстрее.

Рекомендуемые дозы для внутривенного введения препарата Эзолект

Возраст	Лечение эрозивного рефлюксного эзофагита	Симптоматическое лечение ГЭРБ
1-11 лет	Вес <20 кг: 10 мг один раз в день Вес ≥20 кг: 10 мг или 20 мг один раз в день	По 10 мг один раз в день
12-18 лет	40 мг один раз в день	По 20 мг один раз в день

Введение путем инъекции

Доза 40 мг: 5 мл приготовленного раствора препарата Эзолект (8 мг/мл) необходимо вводить внутривенно в течение не менее 3 минут.

Доза 20 мг: 2,5 мл приготовленного раствора препарата Эзолект (8 мг/мл) необходимо вводить внутривенно в течение не менее 3 минут. Неиспользованные остатки раствора следует уничтожить.

Доза 10 мг: 1,25 мл восстановленного раствора (8 мг/мл) следует вводить в виде внутривенной инъекции в течение не менее 3 минут. Неиспользованные остатки раствора следует уничтожить.

Введение путем инфузии

Доза 40 мг: приготовленный раствор препарата Эзолект следует вводить в виде внутривенной инфузии в течение 10 - 30 минут.

Доза 20 мг: половину приготовленного раствора препарата Эзолект следует вводить в виде внутривенной инфузии в течение 10 - 30 минут. Неиспользованные остатки раствора следует уничтожить.

Доза 10 мг: четвертую часть от восстановленного раствора следует вводить в течение 10 - 30 минут. Неиспользованные остатки раствора следует уничтожить.

Приготовление раствора для инъекций: раствор для инъекций готовится путем добавления во флакон с лиофилизированным порошком препарата Эзолект 5 мл 0,9 % раствора хлорида натрия для внутривенного введения, pH раствора составляет примерно 10,2, а осмолярность примерно 336 мОсм/кг. Приготовленный раствор должен быть прозрачным, цветовая гамма варьирует от бесцветного до бледно-желтого.

При назначении 20 мг эзомепразола вводится половина приготовленного раствора. Неиспользованные остатки раствора следует уничтожить.

Приготовление раствора для инфузий: инфузионный раствор готовится путем растворения содержимого одного флакона препарата Эзолект в 100 мл 0,9 % раствора хлорида натрия для внутривенного введения, pH раствора составляет примерно 9,6, а осмолярность примерно 304 мОсм/кг.

При назначении 20 мг эзомепразола вводится половина приготовленного раствора.

Инфузия дозы 80 мг: инфузионный раствор готовится путем растворения содержимого двух флаконов препарата Эзолект 40 мг в 100 мл 0,9 % раствора хлорида натрия для внутривенного введения. Неиспользованные остатки раствора следует уничтожить. Разведенный раствор эзомепразола представляет собой прозрачную жидкость от бесцветного до бледно-желтого цвета.

Приготовленный раствор (для инъекций и для инфузий) не следует смешивать или вводить одновременно с другими лекарственными препаратами. Перед применением, раствор следует осмотреть визуально для выявления видимых механических примесей и изменения цвета. Можно применять только прозрачный раствор. Приготовленный раствор рекомендуется вводить сразу после приготовления. Только для однократного использования. Неиспользованные остатки раствора следует уничтожить.

Меры, которые необходимо принять в случае передозировки
Симптомы: имеется ограниченный опыт преднамеренной передозировки эзомепразола. При приеме пероральной дозы 280 мг отмечались симптомы со стороны желудочно-кишечного тракта и слабость. Однократные дозы эзомепразола 80 мг для перорального приема и 308 мг для внутривенного введения в течение 24 часов, нежелательных побочных эффектов не вызывали.

Лечение: специфического антидота нет. Эзомепразол активно связывается с белками плазмы и поэтому трудно поддается диализу. Как и во всех случаях передозировки, необходимо проводить симптоматическое и поддерживающее лечение.

Рекомендации по обращению за консультацией к лечащему врачу для разъяснения способа применения лекарственного препарата

Для разъяснения способа применения лекарственного препарата рекомендуется обращаться за консультацией к лечащему врачу

Описание нежелательных реакций, которые проявляются при стандартном применении ЛП и меры, которые следует принять в этом случае
Часто

- головная боль
- боль в животе, запор, диарея, метеоризм, доброкачественные железистые полипы, тошнота, рвота
- реакция в месте введения

Нечасто

- головокружение, парестезия, сонливость, бессонница, нечеткое зрение, вестибулярное головокружение
- сухость во рту, повышение активности ферментов печени
- дерматит, кожный зуд, сыпь, крапивница, периферические отеки
- перелом бедра, запястья или позвоночника

Редко

- реакции гиперчувствительности: лихорадка, ангионевротический отек, анафилактическая реакция/анафилактический шок
- нарушение вкуса, стоматит, кандидоз желудочно-кишечного тракта
- возбуждение, замешательство, депрессия
- релатит с желтухой (или без нее)
- аплеция, фотосенсибилизация
- бронхоспазм
- артралгия, миалгия
- лейкопения, тромбоцитопения, гипонатриемия
- общее недомогание, повышенное потоотделение.

Очень редко

- агрессия, галлюцинации
- гипекоагуляция
- печеночная недостаточность, энцефалопатия у пациентов с имеющимся заболеваниями печени
- многоформная эритема, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз, лекарственная реакция с эозинофилией и системными симптомами (DRESS-синдром)

• мышечная слабость

- агранулоцитоз, панцитопения
- интерстициальный нефрит, у некоторых пациентов одновременно выявлена и почечная недостаточность.

Частота неизвестна

- микрокопический колит
- подострая кожная форма красной волчанки
- гипомагнемия (тяжелую гипомагнмию может сопровождать гипокальциемия, а иногда гипокалиемия).

У пациентов в критическом состоянии, которые внутривенно получали инъекции омепразола (рацемата), особенно высокие дозы, в отдельных случаях отмечались необратимые нарушения зрения, но причинно-следственная связь не установлена.

При возникновении нежелательных лекарственных реакций обращаться к лечащему врачу, фармацевтическому работнику или напрямую в информационную базу данных по нежелательным реакциям (действиям) на лекарственные препараты, включая сообщения о неэффективности лекарственных препаратов

РГП на ПВХ «Национальный Центр экспертизы лекарственных средств и медицинских изделий» Комитета медицинского и фармацевтического контроля Министерства здравоохранения Республики Казахстан

http://www.ndda.kz

Дополнительные сведения
Состав лекарственного препарата

Одна флакон содержит

активное вещество – эзомепразол натрия 42.60 (эквивалентно эзомепразолу 40.00)

вспомогательные вещества: натрий гидроксид, диоксид титана.

Описание внешнего вида, запаха, вкуса
Лиофилизат пористой и однородной консистенции белого или почти белого цвета.

Форма выпуска и упаковка
По 40 мг активного вещества помещают в бесцветные флаконы из боросиликатного стекла типа I, укупоренные серыми резиновыми бромбутиловыми пробками и обжатые алюминиевыми колпачками с прокладками из полипропилена.

ДӘРІЛІК ПРЕПАРАТТЫ МЕДИЦИНАЛЫҚ ҚОЛДАНУ ЖӨНІНДЕГІ НҰСҚАУЛЫҚ (Қосымша парақ)

Саудалық атауы

Эзолект

Халықаралық патенттелмеген атауы

Эзолепразол

Дәрілік түрі, дозасы

Ињьекция және инфузия үшін ерітінді дайындауға арналған лиофилизацияланған ұнтақ, 40 мг

Фармакотерапиялық тобы

Ас қорыту жүйесі және зат алмасу. Қышқылдылықтың бұзылуымен байланысты ауруларды емдеуге арналған препараттар. Ойық жараға қарсы препараттар мен гастроэзофагалді рефлюкті ауруды емдеуге арналған препараттар (gastro-oesophageal reflux disease - GORD). Протоңды сорғы тегежштері. Эзолепразол АТХ коды А02BC05

Қолданылуы

Ересектер

Пероральді ем жүргізу мүмкін болмаған жағдайда баламалы ем ретінде қолданылады:

- эзофагит және/немесе рефлюктің айқын симптомдары бар пациенттерде гастроэзофагеальді рефлюкті ауру
- қабынуға қарсы стероидты емес препараттарды (ҚҚСП) қабылдаудан туындаған асқазанның пептидтік ойық жараларын емдеу үшін
- қауіп тобындағы пациенттерде ҚҚСП қабылдаған кезде асқазан мен он екі елі ішектің пептидтік ойық жаралары түзулінуінің профилактикасы үшін
- асқазанның немесе он екі елі ішектің ойық жарасынан жөдел қан кетуіді эндоскопиялық емдеуден кейін пациенттерде қайта қан кетуідің профилактикасы үшін.

1 жастан 18 жасқа дейінгі балалар мен жасөспірімдер:

- препаратты пероральді қабылдау мүмкін болмаған кезде, мысалы, эрозиялық рефлюкс-эзофагиті және/немесе ауыр рефлюкс симптомдары бар пациенттерде гастроэзофагеальді рефлюкті ауру (ГЭРА) кезінде асқазанды антисекреторлық емдеуге арналған.

Қолдануды бастағанға дейін қажетті мәліметтер тізбесі

Қолдануға болмайтын жағдайлар

- бензимидазолдарға, сондай-ақ препараттың қосымша компоненттеріне аса жоғары сезімталдық
- неффинавирмен бірге қолдану

Қолданған кездегі қажетті сақтық шаралары

Егде жастағы пациенттер

Дозаны түзету қажет емес.

Бүйрек функциясының бұзылуы

Дозаны түзету қажет емес. Ауыр бүйрек жеткіліксіздігі бар пациенттерде эзолепразолды қолданудың шектеулі тәжірибесіне байланысты мұндай пациенттерді емдеу кезінде сақ болу қажет.

ГЭРА бар пациенттерде бауыр функциясының бұзылуы

Жеіл және орташа ауырлық дәрежесінде бауыр функциясының бұзылуы бар пациенттерде Эзолект препараттың дозасын түзету қажет емес. Бауыр функциясының ауыр бұзылулары бар пациенттерде бастапқы 80 мг дозаны жылдам веналішілік инфузия жүргізуден кейін, 71,5 сағат бойы жүргізілетін ұзақ веналішілік инфузияға арналған дозаны сағатына 4 мг дейін шектеу керек.

Басқа дәрілік препараттармен өзара әрекеттесуі

Протеаза тегежштері

Атазанавирмен және нефдинавирмен біріктіру олардың плазмадағы концентрациясының төмендеуі мүмкіндігін байланысты ұсынылмайды. Омепразолмен (күніне 40 мг) біріктіріп емдеу кезеңінде қан сарқысындағы бакенавир (ритонавирмен бір мезгілде қолданғанда) деңгейінің жоғарылауы (80-100%) туралы хабарланды. Күніне 20 мг омепразол дозасын қолдану дарунавирді (ритонавирмен біріктірілімі) және ампренавирдің (ритонавирмен біріктірілімі) деңгейіне әсер етпеді. Эзолепразолды тәулігіне 20 мг дозада қолдану ампренавирдің деңгейіне әсер етпеді (ритонавирмен немесе онсыз).

Омепразолды күніне 40 мг дозада қолдану лопинавир деңгейіне әсер етпеді (ритонавирді бір мезгілде қабылдаумен).

Метотрексат

Кейбір пациенттерде метотрексат деңгейі жоғарылауы мүмкін, сондықтан метотрексаттың жоғары дозаларын қолданған кезде Эзолект препаратын қолдануды тоқтата тұру қажет.

Такролимус

Такролимус өсері күшеюі мүмкін, сондықтан Эзолект препаратымен бір мезгілде қолданған кезде қандағы такролимус концентрациясын күшейтілген бақылау, бүйрек функциясын бақылау және қажет болған жағдайда такролимус дозасын өзгерту талап етіледі.

Сіңірілуі асқазандағы қышқылдық деңгейіне байланысты болатын дәрілік препараттар

Эзолепразол, асқазандығы қышқыл секрециясын төмендетіп басқа дәрілер сияқты, кетоконазолдың, итраконазолдың және эрлотинибтің сіңірілуінің төмендеуіне және өсерінің әлсіреуіне әкелуі мүмкін, ал эзолепразолмен емдеу кезеңінде дигоксиннің сіңірілуі мен өсері ұлғаюу мүмкін. Дигоксиннің ұытты өсері сирек байқалды. Эзолект препаратының жоғары дозаларын қарттарға тағайындағанда сақ болу керек.

Бауыр ферменттерінің жұмысына әсер ететін дәрілік заттар

Диазепаммен, циталопраммен, имипраминмен, кло mipраминмен, фенитоинмен және басқалармен бір мезгілде қолданғанда осы препараттардың қан плазмасындағы концентрациясы жоғарылауы мүмкін, бұл Эзолект препаратының дозасын төмендетуді қажет етуі мүмкін. Вена ішіне енгізуге арналған эзолепразолдың жоғары дозаларын (80 мг + 8 мг/сағ) қолдана отырып, тірі организм ішіндегі дәрілік өзара әрекеттесулерге зерттеулер жүргізілмеген, сондықтан Эзолект препаратын вена ішіне енгізудің 3 күндік кезеңі ішінде жағымсыз жанама өсерлердің ықтималды дамуына байланысты жағдайды мұқият бақылау қажет.

Диазепам

Диазепаммен бір мезгілде қабылдаған кезде диазепам өсері әлсіреуі мүмкін.

Фенитоин

Эпилепсиясы бар пациенттерге эзолепразол 40 мг дозасын және фенитоин тағайындау қандағы фенитоин концентрациясының жоғарылауына әкелді, сондықтан Эзолект препаратымен емдеудің басында және оны тоқтатқан кезде қан плазмасындағы фенитоин концентрациясын бақылау ұсынылады.

Вориконазол

Омепразол (тәулігіне бір рет 40 мг) қандағы вориконазол деңгейінің жоғарылауын туғызды.

Цилостазол

Омепразол мен Эзолепразол цилостазол мен оның қандағы негізгі метаболиттерінің бірінші деңгейін жоғарылауы мүмкін.

Цизаприд

Цизапридті 40 мг эзолепразолмен бір мезгілде қабылдау цизапридтің фармакокинетикалық параметрлерінің жоғарылауына әкелді, алайда цизапридтің плазмадағы ең жоғары концентрациясы елеусіз өзгерді. Тек цизапридпен емдеу кезінде байқалған QT аралығының аздаған узаруы цизапридтің эзолепразолмен біріктіріп тағайындау кезінде байқалмады.

Варфарин

Варфарин мен эзолепразолды бір мезгілде қолданған кезде ХҚҚ индексінің (қанньң үю көрсеткіші) клиникалық маңызды жоғарылауының бірнеше жағдайлары байқалды, сондықтан осы екі препаратты немесе эзолепразолды кумариннің басқа туындыларымен бір мезгілде қолданудың басында және соңында бақылау ұсынылады.

Клопидогрел

Бір мезгілде қолдану клопидогрелдің өсерінің төмендеуіне әкеледі. Клиникалық зерттеулерде негізгі жүрек-қан тамырлары жағымсыз өсерлері турғысынан эзолепразолмен дәрілік өзара әрекеттесудің клиникалық салдары туралы қарама-қайшы мәліметтер алынды. Сақтық шарасы ретінде клопидогрелмен бір мезгілде қабылдау ұсынылмайды.

Клиникалық маңызды өзара әрекеттесуді түбегейлі айтатын зерттелген дәрілік препараттар

Амоксициллин және хинидин

Эзолепразолмен клиникалық маңызды өзара әрекеттесу байқалмады.

Напроксен және рофекоксиб

Қысқа мерзімді зерттеулер барысында эзолепразолмен клиникалық маңызды өзара әрекеттесуі байқалмады.

Бауыр ферменттерін бәсеңдететін дәрілік препараттар

Кларитромицинмен және вориконазолмен бір мезгілде қолдану қандағы эзолепразол деңгейінің 2 немерсе одан да көп өсе жоғарылауына әкелді. Мұндай жағдайларда Эзолект препаратының дозасын түзету әдетте талап етілмейді, алайда бауырдың ауыр жеткіліксіздігі бар пациенттерде және ұзақ емдеу кезінде дозаны түзету қажеттілігін ескеру керек.

Рифампицин және шілтер жапырақты шайқурай

Қанда Эзолект препараты деңгейінің жоғарылауына әкелуі мүмкін.

Балалар

Өзара әрекеттесуді зерттеу тек ересектерде жүргізілді.

Арнайы өскертүүлөр

Қатерлі жаңа түзілімдер

Көз-көпген үрейлі симптомдар пайда болған кезде (мысалы, дене салмағының күрт жоғалуы, қайталанатын құсу, дисфагия, қан аралас құсу немесе мөлена), сондай-ақ асқазанда ойық жара болған кезде (немесе асқазанда ойық жараға күдік болған кезде) қатерлі жаңа түзілімнің болуын жұқса шығару керек, өйткені Эзолект препаратымен емдеу симптоматиканың басылуына әкелуі және дұрыс диагноз қоюды кейінге қалдыруы мүмкін.

Ұзақ қолдану

Ұзақ ем қабылдайтын пациенттер (әсіресе, бір жылдан артық емделгендер), үнемі дәрігердің бақылауында болуы тиіс.

Талап бойынша емдеу

Талап бойынша ем қабылдайтын пациенттерге аурудың симптомдары өзгерген кезде дәрігерге хабарласу қажеттілігі туралы нұсқау берілуі керек. Плазмадағы эзолепразол концентрациясының ауытуына байланысты басқа фармацевтикалық препараттармен өзара әрекеттесудің салдарын ескеру қажет.

Дәрісөзге қаралу қажеттілігі

Аурудың симптомдары өзгерген кезде, дәрігерге қаралу қажет.

Helicobacter pylori эрадикациясы

Helicobacter pylori эрадикациясы үшін эзолепразолды тағайындаған кезде үштік терапияның барлық компоненттерінің өзара әрекеттесуін ескеру қажет.

Кларитромицин СУР3А4 күшті тегежші болып табылады, сондықтан кларитромициннің қарсы көрсетілімдері мен өзара әрекеттесулерін цизаприд сияқты СУР3А4 арқылы метаболизденетін басқа препараттарды бір мезгілде қабылдайтын пациенттердің үштік терапиясын қолдану кезінде ескеру керек.

Асқазан-ішек инфекциялары

Эзолепразолмен емдеу салмонеллалар мен кампилобактериялар тудыратын асқазан-ішек инфекцияларының даму қаупінің елеусіз жоғарылауына әкелуі мүмкін. Ұзақ уақыт бойы антисекрециялық препараттарды қабылдаған пациенттерде қышқыл секрециясының айқын бәсеңдеуі салдарынан физиологиялық өзгерістерге байланысты асқазанда безді кисталар түзіледі. Бұл кисталар қатерсіз және және қайтымды сипатқа ие.

В12 дәруменінің сіңуі

Асқазандағы қышқылдық деңгейінің төмендеуіне байланысты В12 дәруменінің (цианокобаламин) сіңуі төмендеуі мүмкін. Мұны салмағы аз немесе В12 дәруменінің сіңуін төмендету бойынша қауіп факторлары бар пациенттерде ұзақ емдеу кезінде ескеру керек.

Гипомагниемия

Эзолепразолды кем дегенде үш ай бойы қабылдайтын пациенттерде, ал көп жағдайда - бір жыл ішінде магний деңгейінің төмендеуі байқалды. Шаршау, тетания, сандырақтау, құрысулар, бас айналу және жүрек ыргағының бұзылуы сияқты магний деңгейінің төмендеуінің күрделі көріністері байқалуы мүмкін, олар кенеттен басталып, байқалмай қалуы мүмкін. Мұндай пациенттердің көшілігінде магний енгізгеннен және эзолепразолды қолдануды тоқтатқаннан кейін магний деңгейі көтерілді. Ұзақ ем қабылдауы мүмкін немесе дигоксинмен немесе гипомагниемияны тағайындағай кәрілерді (мысалы, несеп алдайтын) эзолепразол қабылдайтын пациенттер үшін Эзолект препаратымен емдеу басталғанға дейін және емдеу кезеңінде мезгіл-мезгіл магний деңгейін өлшеу мүмкіндігін қарастыру қажет.

Сынықтардың даму қаупі

Осы топтың препараттары, әсіресе егер олар жоғары дозаларда және ұзақ уақыт (1 жылдан астам) қолданылса, ортан жілік сүйегінің, білек сүйектерінің немесе омыртқаның, негізінен егде жастағы адамдарда немесе басқа қауіп факторлары болған кезде сынықтар қаупін (сынулардың жалпы қаупі 10-40% - га) аздап арттыруы мүмкін. Остеопороз қаупі бар пациенттер қолданудағы клиникалық ұсынстырға сәйкес қажетті ем қабылдауы және D дәрумені мен кальцийдің жеткілікті мөлшерін қабылдауы керек.

Қызыл жегінің терідегі жеделге жуық түрі

Қызыл жегінің терідегі жеделге жуық түрі жағдайлары өте сирек байқалды. Егер мұндай зақымданулар пайда болса, әсіресе терінің күн сәулесінен қорғалмаған жерлерінде және олар буының ауырсынуымен қатар жүрсе, шұғыл түрде дәрігерге қаралу керек. Мұндай жағдайларда Эзолект препаратын тоқтату қажеттілігі туындауы мүмкін. Егер бұрын, осы топтың препараттарын қолданғаннан кейін, пациентте қызыл жегінің терідегі жеделге жуық түрі байқалса, мұндай препараттарды қайталап қолданған кезде бұл аурудың даму қаупі артады.

Басқа дәрілік препараттармен біріктірілуі

Эзолепразол мен атазанавирді бір мезгілде қолдану ұсынылмайды. Егер атазанавирмен біріктірілім өте қажет болатын болса, атазанавирді дозасын 400 мг-ге дейін арттырумен + 100 мг ритонавирмен бірге мұқият клиникалық бақылау ұсынылады; Эзолект препаратының дозасын 20 мг-ден асыруға болмайды.

Эзолект препаратымен емдеудің басында немесе аяқталғаннан кейін басқа дәрілік препараттармен өзара әрекеттесу мүмкіндігін ескеру қажет. Клопидогрел мен эзолепразол арасындағы өзара әрекеттесу байқалды. Бұл өзара әрекеттесудің клиникалық маңыздылығы белгісіз. Сақтық шарасы ретінде эзолепразол мен клопидогрелді бір мезгілде қабылдау ұсынылмайды.

Күрделі тері реакциялары

Өмірге қауіп төндіруі мүмкін мультиформалы эритема, Стивенс-Джонсон синдромы, ұытты эпидермальді некролиз және эозинофилиямен және жүйелі симптомдармен (DRESS - синдром) дәрілік реакция сияқты терінің күрделі жағымсыз реакциялары туралы эзолепразолмен емдеуге байланысты өте сирек хабарланған.

Пациенттер жоғарыда аталған аурулардың ауыр тері реакциясының белгілері мен симптомдары туралы хабардар болуы тиіс және кез келген сипатты белгілері немесе симптомдары пайда болған кезде дәреу өз дәрігеріне медициналық көмекке шақынуі тиіс.

Ауыр тері реакцияларының белгілері мен симптомдары пайда болған кезде эзолепразолды қабылдауды дереу тоқтату және қажет болған жағдайда қосымша медициналық көмекті/мұқият мониторингті қамтамасыз ету керек.

Қайта түртіті болу жоғарыда аталған тері аурулары бар пациенттерде жүргізілеуі тиіс.

Зертханалық зерттеу нәтижелеріне өсері

Хромогранин А (Сга) деңгейінің жоғарылауы нейроэндокриндік ісіктерді зерттеуді қиындатуы мүмкін. Бұл өсерді болдырмау үшін Эзолект препаратымен емдеуді Сга өлшеуге дейін кемінде 5 күн бұрын тоқтату керек. Егер бастапқы өлшеуден кейін Сга және гастрин деңгейлері бақылау көрсеткіштеріне қайта оралмаса, бұл өлшеулерді Эзолект препаратымен емдеу тоқтатылғаннан кейін 14 күннен кейін қайталау керек.

Қосымша заттар

Бұл препарат (40 мг) құрамында 23 мг-нан аз натрий бар, яғни іс жүзінде натрий жоқ.

Жүктілік немесе лактация кезінде

Жүктілік кезінде эзолепразолды қолдану бойынша клиникалық деректер жеткіліксіз. Жүкті әйелдер бойынша қолда бар деректер шараның даму келістігі немесе жана туған нәрестенің денсаулығына өзінше көрсетпейді. Клиникаға дейінгі зерттеулер ұрпақты болу мүмкіндігін, шараның жатырышылық дамуын, жүктіліктің ағымын, босанудың немесе туғаннан кейінгі ұрпақтың дамуына тікелей немесе жанама зиянды өсерді көрсетпейді. Эзолепразолды жүкті әйелдерге тағайындағанда сақ болу керек. Эзолепразолдың емшек сүтімен бөлінетіні немесе бөлінбейтіні белгісіз, эзолепразолдың жана туған нәрестелерге/емшектегі сбилерге өсері туралы ақпарат жеткіліксіз, сондықтан бала емізу кезеңінде Эзолект препаратын тағайындауға болмайды.

Препараттың келік құралын немесе қауіптілігі зор механизмдерді басқару қабілетіне әсер ету өрешкіліктері

Эзолепразол келік жүргізу немесе қозғалмалы механизмдермен жұмыс істеу қабілетіне елеусіз әсер етеді. Бас айналу және көрудің бұлыңғырлануы сияқты сирек жағымсыз реакциялар туралы хабарламалар келіп түсті, мұндай жағдайларда автокелікті басқаруға немесе механизмдерді пайдалануға болмайды.

Қолдану жөніндегі нұсқаулар

Дозалау режимі

Ересектер

Пероральді ем жүргізу мүмкін болмаған жағдайда пациенттерге тәулігіне 1 рет 20 - 40 мг дозада Эзолект препараты парентеральді түрде тағайындаулы мүмкін. Рефлюкс-эзофагиті бар пациенттерге Эзолект препаратын тәулігіне 1 рет 40 мг дозада енгізу көрсетілген. ГЭРА симптоматикалық емі үшін Эзолект препараты тәулігіне 1 рет 20 мг дозада қолданылады. ҚҚСП қабылдаумен байланысты пептидтік ойық жараларды емдеу және профилактикасы үшін Эзолект препараты тәулігіне 1 рет 20 мг дозада ұсынылады.

Асқазанның немесе он екі елі ішектің ойық жарасынан жөдел қан кетуіді эндоскопиялық емдеуден кейін пациенттерде қайта қан кетуідің профилактикасы: асқазан немесе он екі елі ішектің ойық жарасынан жөдел қан кетуіді эндоскопиялық емдеуден кейін пациенттерде қайта қан кетуідің дамуын болдырмау үшін препараттың дозасы 80 мг құрайды. Бұл дозаны 30 минут ішінде вена ішіне баяу енгізеді, содан кейін 3 күн ішінде (72 сағат) препараттың үздіксіз вена ішіне инфузиясын 8 мг/сағ дозада жүргізеді.

Әдетте, Эзолект препаратын вена ішіне енгізу кезеңі үшін, пациентті эзолепразолдың емдеуді түріне тез ауыстыру ұсынылады. Парентеральді емдеу кезеңі антисекрециялық дәрілік препараттарды пероральді қабылдаумен қатар жүруі тиіс.

Енгізу әдісі мен жолы

Препаратты ињьекция арқылы енгізу

40 мг доза: Эзолект препаратының 5 мл дайындалған ерітіндісін (8 мг/мл) вена ішіне кемінде 3 минут бойы енгізу қажет.

20 мг доза: Эзолект препаратының 2,5 мл дайындалған ерітіндісін (8 мг/мл) вена ішіне кемінде 3 минут енгізу қажет; ерітіндінің пайдаланылмаған қалдықтарын жою керек.

Препаратты инфузия арқылы енгізу

40 мг доза: Эзолект препаратының дайындалған ерітіндісін 10-30 минут ішінде вена ішіне инфузия түрінде енгізіледі.

20 мг доза: Эзолект препаратының дайындалған ерітіндісін 1/2 бөлігі вена ішіне инфузия түрінде 10-30 минут ішінде енгізіледі; ерітіндінің пайдаланылмаған қалдықтарын жою керек.

80 мг болосіті доза: Эзолект препаратының дайындалған ерітіндісі вена ішіне баяу инфузия түрінде - 30 минут ішінде енгізіледі.

8 мг/сағ доза: Эзолект препаратының дайындалған ерітіндісі 71,5 сағат бойы ұзақ вена ішіне инфузия түрінде енгізіледі (инфузияның есептік жылдамдығы – 8 мг/сағ, дайындалған ерітіндінің жарамдылық мерзімі "Сақтау шарттары" бөлімінен қараңыз).

1-18 жастағы балалар мен жасөспірімдер

Балама ретінде пероральді емдеу мүмкін болмаған кезде асқазан ауруларын антисекрециялық емдеу Эзолект 40 мг препараты, ињьекция мен инфузияға арналған ерітінді дайындауға арналған ұнтақ, 1 жасдан 18 жасқа дейінгі балалар мен жасөспірімдерде, олар пероральді препараттарды қабылдай алмайтын жағдайда (ГЭРА емдеудің толық кезеңінің бөлігі ретінде) қолданылуы мүмкін (дозаны төмендегі кестеден қараңыз). Емдеудің бастапқы кезеңінде препарат күніне бір рет, парентеральді түрде енгізіледі. Әдетте, веналішілік емдеу ұзақтығы қысқа болуы керек және пероральді емдеуге көшу мүмкіндігінше тез жасалуы керек.

Жасы	Эрозиялық рефлюктік эзофагитті емдеу	Симптоматикалық емдеу ГЭРА
1-11 жас	Салмағы <20 кг: күніне бір рет 10 мг Салмағы ≥20 кг: күніне бір рет 10 мг немесе 20 мг	Күніне бір рет 10 мг-ден
12-18 жас	Күніне бір рет 40 мг	Күніне бір рет 20 мг-ден

Эзолект препаратын вена ішіне енгізу үшін ұсынылатын дозалар

Жасы	Эрозиялық рефлюктік эзофагитті емдеу	Симптоматикалық емдеу ГЭРА
1-11 жас		