

# РАБЕМАКС

## Инструкция

### по медицинскому применению лекарственного средства

**Торговое название:** Рабемакс.

**Международное непатентованное название:** Рабепразол.

**Лекарственная форма:** Лиофилизированный порошок для приготовления раствора для инъекций.

**Состав:** Каждый флакон содержит:

Рабепразол натрия 20 мг;

Вспомогательные вещества q.s.

**Фармако-терапевтическая группа:** ИПП (Ингибитор протонной помпы).

**Код АТХ:** A02BC04.

**Фармакологическое действие:**

*Фармакодинамика:*

Угнетение активности фермента Н<sup>+</sup>/К<sup>+</sup>-АТФ-азы в париетальных клетках желудка приводит к ингибированию конечной стадии образования соляной кислоты. Это действие является дозозависимым и приводит к угнетению как базальной, так и стимулированной секреции соляной кислоты независимо от раздражителя. **Рабемакс** связывается с протонной помпой париетальных клеток с помощью ковалентной связи, что сопровождается необратимым снижением секреции кислоты. Кислота может выделяться только новообразовавшимися протонными помпами. Таким образом, кинетика рабепразола в плазме крови не имеет решающего значения для антисекреторного действия: период биологической активности рабепразола значительно превышает период его полувыведения из плазмы крови. Большое клиническое значение имеет полупериод функционирования протонной помпы (20–24 ч), а не период полувыведения рабепразола. Максимальный уровень снижения секреции можно получить в случае, когда рабепразол достигает париетальной клетки в момент ее активации. Этого можно достигнуть внутривенным инфузионным введением рабепразола. Благодаря этому активизированная под влиянием циркадных ритмов (ацетилхолин) или после еды (гистамин и гастрин) протонная помпа сразу же связывается с молекулой рабепразола и продукция соляной кислоты прекращается. Активное вещество препарата - рабепразол - быстро скапливается в кислой среде париетальных клеток желудка, где превращается в активную форму благодаря присоединению к ней сульфонамидной группы. Взаимодействует с цистеинами протонной помпы.

*Фармакокинетика:*

После внутривенного введения действие рабепразола развивается на протяжении 1 ч и достигает максимума через 2–4 ч. Средний клиренс при внутривенном введении дозы 20 мг составляет 283±98 мл/мин. Период полувыведения дозы 20 мг, введенной внутривенно, — 1,02±0,63 ч. После отмены препарата секреторная активность восстанавливается через 2–3 дня. Применение препарата в дозе 20 мг в сутки на протяжении 2 недель не влияет на функцию щитовидной железы, метаболизм углеводов, концентрацию в крови паратгормона, кортизола, эстрогена, тестостерона, пролактина, холецистокинина, секретина, глюкагона, ФСГ, ЛГ, СТГ, ренина, альдостерона. Абсолютная биодоступность при внутривенном введении дозы 20 мг составляет около 100%, то есть все молекулы рабепразола достигают париетальных клеток. Биодоступность рабепразола не изменяется при многократном введении. Связывание с белками плазмы крови составляет 97%. При многократном введении рабепразола отмечена линейная фармакокинетика, то есть период полувыведения, клиренс и объем распределения рабепразола не зависят от дозы. Метаболизируется в печени. Рабепразол натрия биотрансформируется с образованием основных метаболитов тиоэфира и угольной кислоты. Другие метаболиты — сильфон, диметилтиоэфир и конъюгат меркаптуровой кислоты присутствуют в низких концентрациях. Период полувыведения составляет около 1 ч. Около 90% дозы выводится с мочой преимущественно в виде двух метаболитов: конъюгата меркаптопуровой и карбоновой кислоты. Небольшая часть метаболитов выводится с калом. У пациентов пожилого возраста выведение рабепразола несколько замедляется. Кумуляции рабепразола не отмечалось.

**Показания к применению:** Рабемакс в виде раствора назначается в тех случаях, когда назначение пероральной формы препарата невозможно, а именно:

- обострение пептической язвы желудка или двенадцатиперстной кишки с кровотечением и тяжелыми эрозиями;
- кратковременное лечение гастроэзофагеальной рефлюксной болезни с эрозиями и язвами;

- профилактика аспирации кислым содержимым желудка;
- синдром Золлингера — Эллисона.

#### **Противопоказания:**

- повышенная индивидуальная чувствительность;
- печеночная, почечная или дыхательная недостаточность;
- беременность и период лактации;
- детский возраст до 18 лет.

**Способ применения и дозы:** Внутривенное назначение препарата **Рабемакс** рекомендовано лишь в тех случаях, когда пероральное введение невозможно. Как только становится возможным назначение пероральной формы рабепразола, внутривенное применение следует отменить. Рекомендованная доза составляет 20 мг - 1 раз в сутки. Приготовленный раствор следует вводить только внутривенно. Для введения в виде инъекции содержимое флакона растворяют в 5 мл стерильной воды для инъекций и вводят медленно на протяжении 5–15 минут. Для введения в виде инфузии содержимое флакона сначала растворяют в 5 мл стерильной воды для инъекций, добавляют к инфузионному раствору (0,9% раствор натрия хлорида) объемом 100 мл и вводят на протяжении 15–30 мин. Готовый к применению раствор должен быть использован в течение 4 ч после приготовления. Перед применением раствор необходимо проверить на наличие осадка, изменения цвета или любых других изменений. Раствор должен быть прозрачным и бесцветным, без видимых включений. Неиспользованный раствор следует утилизировать.

#### **Побочное действие:**

*Со стороны органов ЖКТ:* диарея, тошнота; менее часто — рвота, боль в животе, метеоризм, запор; редко — сухость во рту, отрыжка, диспепсия; в единичных случаях — нарушение вкусовых ощущений, анорексия, стоматит, гастрит, повышение активности трансаминаз.

*Со стороны нервной системы и органов чувств:* головная боль; менее часто — головокружение, астения, бессонница; очень редко — нервозность, сонливость; в отдельных случаях — депрессия, нарушения зрения.

*Со стороны опорно-двигательного аппарата:* редко — миалгия; очень редко — артралгия, судороги икроножных мышц.

*Со стороны респираторной системы:* редко — воспаление или инфекция верхних дыхательных путей, сильный кашель; очень редко — синусит, бронхит.

*Аллергические реакции:* редко — сыпь, кожный зуд.

*Прочие:* редко — боль в спине, груди, конечностях, отеки, инфекция мочевыводящих путей, лихорадка, озноб, гриппоподобный синдром; в единичных случаях — повышенная потливость, увеличение массы тела, лейкоцитоз.

#### **Передозировка:**

Нет сведений относительно передозировки препаратом, возможно увеличение выраженности побочных реакций.

*Лечение:* при применении препарата в высоких дозах проводят симптоматическую терапию. Специфического антидота нет. Рабепразол натрия хорошо связывается с белками плазмы крови, поэтому плохо выводится при диализе.

#### **Лекарственное взаимодействие:**

Натрия рабепразол, как и другие ингибиторы протонной помпы (ИПП), метаболизируется ферментами, которые входят в печеночную систему цитохрома P450(CYP450). Рабепразол натрия не вступает в клинически значимые взаимодействия с амоксициллином и другими лекарственными средствами, которые метаболизируются ферментами системы CYP450, такими как варфарин, фенитоин, теофиллин и диазепам. Натрия рабепразол вызывает сильное и продолжительное снижение выработки соляной кислоты. Таким образом, натрия рабепразол, в принципе, может взаимодействовать с препаратами, абсорбция которых зависит от показателя pH желудочного содержимого: снижение концентрации кетоконазола на 33% в плазме крови и повышение минимальной концентрации дигоксина на 22%. Таким образом, отдельные пациенты, которые применяют указанные препараты одновременно с рабепразолом, должны находиться под наблюдением для определения необходимости корректирования дозы. Концентрация рабепразола и активного метаболита кларитромицина в плазме крови при одновременном применении увеличивается на 24 и 50% соответственно. Это рассматривается как положительный результат взаимодействия при эрадикации *H. pylori*. Исследования *in vitro* на микросомах печени человека показали, что натрия рабепразол метаболизируется изоферментами системы CYP450 (CYP2C9 и CYP3A). Эти исследования дают возможность считать, что рабепразол обладает низкой способностью к лекарственному

взаимодействию; при этом его влияние на метаболизм циклоспорина аналогичен другим ингибиторам протонной помпы. Несовместимость: Рабепразол можно растворять только в стерильной воде для инъекций или в физиологическом растворе (0,9 % раствор натрия хлорида). Нельзя использовать никакие другие растворы вместе с рабепразолом для инъекций.

**Особые указания:** Перед началом лечения необходимо исключить злокачественные новообразования желудка, поскольку лечение может замаскировать симптоматику и отсрочить правильную диагностику. С осторожностью назначают больным с тяжелыми нарушениями функции печени и почек. В случае появления сонливости следует отказаться от управления автомобилем и других видов деятельности, требующих повышенной концентрации внимания.

**Форма выпуска:**

Лиофилизированный порошок для приготовления раствора для инъекций во флаконе. Один флакон вместе с инструкцией по применению в картонной упаковке.

**Условия хранения:**

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

**Срок хранения:**

Указано в упаковке.

Не использовать по истечении срока годности.

**Условия отпуска:**

По рецепту врача.

**Произведено для:**

**MAXX-PHARM LTD.**

**Лондон, Великобритания**

