

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
ВЕЛОЗ
(VELOZ)

Загальна характеристика:

міжнародна та хімічна назви: rabeprazole; 2-[{4-(3-метоксипропокси)-3-метилпiperидин-2-іл}-метилсульфеніл]-1H-бензimidазол натрію;

основні фізико-хімічні властивості: круглі двоопуклі таблетки, вкриті оболонкою, жовтого кольору.

склад: 1 таблетка містить рабепразолу натрію 10 мг або 20 мг;

допоміжні речовини: манітол, магнію оксид легкий, кросповідон, натрію гідроксид, повідон К-30, магнію стеарат, кремнію діоксид колоїдний, гідроксипропілметилцелюлоза, етилцелюлоза, тальк, діетилфталат, гідроксипропілметилцелюлози фталат, титану діоксид, заліза оксид жовтий.

Форма випуску. Таблетки, вкриті оболонкою, кишковорозчинні.

Фармакотерапевтична група. Засоби для лікування пептичної виразки та гастроєзофагеальної рефлюксної хвороби. Інгібітори “протонного насоса”. Код АТС А02В С04.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Рабепразол належить до класу антисекреторних сполук, які у хімічному відношенні є заміщеними бензамідазолами. Препарат пригнічує секрецію шлункової кислоти шляхом специфічного пригнічення ферменту H^+/K^+ -АТФ-ази на секреторній поверхні паріетальних клітин шлунка. Ця ферментна система вважається кислотним (протонним) насосом, і, таким чином, рабепразол класифікується як інгібітор протонного насоса помпи шлунка, що блокує фінальну стадію вироблення кислоти. Рабепразол перетворюється в активну сульфонамідну форму шляхом протонування і, таким чином, реагує з доступними залишками цистеїну протонного насоса.

Після перорального прийому рабепразолу антисекреторний ефект спостерігається через 1 год і досягає максимуму через 2 - 4 год. Ефект пригнічення базальної функції та стимулювання їжею секреції кислоти через 23 год після прийому першої дози рабепразолу становив 62 і 82% відповідно, а тривалість цього ефекту досягала 48 год. Ефективність рабепразолу щодо пригнічення секреції кислоти дещо посилюється в процесі щоденного прийому 1 таблетки (20мг), але стабільне пригнічення секреції досягається через 3 дні після початку прийому цього препарату. Після завершення приймання рабепразолу секреторна активність нормалізується протягом 2 - 3 днів.

Після прийому 10 мг або 20 мг рабепразолу 1 раз на добу протягом 12 місяців, у перші 2 - 8 тижнів терапії концентрація гастрину у сироватці зростає, що призводить до пригнічення секреції кислоти. Концентрація гастрину повертається до початкового рівня, як правило, протягом 1 - 2 тижнів після припинення лікування.

Інші ефекти. Дотепер немає даних щодо системних ефектів з боку центральної нервової системи, серцево-судинної і дихальної систем, які були б спричинені прийомом рабепразолу.

Фармакокінетика. Абсорбція. Велоз – це таблетки, вкриті плівкою, що розчиняється у кишечнику. Рабепразол швидко абсорбується з кишечнику. Пікові концентрації рабепразолу у плазмі досягаються приблизно через 3,5 год після прийому дози 20 мг. Пікові концентрації у плазмі (C_{max}) та площа під кривою (AUC) рабепразолу мають лінійний характер у діапазоні доз від 10 до 40 мг. Абсолютна біодоступність після перорального прийому 20 мг (у порівнянні з внутрішньовенним введенням) становить приблизно 52% значною мірою через метаболізм першого проходження. Крім того, біодоступність при багаторазовому прийомі рабепразолу не зростає. У здорових добровольців період напіввиведення з плазми становить приблизно 1 год (від 0,7 до 1,5 год), а сумарний кліренс дорівнює відповідно до показників 283 ± 98 мл/хв. Їжа та час прийому протягом доби не впливають на абсорбцію рабепразолу натрію.

Розподіл. У людини ступінь зв'язування рабепразолу з білками плазми становить майже 97%.

Метаболізм та екскреція. У людини головними метаболітами, присутніми у плазмі, є тіоєфір (M1) і

карбонова кислота (М6), а другорядні метаболіти, що присутні в низьких концентраціях, представлені сульфоном (М2), диметилтіоеофіром (М4) і кон'югатом меркаптурової кислоти (М5). Незначну антисекреторну активність має лише диметилловий метаболіт (М3), однак він не присутній у плазмі.

Показання для застосування. Пептична виразка дванадцятипалої кишки (ДПК); пептична виразка шлунка; гастроєзофагеальна рефлюксна хвороба (ГЕРХ); невиразкова диспепсія; для ерадикації *Helicobacter pylori* (*H. pylori*) (у комбінації з відповідними антибактеріальними засобами); синдром Золлінгера-Еллісона; хронічний гастрит у стадії загострення з підвищеною кислотоутворюючою функцією шлунка.

Спосіб застосування та дози. При пептичній виразці ДПК, пептичній виразці шлунка та ГЕРХ призначають по 20 мг два рази на добу. Тривалість курсу лікування при пептичній виразці ДПК становить 2 - 4 тижні, при виразці шлунка – 2 - 8 тижнів, а при ГЕРХ – 4 - 8 тижнів; підтримуюча терапія при ГЕРХ становить 10 мг або 20 мг один раз на добу до 12 місяців.

При невиразковій диспепсії призначають по 40 мг 1 раз на добу або по 20 мг двічі на добу протягом 2 - 3 тижнів.

Для ерадикації *H. Pylori* необхідно звертатися до схем комплексної терапії відповідними антибіотиками (амоксациліном, кларитроміцином, тетрацикліном), метронідазолом, фуразолідоном та препаратами вісмуту.

Велоз по 20 мг 2 рази на добу + кларитроміцин по 500 мг 2 рази на добу + амоксицилін по 1 г 2 рази на добу протягом 7 днів.

Велоз по 20 мг 2 рази на добу + кларитроміцин по 500 мг 2 рази на добу + метронідазол по 400 мг 2 рази на добу протягом 7 днів.

При синдромі Золлінгера-Еллісона початкова доза препарату становить 60 мг на добу, за необхідності дозу підвищують. Підбір дози визначається індивідуально.

При хронічному гастриті з підвищеною кислотоутворюючою функцією шлунка у стадії загострення призначають по 40 мг на добу (по 1 таблетці 2 рази або по 2 таблетки 1 раз на добу) протягом 2 - 3 тижнів.

Таблетки не можна розжовувати або дробити, треба ковтати цілими.

Побічна дія. Звичайно Велоз добре переноситься пацієнтами. Найчастішими негативними проявами з боку травного тракту і печінки можуть бути: діарея або запор, біль у животі, нудота, блювання, метеоризм, відрижка; зрідка - підвищення активності печінкових ферментів, порушення смаку, сухість у роті.

З боку системи кровотворення: в окремих випадках лейкопенія, тромбоцитопенія.

З боку нервової системи: можливі запаморочення, головний біль, збудження або сонливість, депресія.

Алергічні реакції: шкірні висипання, свербіж, ангіоневротичний набряк, бронхоспазм.

Інші прояви: фарингіт, біль у спині, грипоподібний синдром, міалгія, біль у грудях, синусит, судоми литкових м'язів, інфекція сечовидільних шляхів, у поодиноких випадках спостерігалось збільшення маси тіла, порушення зору, підвищена пітливість.

У разі виникнення дерматологічних проявів застосування препарату слід припинити.

Протипоказання. Підвищена чутливість до рабепразолу, заміщених бензimidазолів або будь-якого іншого інгредієнта цього препарату. Вагітність і лактація. Діти до 12 років.

Передозування.

Симптоми: підвищена пітливість, запаморочення, головний біль, сонливість, сухість у роті, нудота, блювання.

Лікування. Специфічний антидот невідомий. При передозуванні необхідно проводити симптоматичне лікування.

Особливості застосування. Перед початком застосування необхідно виключити наявність у хворого

злякисного новоутворення.

При призначенні Велозу пацієнтам з тяжкими порушеннями функції нирок та печінки рекомендується бути обережним на ранніх стадіях терапії препаратом.

Не застосовується для лікування дітей, оскільки немає досвіду його застосування у пацієнтів цієї вікової групи.

Безпека застосування Велозу під час вагітності не досліджена. Експериментально доведено, що препарат може проникати крізь плацентарний бар'єр, тому застосування його під час вагітності протипоказане. Невідомо, чи здатний рабепразол проникати у грудне молоко матері, тому Велоз не слід призначати матерям, які годують груддю.

У разі виникнення сонливості рекомендується утримуватися від керування автомобілем та роботи з механізмами.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами. Рабепразол, як і інші інгібітори протонного насоса, метаболізується ферментами, що входять до печінкової системи цитохрому P₄₅₀ (CYP450). Рабепразол сильно і тривало знижує продукування шлункової кислоти. Таким чином, рабепразол може взаємодіяти з препаратами, абсорбція яких залежить від показника рН шлункового вмісту. Прийом рабепразолу спричиняє зниження концентрацій кетоконазолу на 33% в плазмі і підвищення на 22% мінімальних концентрацій дигоксину. Таким чином, окремі пацієнти, які застосовують зазначені препарати разом з Велозом, повинні перебувати під наглядом лікаря для визначення необхідності корекції дози. Дослідження *in vitro* показали, що рабепразол метаболізується ізоферментами системи CYP450 (CYP2C9 та CYP3A). Ці дослідження дозволяють вважати, що Велоз має низьку здатність до лікарської взаємодії; при цьому його вплив на метаболізм циклоспорину аналогічний впливу інших інгібіторів протонного насоса.

Умови та термін зберігання. Зберігати в недоступному для дітей, захищеному від світла місці при температурі не вище 25°C. Термін придатності – 2 роки.

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка. По 10 таблеток у стрипі; по 2 або 3 стрипи в картонній упаковці.

Виробник. Торрент Фармасьютікалс Лтд.
Torrent Pharmaceuticals Ltd.

Адреса.

Офіс: Торрент Хауз, Оф Ашрам Роуд, Ахмедабад 380 009, Індія.
Torrent House, Off Ashram Road, Ahmedabad 380 009, India.