

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
ГЕЕРДІН
GEERDIN

Загальна характеристика:

міжнародна та хімічна назва: rabeprazole; 2-[[[4-(3-метоксипропоксі)-3-метил-2-піридил]-метил]-сульфініл]-1H-бензimidазолу натрієва сіль;

основні фізико-хімічні властивості: біла кристалічна ліофілізована маса з жовтуватим відтінком;

склад: 1 флакон містить рабепразолу натрію 20 мг;

допоміжні речовини: маніт.

Форма випуску.

Порошок ліофілізований для приготування розчину для ін'єкцій.

Фармакотерапевтична група.

Інгібітори протонної помпи. Код АТС А02ВС04.

Фармакологічні властивості.

Інгібітор H^+ - K^+ -АТФ-ази (протонної помпи). Пригнічення активності ферменту H^+ - K^+ -АТФ-ази в паріетальних клітинах шлунка призводить до блокування кінцевої стадії утворення соляної кислоти. Ця дія є дозозалежною і призводить до пригнічення як базальної, так і стимульованої секреції соляної кислоти незалежно від подразника. Рабепразол зв'язується за допомогою ковалентного зв'язку з протонною помпою паріетальних клітин, що супроводжується необоротним зниженням секреції кислоти. Кислота може виділятися тільки новоутвореними протонними помпами. Таким чином, кінетика рабепразолу у плазмі крові не має вирішального значення для антисекреторної дії: період біологічної активності рабепразолу значно перевищує період його напіввиведення з плазми. Більше значення має період напівжиття протонної помпи (20 - 24 год), а не період напіввиведення рабепразолу.

Максимальний рівень зниження секреції може бути отриманий у випадку, коли рабепразол досягає паріетальної клітини в момент її активації. Це може бути досягнуто внутрішньовенним інфузійним введенням рабепразолу. Завдяки цьому активізована під впливом циркадних ритмів (ацетилхолін) або після їжі (гістамін і гастрин) протонна помпа відразу ж зв'язується з молекулою рабепразолу і продукція соляної кислоти припиняється.

Активна речовина препарату рабепразол - швидко накопичується в кислому середовищі паріетальних клітин шлунку, де перетворюється в активну форму приєднанням до неї сульфенамідної групи. Взаємодіє з цистеїнами протонної помпи.

Після внутрішньовенного введення дія рабепразолу розвивається протягом 1 год і досягає максимуму через 2 - 4 год. Середній кліренс при введенні внутрішньовенно дози 20 мг становить 283+/-98 мл/хв. Період напіввиведення дози 20 мг, введеної внутрішньовенно, становить 1,02 +/-0,63 год. Після відміни препарату секреторна активність відновлюється через 2 - 3 дні.

Застосування препарату в дозі 20 мг на добу протягом 2 тижнів не впливає на функцію щитовидної залози, метаболізм вуглеводів, концентрацію в крові паратгормону, кортизолу, естрогену, тестостерону, пролактину, холецистокініну, секретину, глюкагону, ФСГ, ЛГ, СТГ, реніну, альдостерону.

Фармакокінетика. Абсолютна біодоступність при внутрішньовенному введенні дози 20 мг становить близько 100%, тобто всі молекули рабепразолу досягають паріетальних клітин. Біодоступність рабепразолу не міняється при багаторазовому введенні. Зв'язування з білками плазми становить 97%.

При багаторазовому введенні рабепразолу спостерігається лінійна фармакокінетика, тобто час напіввиведення, кліренс і об'єм розподілу рабепразолу є дозозалежними величинами.

Метаболізується в печінці. Рабепразол натрію біотрансформується з утворенням основних метаболітів тіоефіру і вугільної кислоти. Інші метаболіти - сульфон, диметилтіоефір і кон'югат меркаптурової кислоти - наявні в низьких концентраціях.

Період напіввиведення з сироватки крові становить близько 1 години. Приблизно 90% дози виводиться із сечею переважно у вигляді двох метаболітів: кон'югату меркаптурової кислоти і карбонової кислоти. Невелика частина метаболітів виводиться з калом.

У пацієнтів літнього віку виведення рабепразолу дещо сповільнюється. Кумуляції рабепразолу не відзначалося.

Показання для застосування.

Пептична виразка чи ерозії шлунка, у тому числі ускладнені кровотечею;

пептична виразка чи ерозія дванадцятипалої кишки, у тому числі ускладнені кровотечею;

профілактика кислотних аспірацій;

гастроезофагальна рефлюксна хвороба (ГЕРХ) при неможливості приймання таблетованої форми;

ерадикація *Helicobacter pylori*, при неможливості перорального застосування (у комбінації з антибактеріальними засобами);

синдром Золлінгера-Еллісона.

Спосіб застосування та дози.

Геердін для внутрішньовенного введення призначають як терапію, альтернативну пероральному застосуванню при наявності показань або додатково до пероральної форми. Дорослим хворим на виразку дванадцятипалої кишки, виразку шлунка рекомендують Геердін в дозі 20 мг один раз на добу. Пацієнтам з рефлюкс-езофагітом призначають препарат по 20 мг один раз на добу. Пацієнтам, яким проводиться симптоматичне лікування рефлюксу, призначають препарат по 20 мг один раз на добу. При синдромі Золлінгера-Еллісона препарат призначають у початковій дозі 60 мг на добу.

При необхідності можливе збільшення дози.

У випадку, коли добова доза перевищує 60 мг, її варто розділити на 2 введення.

Рекомендовано внутрішньовенне введення препарату Геердін. Інші способи парентерального введення, крім внутрішньовенного, не рекомендуються.

Правила розчинення:

Внутрішньовенна ін'єкція: вміст флакона розчинити у 5 мл розчинника (води для ін'єкцій, натрію хлориду 0,9%) вводити у вену повільно – протягом 5 хв.

Внутрішньовенна інфузія: для проведення інфузії вміст флакона потрібно розчинити у 5 мл води ін'єкцій, отриманий об'єм розчину перенести у флакон зі 100 мл розчину натрію хлориду 0,9% або з 100 мл 5% розчину декстрози для інфузій. Перед введенням необхідно візуально оцінити повноту розчинення та виключити зміни кольору, наявність осаду та зміну прозорості розчину. Розчин повинний бути використаний протягом 4 годин. Невикористаний розчин зберігати не рекомендується.

Дозування в особливих клінічних випадках: не потребується корекції доз у літніх пацієнтів, у хворих з помірною нирковою недостатністю або у хворих з помірним порушенням функції печінки. У пацієнтів з помірною печінковою недостатністю виведення рабепразолу уповільнюється. Внаслідок недостатньої кількості клінічних даних відносно внутрішньовенного застосування рабепразолу у хворих з істотним порушенням функції печінки рабепразол таким хворим призначається у разі крайньої необхідності у половинній дозі (10 мг) під наглядом лікаря.

Побічна дія.

З боку системи травлення: до 5% діарея, нудота; 2-5% біль у животі, блювання, метеоризм, закріп; до 1% сухість у роті, явища диспепсії, відрижка; у поодиноких випадках анорексія, гастрит, стоматит, підвищення активності печінкових трансаміназ.

З боку ЦНС: до 5% головний біль; 2-5% астения, запаморочення, безсоння; до 1% збудження, сонливість; у поодиноких випадках депресія, порушення зору і смаку.

З боку дихальної системи: 2 - 5% риніт, фарингіт, кашель; до 1% синусит, бронхіт.

Алергійні реакції: до 1% шкірна висипка; в поодиноких випадках - свербіж .

Інші: 2 - 5% біль у спині, грипоподібний синдром; до 1% міальгія, судоми м'язів гомілки, артралгія, гарячка; у поодиноких випадках збільшення маси тіла, посилення потовиділення, лейкоцитоз, тромбоцитопенія, нейтропенія.

При появі перерахованих побічних дій рекомендується припинити приймання Геердіну.

Протипоказання.

Не рекомендується призначати Геердін при наявності чутливості до рабепразолу або інших бензмідазолів.

Обережно слід застосовувати для лікування пацієнтів з порушеною функцією нирок, печінки та дихальною недостатністю.

Не рекомендується призначати Геердін пацієнтам з нирковою недостатністю.

Передозування.

Максимальна доза не повинна перевищувати 120 мг одноразово або 160 мг на добу. Не спостерігалось клінічних симптомів, спричинених значним передозуванням.

Лікування: при випадковому прийомі препарату у високих дозах проводять симптоматичну терапію. Специфічного антидоту немає. Рабепразол натрію добре зв'язується з білками сироватки крові, тому погано виводиться при діалізі.

Особливості застосування.

Перед початком лікування Геердіном необхідно виключити злоякісні новоутворення шлунка та стравоходу, оскільки прийом препарату може маскувати симптоми і відтермінувати виявлення пухлини.

Геердін не призначається дітям, оскільки на даний час відсутній досвід його застосування в педіатричній практиці.

Не було проведено достатньої кількості досліджень щодо впливу на вагітних жінок, тому Геердін повинен застосовуватись при вагітності лише у разі нагальної потреби. Виділяється з молоком при грудному вигодовуванні.

Доза при печінковій недостатності повинна бути знижена.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами.

Рабепразол натрію не вступає в клінічно значущу взаємодію з препаратами, що метаболізуються ферментними системами цитохрому P450, 2C19 і 3A (варфарин, фенітоїн, теофілін, діазепам). Геердін спричиняє виражене і тривале пригнічення секреції соляної кислоти. Тому при одночасному застосуванні Геердіну з препаратами, абсорбція яких залежить від рН шлункового вмісту (кетоконазол, дигоксин, ітраконазол), необхідна корекція доз останніх. Призначення Геердіну в комбінації з антацидами не призводить до значних клінічних змін у концентрації рабепразолу в плазмі крові. При одночасному застосуванні Геердін зазвичай не впливає на метаболізм циклоспорину.

Умови та термін зберігання.

Зберігати при температурі не вище 25 С, у сухому, захищеному від світла та недоступному для дітей місці.

Термін придатності - 2 роки.

Не рекомендується застосовувати після закінчення терміну придатності.

Умови відпуску.

За рецептом.

Упаковка.

По 20 мг рабепразолу натрію у флаконі 10 мл, по 1 флакону у картонній пачці.

Неон Лабораторіз Лімітед, для Мілі Хелскере Лімітед, Великобританія.

Адреса.

Хай Пойнт

Томас Стріт

Тонтон

Сомерсет TA2 6NB