

Состав

действующее вещество: esomeprazole;

1 таблетка, покрытая оболочкой, содержит эзомепразола магния тригидрата эквивалентно эзомепразола 20 мг;

вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, натрия гидрокарбонат, кремния диоксид коллоидный, кросповидон, повидон (К-30), магния стеарат, тальк, ароматизатор мятный;

оболочка (опадрай белый 58901 (Opadry White), тальк, железа оксид желтый (E 172) - имеется в таблетках, покрытых пленочной оболочкой, 20 мг, железа оксид красный (E172) - имеется в таблетках, покрытых пленочной оболочкой, 40 мг.

Лекарственная форма

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Основные физико-химические свойства: овальные, двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой светло-желтого цвета, с насечкой для деления с одной стороны.

Фармакотерапевтическая группа

Средства для лечения язвенной болезни и гастроэзофагеальной рефлюксной болезни. Ингибиторы протонного насоса. Эзомепразол. Код АТХ A02B C05.

Фармакодинамика

Эзомепразол является S-изомер омепразола, который снижает секрецию желудочного сока благодаря специфически направленном механизма действия. Он является специфическим ингибитором протонного насоса в париетальной клетке. R- и S-изомеры омепразола имеют одинаковую фармакодинамическом активность.

Эзомепразол является слабым основанием, он концентрируется и переходит в активную форму в высококислотных среде секреторных канальцев париетальной клетки, где он ингибирует фермент $H^+K^+-ATPase$ - кислотного насоса, а также подавляет базальную и стимулированную секрецию кислоты.

После приема 20 мг и 40 мг эзомепразола действие наступает в течение часа. После повторного приема 20 мг эзомепразола 1 раз в сутки в течение 5 дней

средний пик выброса кислоты после стимуляции пентагастрином снижается на 90% при определении этого показателя через 6-7 часов после приема дозы на 5-й день.

Через 5 дней приема эзомепразола по 20 мг и 40 мг перорально уровень pH желудка был более 4 в среднем в течение 13 и 17 часов соответственно и более 24 часов у пациентов с симптоматическим рефлюкс-эзофагитом. Доля пациентов, у которых уровень pH желудка был больше 4 в течение 8, 12 и 16 часов после приема 20 мг эзомепразола составила соответственно 76%, 54% и 24%. Соответствующие пропорции для эзомепразола 40 мг составляли 97%, 92% и 56%.

При использовании AUC в качестве косвенного показателя плазменной концентрации была показана зависимость подавления секреции кислоты от экспозиции препарата.

Терапевтические эффекты подавления секреции соляной кислоты

Лечение рефлюкс-эзофагит эзомепразолом 40 мг было успешным приблизительно у 70% больных после 4 недель лечения и в 93% - после 8 недель лечения.

Применение эзомепразола 20 мг два раза в сутки в течение одной недели вместе с соответствующими антибиотиками приводило к успешной эрадикации *Helicobacter pylori* приблизительно у 90% больных. После такого лечения в течение одной недели не было необходимости в проведении дальнейшей монотерапии антисекреторными препаратами для успешного заживления язвы и устранения симптомов неосложненной язвы двенадцатиперстной кишки.

Другие эффекты, связанные с угнетением секреции соляной кислоты

В период применения антисекреторных препаратов концентрация гастрина в плазме крови увеличивается в ответ на снижение секреции кислоты. Хромогранин А (CgA) также повышается в связи со снижением желудочной кислотности.

Возможно, увеличение количества ECL-клеток связано с повышением уровня гастрина в плазме крови, что наблюдалось у некоторых пациентов при длительном применении эзомепразола.

Были получены сообщения о нескольких случаях повышение частоты возникновения гранулярных кист в желудке при длительном применении антисекреторных препаратов. Эти явления являются физиологическим следствием длительного подавления секреции кислоты и имеют

доброкачественный и обратимый характер.

Снижение кислотности желудочного сока вследствие применения любого ингибитора протонной помпы увеличивает в желудке количество бактерий, присутствующих в пищеварительном тракте в норме. Лечение ингибиторами протонной помпы может приводить к повышению риска гастроинтестинальной инфекции, вызванной, например, *Salmonella* или *Campylobacter* и, в госпитальных больных, возможно, также *Clostridium difficile*.

Эзомепразол был более эффективным по сравнению с ранитидином при лечении язв желудка у пациентов, лечившихся НПВП (НПВП), включая селективные ингибиторы ЦОГ-2.

Эзомепразол был эффективным при профилактике язв желудка и двенадцатиперстной кишки у пациентов, лечившихся НПВП (НПВС) (у пациентов в возрасте от 60 лет и/или с язвой в анамнезе).

Фармакокинетика

Абсорбция

Абсорбция эзомепразола происходит быстро, пиковые концентрации в плазме крови достигается через 1-2 часа после приема. Биодоступность составляет 64% после разовой дозы 40 мг и возрастает до 89% после повторного приема 1 раз в сутки. Для 20 мг эзомепразола соответствующие значения - 50% и 68%.

Прием пищи замедляет и снижает абсорбцию эзомепразола, однако это не влияет на эффект эзомепразола по кислотности в полости желудка.

Распределение

Объем распределения у здоровых добровольцев в состоянии равновесия составляет 0,22 л/кг массы тела. Эзомепразол на 97% связывается с белками плазмы крови.

Метаболизм

Эзомепразол полностью метаболизируется с помощью цитохромной системы 450 (CYP). Основная часть метаболизма эзомепразола зависит от полиморфного 2C19, отвечающий за возникновение гидрокси и дезметилметаболитив эзомепразола. Другая часть зависит от второй специфической изоформы, CYP3A4, которая отвечает за возникновение эзомепразолсульфону - основного метаболита в плазме крови.

Вывод

Параметры, приведенные ниже, главным образом отражают фармакокинетику у лиц с функциональным ферментом 2C19 (экстенсивных метаболитаторов).

Общий клиренс плазмы крови составляет около 17 л/час после разовой дозы и около 9 л/час после повторного приема. Период полувыведения из плазмы составляет около 1,3 часа после повторного приема дозы 1 раз в сутки. Эзомепразол полностью выводится из плазмы между приемами доз без тенденции к кумуляции при приеме препарата 1 раз в сутки.

Основные метаболиты эзомепразола не влияют на секрецию желудочного сока. Около 80% пероральной дозы эзомепразола выводится в форме метаболитов, другие - кишечником. Менее 1% начальной лекарственного вещества оказывается в моче.

Особые группы пациентов

Медленные метаболитаторы

Примерно $2,9 \pm 1,5\%$ популяции пациентов имеют недостаточность фермента 2C19 (их называют медленными метаболитаторами). У этих лиц метаболизм эзомепразола в основном осуществляется CYP3A4. После повторного приема 1 раз в сутки 40 мг эзомепразола среднее значение площади, ограниченной кривой зависимости концентрации в плазме крови от времени, в слабых метаболитаторов примерно на 100% выше, чем у лиц с нормальным функционированием фермента 2C19 (быстрых метаболитаторов). Максимальная концентрация в плазме крови увеличивается примерно на 60%. Эти результаты не имеют никакого влияния на дозировку эзомепразола.

Пациенты с нарушением функции печени

Метаболизм эзомепразола у пациентов со слабой и умеренной дисфункцией печени может быть нарушено. Скорость метаболизма снижается у пациентов с тяжелым нарушением функции печени, что приводит к увеличению площади, ограниченной кривой зависимости концентрации в плазме крови от времени в 2 раза. Таким образом, максимальная доза для пациентов с серьезным нарушением функции печени составляет 20 мг. Эзомепразол и его метаболиты не имеют тенденции к кумуляции во время приема препарата 1 раз в сутки.

Пациенты с нарушением функции почек

Исследований при участии данной категории пациентов не проводили. Поскольку почки отвечают за выведение метаболитов эзомепразола, а не главной исходного соединения, изменений метаболизма у больных с нарушением функции почек не ожидается.

Пациенты пожилого возраст

Метаболизм эзомепразола не претерпит существенных изменений у пациентов пожилого возраста (от 71 до 80 лет).

Педиатрические пациенты

После многократного применения 20 мг и 40 мг эзомепразола общее влияние и время достижения максимальной концентрации препарата в плазме крови у детей 12-18 лет был таким же, как у взрослых.

Гендерные особенности

После разовой дозы эзомепразола 40 мг среднее значение площади, ограниченной кривой зависимости концентрации в плазме крови от времени, у женщин выше на 30% по сравнению с мужчинами. Никакой разницы, связанной с полом, не наблюдалось при повторном приеме препарата 1 раз в сутки. Эти результаты не влияют на дозировку эзомепразола.

Показания

Взрослые

Гастроэзофагеальная рефлюксная болезнь (ГЭРБ):

- лечение эрозивного рефлюкс-эзофагит;
- длительное лечение с излеченным эзофагитом для предотвращения рецидива;
- симптоматическое лечение гастроэзофагеальной рефлюксной болезни.

*В сочетании с соответствующими антибактериальными лекарственными средствами для эрадикации *Helicobacter pylori*:*

- лечение язвы двенадцатиперстной кишки, связанной с *Helicobacter pylori*;
- предотвращения рецидива пептических язв у пациентов с язвами, вызванными *Helicobacter pylori*.

Лечение и профилактика язв, вызванных длительным применением нестероидных противовоспалительных средств (НПВС):

- лечение язв, вызванных терапией НПВП;
- профилактика язв желудка и двенадцатиперстной кишки, обусловленных применением НПВП у пациентов, относящихся к группе риска.

Длительное лечение после внутривенного применения препарата для профилактики рецидива кровотечения из пептических язв.

Лечение синдрома Золлингера-Эллисона.

Дети старше 12 лет

Гастроэзофагеальная рефлюксная болезнь (ГЭРБ):

- лечение эрозивного рефлюкс-эзофагит;
- длительное лечение пациентов с излеченным эзофагитом для предотвращения рецидива;
- симптоматическое лечение гастроэзофагеальной рефлюксной болезни (ГЭРБ).

*В сочетании с антибиотиками при лечении язвы двенадцатиперстной кишки, обусловленной *Helicobacter pylori*.*

Противопоказания

Повышенная чувствительность к эзомепразолу, к замещенным бензимидазола или другим компонентам препарата. Одновременное применение с атазанавиром, нелфинавиром.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Влияние эзомепразола на фармакокинетику других лекарственных средств.

Варфарин

В ходе клинических исследований применения 40 мг эзомепразола пациентами, которые принимали варфарин, показало, что время коагуляции был в пределах нормы. Однако после широкого внедрения препарата в медицинскую практику было несколько сообщений о клинически значимое увеличение времени коагуляции, поэтому при одновременном применении эзомепразола и варфарина (или других кумариновой дериватів) следует контролировать показатели коагуляции.

Вориконазол

Омепразол, как и эзомепразол, действует как ингибитор CYP 2C19. Одновременное применение омепразола (40 мг 1 раз в сутки) приводило к увеличению C_{max} и AUC для вориконазола (CYP2C19 субстрата) на 15% и 41%

соответственно.

Диазепам

Одновременное применение 30 мг эзомепразола приводит к снижению клиренс CYP2C19 субстрата діазепаму на 45%.

Ингибиторы протеазы

Отмечалась взаимодействие омепразола с некоторыми ингибиторами протеазы (антиретровирусными препаратами). Клиническая значимость и механизмы таких взаимодействий не всегда известны. Повышение желудочного pH в течение применения омепразола может изменять всасывание ингибиторов протеазы. Другие механизмы взаимодействия, возможно, связаны с угнетением CYP 2C19. В случае применения некоторых антиретровирусных средств, таких как атазановир и нелфинавир, отмечалось снижение уровня последних в сыворотке крови при одновременном применении с препаратом. Поэтому одновременное применение омепразола и таких препаратов, как атазановир и нелфинавира, не рекомендуется. Применение омепразола (40 мг один раз в сутки) вместе с атазанавіром 300 мг и ритонавіром 100 мг у здоровых добровольцев приводило существенное ослабление действия атазанавіру (примерно 75% уменьшение AUC, C_{max}, C_{min}). Повышение дозы атазанавіру до 400 мг не компенсировало влияния омепразола на эффективность атазанавіру. Сообщалось о повышении уровней в плазме крови других антиретровирусных средств, таких как саквинавир. Существуют также другие антиретровирусные препараты (дарунавир, апренавир, лопинавир), уровни которых в плазме крови оставались неизменными при одновременном применении с препаратом.

Несмотря на сходство фармакодинамических эффектов и фармакокинетических свойств омепразола и эзомепразола, не рекомендуется применять эзомепразол одновременно с атазанавиром. Одновременное применение эзомепразола с нелфинавиром противопоказано.

Клопидогрел

У здоровых лиц отмечалась фармакокинетическая/фармакодинамическая взаимодействие между клопидогрелом (нагрузочная доза 300 мг/суточная поддерживающая доза 75 мг) и эзомепразолом (40 мг в сутки внутрь), что приводило к уменьшению экспозиции активного метаболита клопидогреля в среднем на 40% и уменьшение максимальной ингибирующей активности (АДФ-индуцированной) по агрегации тромбоцитов в среднем на 14%.

В исследовании с участием здоровых лиц, в котором изучали применение клопидогреля вместе с комбинацией 20 мг эзомепразола и 81 мг

ацетилсалициловой кислоты по сравнению с клопидогрелом в монорежиме, отмечали снижение экспозиции активного метаболита клопидогреля почти на 40%. Однако, максимальная ингибирующая активность (АТФ-индуцированной) по агрегации тромбоцитов у этих лиц была одинаковой в группах, где принимали клопидогрел отдельно и клопидогрел + комбинация (эзомепразол + ацетилсалициловая кислота), что, наверное, объясняется одновременным введением низкой дозы ацетилсалициловой кислоты.

Ряд обсервационных и клинических исследований по ФК/ФД взаимодействия продемонстрировали противоречивые результаты относительно того, повышается риск основных сердечно-сосудистых явлений, если пациент получает клопидогрел вместе с ИПП. Как предостережение, рекомендуется избегать одновременного применения клопидогреля.

Лекарственные средства, которые метаболизируются CYP2C19

Эзомепразол ингибирует CYP2C19 - главный фермент, который метаболизирует эзомепразол. Поэтому при применении эзомепразола в комбинации с препаратами, которые метаболизируются CYP2C19 (такими как диазепам, циталопрам, имипрамин, кломипрамин, фенитоин), концентрация этих препаратов в плазме крови может быть повышена, поэтому может быть необходимым уменьшение их дозы. Это обстоятельство следует учитывать, особенно при назначении эзомепразола «в случае необходимости».

Лекарственные средства, абсорбция которых зависит от pH

Пониженная кислотность желудочного сока при применении эзомепразола может увеличить или уменьшить абсорбцию лекарственных веществ, если их абсорбция зависит от кислотности желудочного сока.

Как и в случае с другими препаратами, уменьшающими внутрижелудочную кислотность, абсорбция таких препаратов как кетоконазол, итраконазол, а также эрлотиниб может уменьшаться, тогда как всасывание таких препаратов как дигоксин может повышаться при лечении эзомепразолом. Одновременное применение эзомепразола (20 мг в сутки) и дигоксина у здоровых лиц повышало биодоступность дигоксина на 10% (в двух из десяти человек - на 30%). О дигоксиновой токсичности сообщалось редко. Но несмотря на это, необходимо соблюдать осторожность при применении эзомепразола в высоких дозах у пациентов пожилого возраста. Следует осуществлять усиленный терапевтический лекарственный мониторинг дигоксина.

Метотрексат

Сообщалось о повышении уровня метотрексата в крови у некоторых пациентов при одновременном приеме с ингибиторами протонной помпы. В случае необходимости введения метотрексата в высоких дозах следует рассмотреть вопрос о временной отмене эзомепразола.

Такролимус

При одновременном применении эзомепразола сообщалось о повышении уровня такролимуса в плазме крови. В случае применения данной комбинации следует осуществлять мониторинг функции почек (клиренс креатинина), мониторинг уровня такролимуса в плазме крови и при необходимости произвести корректировку дозы.

Цизаприд

У здоровых добровольцев одновременное применение 40 мг эзомепразола с цизапридом приводит к увеличению площади под кривой зависимости концентрации от времени (AUC) на 32% и увеличение времени полувыведения ($t_{1/2}$) на 31%, но не происходило заметного увеличения пикового уровня цизаприда в плазме крови. Умеренно пролонгированный QT-интервал наблюдался после приема цизаприда отдельно и не увеличивался при дальнейшем применении цизаприда в комбинации с эзомепразолом.

Цилостазол

Омепразол, как и эзомепразол, действует как ингибитор CYP 2C19. Применение омепразола в дозе 40 мг здоровыми добровольцами во время исследования приводило к увеличению C_{max} и площади под кривой зависимости концентрации от времени (AUC) для цилостазола на 18% и 26% соответственно, и для одного из его активных метаболитов на 29% и 69% соответственно.

Фенитоин

Одновременное применение 40 мг эзомепразола приводит к увеличению уровня фенитоина в плазме крови на 13% у больных эпилепсией. Рекомендуется контролировать концентрацию фенитоина в плазме крови при назначении или відміні терапії эзомепразолом.

Влияние других лекарственных средств на фармакокинетику эзомепразола

Лекарственные средства, которые ингибируют CYP2C19, CYP3A4 или оба фермента

Эзомепразол метаболизируется CYP2C19 і CYP3A4. Одновременное применение эзомепразола и ингибитора CYP3A4 кларитроміцину (500 мг 2 раза в день)

приводило к увеличению экспозиции (AUC) эзомепразола вдвое.

Одновременное применение эзомепразола и комбинированного ингибитора CYP2C19 и CYP3A4 может привести к увеличению экспозиции эзомепразола более чем вдвое. Вориконазол (ингибиторы CYP2C19 и CYP3A4) приводил к повышению AUC омепразола на 280%. В таких ситуациях коррекция дозы эзомепразола не всегда нужна. Но коррекцию дозы следует проводить пациентам с тяжелой печеночной недостаточностью или в случае назначения длительного лечения.

Лекарственные средства, которые индуцируют CYP2C19, CYP3A4 или оба фермента

Препараты, которые индуцируют CYP2C19, CYP3A4 или оба ферменты (такие как рифампицин или трава зверобоя), могут приводить к снижению уровней эзомепразола в плазме крови путем ускорения его метаболизма.

Педиатрическая популяция

Исследования лекарственного взаимодействия проводили только с участием взрослых.

Особенности применения

При наличии любых тревожных симптомов (таких как, например, значительное непредвиденное снижение массы тела, периодическое рвота, дисфагия, гематемезис или молотый) и при подозрении на язву желудка или при ее наличии следует исключить злокачественное заболевание, поскольку Эзолонг может скрывать симптомы и задерживать установления диагноза.

Долгосрочное применение препарата

Пациенты, принимающие препарат в течение длительного периода (особенно пациенты, которые получают лечения более года), должны находиться под регулярным наблюдением врача.

Лечение по необходимости

Пациенты, принимающие Эзолонг в случае необходимости, должны быть проинструктированы о необходимости связаться со своим врачом при изменении характера симптомов.

*Эрадикация *Helicobacter pylori**

При назначении эзомепразола для эрадикации *Helicobacter pylori* следует учесть возможность лекарственных взаимодействий между всеми компонентами тройной терапии. Кларитромицин является мощным ингибитором CYP3A4, поэтому при назначении тройной терапии пациентам, получающим другие препараты, которые метаболизируются с участием CYP3A4 (например цизаприд), необходимо учитывать возможные противопоказания и взаимодействия кларитромицина с этими лекарственными средствами.

Желудочно-кишечные инфекции

Применение ингибиторов протонной помпы может несколько повысить риск развития желудочно-кишечных инфекций, таких как *Salmonella* и *Campylobacter* (см. Раздел «Фармакологические»).

Всасывания витамина B12

Эзомепразол, как и все лекарственные средства, которые блокируют действие соляной кислоты, может уменьшать всасывание витамина B12 (цианокобаламина) вследствие развития гипо- или ахлоргидрии. Это следует учитывать при проведении долгосрочного лечения пациентов с пониженными запасами витамина B12 в организме или пациентов с факторами риска пониженного всасывания витамина B12.

Гипомагниемия

О тяжелой формой гипомагниемии сообщали у пациентов, получавших лечение ингибиторами протонной помпы (ИПП), такими как эзомепразол, по меньшей мере в течение трех месяцев, а в большинстве случаев - в течение года. Могут наблюдаться серьезные проявления гипомагниемии, такие как усталость, тетания, делирий, судороги, головокружение и желудочковая аритмия, но эти симптомы могут начаться незаметно и их можно пропустить. В большинстве случаев состояние пациентов, у которых наблюдалась гипомагниемия, улучшалось после заместительной терапии магнием и прекращения лечения ИПП.

По пациентов, которые, как ожидается, будут находиться на длительном лечении, или по пациентам, получающих лечение ИПП совместно с дигоксином или лекарственными препаратами, которые могут привести к развитию гипомагниемии (например диуретики), медицинским работникам следует рассмотреть вопрос об определении уровней магния перед началом лечения ИПП и периодически во время терапии.

Риск возникновения переломов

Ингибиторы протонной помпы, особенно при применении в больших дозах и в течение длительного лечения (> 1 года), в определенной степени могут повышать риск перелома бедра, запястья и позвоночника, главным образом у пациентов пожилого возраста или при наличии других факторов риска. Данные, полученные в ходе наблюдательных исследований, свидетельствуют о том, что ингибиторы протонной помпы могут повышать общий риск переломов на 10-40%. Некоторые случаи такого увеличения количества переломов могут быть связаны с другими факторами риска. Пациенты с риском развития остеопороза должны получать лечение в соответствии с действующими клиническими рекомендациями и адекватное количество витамина D и кальция.

Подострый кожная красная волчанка

Применение ингибиторов протонной помпы связывают с очень редкими случаями развития подострого кожного красной волчанки. Если возникает поражение, особенно на участках, подвергающихся воздействию солнечного света, и это сопровождается артралгией, пациенту необходимо немедленно обратиться к врачу, который рассмотрит необходимость отмены препарата Эзолонг. Возникновение подострого кожного красной волчанки у пациентов во время предшествующей терапии ингибиторами протонной помпы может повысить риск его развития при применении других ингибиторов протонной помпы.

Комбинация с другими лекарственными средствами

Совместное применение эзомепразола с атазанавиром не рекомендуется (см. Раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»). Если комбинации атазанавира с ингибитором протонной помпы избежать невозможно, рекомендуется тщательно следить за пациентами в условиях стационара, а также повысить дозу атазанавира до 400 мг со 100 мг ритонавира; дозу эзомепразола 20 мг превышать не следует.

Эзомепразол является ингибитором CYP2C19. В начале или в конце лечения эзомепразолом следует рассматривать потенциально возможное взаимодействие с препаратами, которые метаболизируются CYP2C19. Взаимодействие наблюдается между клопидогрелем и эзомепразолом (см раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»).

Клиническая значимость этого взаимодействия остается неопределенной. В качестве меры пресечения одновременного применения эзомепразола и клопидогреля необходимо избегать.

Назначая эзомепразол для применения в режиме «по требованию», в связи с колебаниями концентраций эзомепразола в плазме крови следует учитывать последствия взаимодействия с другими лекарственными средствами, см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий».

Влияние на результаты лабораторных исследований

Из-за повышения уровня хромогранину А (CgA) возможное влияние на результаты лабораторных исследований по выявлению нейроэндокринных опухолей. Чтобы избежать такого воздействия, лечение эзомепразолом нужно прекратить не менее чем за 5 дней до измерения уровней CgA (см. Раздел «Фармакологические»).

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

Эзомепразол оказывает минимальное влияние на способность управлять транспортными средствами или работать с другими механизмами. Сообщалось о таких побочных реакциях как головокружение (редко) и нечеткость зрения (редко) (см. Раздел «Побочные реакции»). Если такие расстройства наблюдаются, пациентам не следует управлять транспортными средствами или работать с другими механизмами.

Применение в период беременности или кормления грудью

Период беременности.

В настоящее время нет достаточного количества данных о применении эзомепразола в период беременности. Несколько большее количество данных эпидемиологических исследований применения рацемической смеси омепразола в период беременности свидетельствует об отсутствии врожденных пороков и фетотоксического воздействия. В исследованиях эзомепразола у животных не было выявлено прямого или косвенного вредного воздействия на эмбриональное/фетальный развитие. В исследованиях рацемической смеси на животных не было выявлено прямого или опосредованного влияния на течение беременности, роды и постнатальное развитие. Следует с осторожностью назначать препарат беременным женщинам.

Умеренное количество данных о беременных женщин (от 300 до 1000 случаев беременности) указывает на отсутствие мальформативных эффектов или токсического воздействия эзомепразола на состояние плода/здоровье новорожденного ребенка.

Результаты исследований на животных свидетельствуют об отсутствии прямой или опосредованной вредного воздействия препарата на репродуктивную функцию за счет его токсического воздействия.

Период кормления грудью.

Неизвестно, эзомепразол проникает в грудное молоко. Информации о последствиях воздействия эзомепразола на новорожденных/грудных детей недостаточно. Эзомепразол не следует применять в период кормления грудью.

Фертильность.

Результаты исследований рацемической смеси омепразола на животных указывают на отсутствие влияния омепразола на фертильность в случае перорального введения препарата.

Способ применения и дозы

Взрослые

Гастроэзофагеальная рефлюксная болезнь (ГЭРБ)

- Лечение эрозивного рефлюкс-эзофагит

40 мг один раз в сутки в течение 4 недель.

Пациентам с невылеченным эзофагитом или стойкими симптомами рекомендуется дополнительно применять препарат в течение 4 недель.

- Длительное лечение пациентов с излеченным эзофагитом для предотвращения рецидива:

20 мг один раз в сутки.

- симптоматическое лечение гастроэзофагеальной рефлюксной болезни (ГЭРБ)

Доза для пациентов без эзофагита составляет 20 мг один раз в сутки. Если после 4 недель лечения контроля над симптомами достичь не удалось, пациенту следует пройти дополнительное обследование. После исчезновения симптомов для их дальнейшего контроля может быть достаточным применения 20 мг один раз в сутки. При необходимости можно перейти на прием препарата в режиме «по требованию», то есть применять препарат по 20 мг один раз в сутки. Не рекомендуется применение препарата «по необходимости» для последующего контроля за симптомами пациентам с риском развития язв желудка и двенадцатиперстной кишки, принимающих НПВП.

В сочетании с соответствующими антибактериальными лекарственными средствами для эрадикации Helicobacter pylori, а также для

- лечение язвы двенадцатиперстной кишки, вызванной Helicobacter pylori, и

- предотвращение рецидива пептических язв у пациентов с язвами, вызванными Helicobacter pylori:

20 мг Эзолонга с 1 г амоксициллина и 500 мг кларитромицина дважды в сутки в течение 7 дней.

Пациенты, требующие длительного применения нестероидных противовоспалительных препаратов (НПВП)

- Лечение язвы желудка, обусловленных применением НПВП:

обычная доза составляет 20 мг один раз в сутки. Продолжительность лечения составляет 4-8 недель.

- Профилактика язв желудка и двенадцатиперстной кишки, обусловленных применением НПВП у пациентов, относящихся к группе риска:

20 мг один раз в сутки.

Длительное лечение после внутривенного применения препарата для профилактики рецидива кровотечения из пептических язв:

40 мг один раз в сутки в течение 4 недель после внутривенного применения препарата для профилактики рецидива кровотечения из пептических язв.

Лечение синдрома Золлингера-Эллисона

Рекомендованная начальная доза Эзолонга составляет 40 мг дважды в сутки. В дальнейшем дозу корректируют индивидуально; лечение продолжается так долго, как этого требуют клинические показания. Исходя из имеющихся клинических данных, у большинства пациентов контроль состояния может быть достигнут при дозах от 80 до 160 мг эзомепразола в сутки. Если дозы превышают 80 мг в сутки, дозу следует разделить и применять дважды в сутки.

Пациенты особых групп

Пациенты с нарушением функции почек

Пациентам с нарушением функции почек коррекция дозы не требуется. Из-за ограниченности опыта применения препарата пациентам с тяжелой почечной недостаточностью при лечении таких пациентов следует соблюдать

осторожность (см. Раздел «Фармакокинетика»).

Пациенты с нарушенной печеночной функцией

Пациентам с нарушением функции печени от слабого до умеренного степени тяжести коррекция дозы не требуется. Максимальная доза Эзолонга для пациентов с нарушением функции печени тяжелой степени не должна превышать 20 мг (см. «Фармакокинетика»).

Пациенты пожилого возраста

Пациентам пожилого возраста коррекция дозы препарата не требуется.

Педиатрическая популяция

Дети в возрасте от 12 лет.

Гастроэзофагеальная рефлюксная болезнь (ГЭРБ)

- *Лечение эрозивного рефлюкс-эзофагит:*

40 мг один раз в сутки в течение 4 недель.

Пациентам с невылеченным эзофагитом или стойкими симптомами рекомендуется дополнительно применять препарат в течение 4 недель.

- *Длительное лечение пациентов с излеченным эзофагитом для предотвращения рецидива:*

20 мг один раз в сутки.

- *симптоматическое лечение гастроэзофагеальной рефлюксной болезни (ГЭРБ)*

Доза для пациентов без эзофагита составляет 20 мг один раз в сутки. Если после 4 недель лечения контроля над симптомами достичь не удалось, пациенту следует пройти дополнительное обследование. После купирования симптомов последующий контроль над ними может быть достигнут путем применения препарата в дозе 20 мг один раз в сутки.

*Лечение язвы двенадцатиперстной кишки, вызванной *Helicobacter pylori**

При выборе соответствующей комбинированной терапии следует учитывать официальные общегосударственные, региональные и местные рекомендации по бактериальной резистентности, длительности лечения (обычно 7 дней, но иногда до 14 дней) и надлежащего применения антибактериальных препаратов. Лечение должно проводиться под наблюдением специалиста.

Рекомендации по дозировке препарата:

при массе тела 30-40 кг: в комбинации с двумя антибиотиками: Эзолонг 20 мг, амоксициллин 750 мг и кларитромицин 7,5 мг/кг массы тела - все препараты применять одновременно два раза в сутки в течение одной недели;

при массе тела > 40 кг в комбинации с двумя антибиотиками: Эзолонг 20 мг, амоксициллин 1 г и кларитромицин 500 мг - все препараты применять одновременно два раза в сутки в течение недели.

Дети до 12 лет

Эзолонг не следует применять детям до 12 лет, поскольку данные по такого применения отсутствуют.

Способ применения

Таблетку следует глотать целиком, запивая жидкостью. Таблетки не следует разжевывать или измельчать.

Дети

Эзолонг не следует применять детям до 12 лет, поскольку данные по такого применения отсутствуют.

Применять детям в возрасте от 12 лет при таких показаниях:

Гастроэзофагеальная рефлюксная болезнь (ГЭРБ)

- лечение эрозивного рефлюкс-эзофагит;
- длительное лечение пациентов с излеченным эзофагитом для предотвращения рецидива;
- симптоматическое лечение гастроэзофагеальной рефлюксной болезни (ГЭРБ).

*В сочетании с антибиотиками при лечении язвы двенадцатиперстной кишки, обусловленной *Helicobacter pylori*.*

Передозировка

В настоящее время данные о преднамеренном передозировки очень ограничены. Симптомы, описанные при приеме препарата в дозе 280 мг, включали симптомы со стороны желудочно-кишечного тракта и слабость. Разовый прием эзомепразола в дозе 80 мг не вызывал никаких негативных последствий. Специфический антидот неизвестен. Эзомепразол значительным образом

связывается с белками плазмы крови, поэтому вывода с помощью диализа незначительное. Как и при любом передозировке, следует предоставить симптоматическое и общее поддерживающее лечение.

Побочные реакции

Резюме профиля безопасности

Среди побочных эффектов, которые часто возникают в ходе проведения клинических исследований (а также в период послерегистрационного применения эзомепразола), отмечаются головная боль, боль в животе, диарея и тошнота. Кроме того, профиль безопасности применения эзомепразола является одинаковым для различных лекарственных форм препарата, показаний для назначения лечения, возрастных групп и популяций пациентов. Дозозависимых нежелательных реакций выявлено не было. Нежелательные явления классифицировали в зависимости от частоты возникновения: часто ($> 1/100$, $< 1/10$); нечасто ($> 1/1000$, $< 1/100$) редко ($> 1/10000$, $< 1/1000$) и очень редко ($< 1/10000$).

Со стороны крови и лимфатической системы:

редко лейкопения, тромбоцитопения

очень редко агрунолоцитоз, панцитопения.

Со стороны иммунной системы:

редко реакции гиперчувствительности, включая лихорадку, ангионевротический отек, анафилактические реакции/шок.

Со стороны обмена веществ:

нечасто периферические отеки

редко гипонатриемия

частота неизвестна: гипомагниемия; тяжелая гипомагниемия может привести к гипокальциемии.

Нарушение психики:

нечасто: бессонница;

редко: возбуждение, депрессия, спутанность сознания;

очень редко агрессия, галлюцинации.

Со стороны нервной системы:

часто: головная боль

нечасто: головокружение, слабость, парестезии, сонливость

редко: нарушение вкуса.

Со стороны органов зрения:

редко нечеткость зрения.

Со стороны органов слуха и лабиринтные нарушения:

нечасто вертиго.

Со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения:

редко бронхоспазм.

Со стороны пищеварительного тракта:

часто: боль в животе, запоры, диарея, вздутие живота, тошнота, рвота, железистые полипы дна желудка (доброкачественные)

нечасто: сухость во рту

редко стоматит, кандидоз желудочно-кишечного тракта

очень редко микроскопический колит.

Со стороны пищеварительной системы:

нечасто: повышение уровня печеночных ферментов

редко гепатит с или без желтухи;

очень редко печеночные реакции, включая печеночную недостаточность, энцефалопатия у пациентов с уже имеющимися заболеваниями печени.

Со стороны кожи и подкожных тканей:

нечасто дерматит, зуд, крапивница, сыпь,

редко алоpecia, фотосенсибилизация;

очень редко мультиформная эритема, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз.

частота неизвестна: подострый кожная красная волчанка (см. раздел «Особенности применения»).

Со стороны костно-мышечной и соединительной ткани:

нечасто: перелом бедра, запястья или позвоночника (см. раздел «Особенности применения»);

редко: артралгия, миалгия

очень редко мышечная слабость.

Со стороны почек и мочевыделительной системы:

очень редко интерстициальный нефрит (у некоторых пациентов - одновременно с почечной недостаточностью).

Со стороны репродуктивной системы и молочных желез:

очень редко гинекомастия.

Общие расстройства и нарушения в месте введения:

редко недомогание, повышенная потливость.

Срок годности

15 месяцев.

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 7 таблеток в алюминиевом блистере, по 2 блистера в картонной коробке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

Евертоджен Лайф Саенсиз Лимитед/Evertogen Life Sciences Limited.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Плот №: Эс-8, Эс-9, Эс-13/Пи и Эс-14/Пи Те Ес Ай Ай Си, Фарма Эс И Зет, Грин Индастриал Парк Полепалли (Ви), Едчерла (Эм), Махабубнагар, Телангана , ИН-509301, Индия /

Plot No: S-8, S-9, S-13/P & S-14/P TSIIC, Pharma SEZ, Green Industrial Park, Polepally (V), Jadcherla (M), Mahabubnagar, Telangana, IN-509301, India.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).