

ИНСТРУКЦИЯ
по применению лекарственного препарата
САЙТОТЕК

Торговое название препарата:

Сайтотек

Международное непатентованное название:

Мизопростол

Лекарственная форма:

Таблетки

Состав:

Активное вещество: мизопростол 200 мкг.

Вспомогательные вещества: микрокристаллическая целлюлоза, гипромеллоза, натрия крахмала гликолат, гидрогенизированное касторовое масло.

Описание:

Белые или почти белые таблетки в форме шестигранника с насечкой с обеих сторон и гравировкой «SEARLE 1461» на одной стороне для перорального приема.

Каждая таблетка содержит 200 мкг мизопростола.

Фармакодинамика

Сайтотек является аналогом простагландина E₁, который способствует заживлению пептических язв и ослаблению симптомов.

Сайтотек защищает слизистую желудка и двенадцатиперстной кишки, ингибируя базальную, стимулированную и ночную секрецию кислоты, а также снижая объем желудочной секреции, протеолитической активности желудочного сока и повышая секрецию бикарбонатов и слизи.

Фармакокинетика

Сайтотек быстро всасывается при пероральном приеме с достижением максимальных концентраций активного метаболита в плазме крови (мизопростоловой кислоты) приблизительно через 30 минут. Период полувыведения мизопростоловой кислоты из плазмы крови составляет 20–40 минут. Накопления мизопростоловой кислоты в плазме крови после многократного приема препарата в дозе 400 мкг два раза в сутки не наблюдается.

Показания к применению

- при одновременном приеме с нестероидными противовоспалительными средствами (НПВС): для лечения и профилактики язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки, геморрагических повреждений и эрозий вызванных применением НПВС
- для лечения язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки
- для лечения эрозивного гастродуоденита ассоциированного с пептической язвенной болезнью

Способ применения и дозы

Для профилактики НПВС-индуцированной пептической язвы:

Рекомендованная дневная доза составляет 400 – 800 мкг в сутки разделенных на 2-4 приема. Лечение можно продолжать по мере необходимости. Дозу препарата следует подбирать индивидуально в зависимости от клинического состояния каждого пациента.

Для лечения и профилактики язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки, в том числе индуцированных приемом НПВС; для лечения эрозивных гастритов ассоциированного с пептической язвенной болезнью:

Рекомендованная в доза 800 мкг в сутки разделенных на 2-4 приема, вместе с приемом пищи и перед сном.

Лечение следует проводить сначала в течение, по крайней мере, 4 недель, даже если ослабление симптомов будет достигнуто быстрее. У большинства пациентов язвы излечатся через 4 недели, но лечение может продолжаться до 8 недель при наличии такой необходимости. В случае рецидива язвы могут проводиться дополнительные курсы лечения.

Применение у пациентов пожилого возраста:

Коррекция дозы не требуется.

Применение у пациентов с нарушением функции почек:

Полученные данные свидетельствуют, что коррекции дозы препарата у пациентов с нарушением функции почек не требуется.

Применение у пациентов с нарушением функции печени:

Сайтотек метаболизируется системами окисления жирных кислот, функционирующими в органах по всему организму. В связи с этим, маловероятно, чтобы метаболизм препарата и его уровни в плазме крови подвергались значительному изменению у пациентов с нарушением функции печени.

Применение у детей:

Достоверные данные по эффективности и безопасности применения Сайтотека у детей до 18 лет отсутствуют.

Противопоказания

- у беременных женщин, или у женщин, беременность которых не была исключена, или у женщин, которые планируют беременность, поскольку мизопростол повышает маточный тонус и сокращения матки при беременности, что может вызвать частичное или полное изгнание продукта оплодотворения. Применение препарата во время беременности сопровождалось возникновением врожденных пороков развития.
- У пациентов с известной гиперчувствительностью к мизопростолу или к любому другому компоненту препарата, или к другим простагландинам.

Особые указания

Женщины детородного возраста не должны начинать терапию мизопростолом, если беременность не исключена и должны быть полностью проинформированы о необходимости применения контрацептивных средств во время лечения. При подозрении на беременность прием препарата следует прекратить.

У пациентов, получавших мизопростол одновременно с НПВС, развивались кровотечения, язвы и прободение ЖКТ. Врачи и пациенты должны помнить о возможности образования язвы, даже при отсутствии симптомов со стороны желудочно-кишечного тракта, и, если необходимо, следует пройти эндоскопическое обследование и биопсию перед применением препарата, чтобы убедиться в отсутствии злокачественного опухолевого заболевания в верхних отделах желудочно-кишечного тракта. Эти обследования и любые другие, которые считались необходимыми врачом-клиницистом,

следует повторно проводить через соответствующие промежутки времени в целях последующего наблюдения.

Симптоматические ответы на мизопростол не исключают наличия злокачественных новообразований желудка.

Мизопростол следует применять с осторожностью у пациентов с заболеваниями, предрасполагающими к диарее, такими как воспалительное заболевание кишечника. Для сведения к минимуму риска возникновения диареи мизопростол следует принимать в разовых дозах, не превышающих 200 мкг вместе с пищей, а также следует избегать содержащих магний антацидов.

Мизопростол следует применять с осторожностью у пациентов, у которых обезвоживание может быть опасным. Эти пациенты должны находиться под тщательным наблюдением.

Результаты клинических исследований свидетельствуют, что Сайтотек не вызывает артериальной гипотензии в дозах, способствующих эффективному заживлению язв желудка и двенадцатиперстной кишки. Тем не менее, Сайтотек следует применять с осторожностью при заболеваниях, при которых артериальная гипотензия может вызвать серьезные осложнения, например, нарушение мозгового кровообращения, ишемическую болезнь сердца или тяжелое заболевание периферических артерий, в том числе артериальную гипертензию.

Доказательства того, что Сайтотек имеет нежелательные эффекты на метаболизм глюкозы у добровольцев или пациентов с сахарным диабетом, отсутствуют.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

Одновременное применение НПВС и мизопростола в редких случаях может вызывать повышения уровня трансаминаз и периферический отек.

В обширных клинических исследованиях лекарственных взаимодействий, связанных с применением Сайтотека, зарегистрировано не было. Исследования лекарственных взаимодействий при одновременном приеме мизопростола и нескольких НПВС не показали клинически значимого влияния на фармакокинетику ибупрофена, диклофенака, пироксикама, аспирина, напроксена и индометацина.

Во время лечения мизопростолом следует избегать применения содержащих магний антацидов, поскольку это может усугубить индуцируемую применением мизопростола диарею.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Мизопростол противопоказан беременным женщинам, поскольку он вызывает сокращение матки и способен вызывать аборт, преждевременные роды, гибель плода и врожденные пороки развития. Воздействие мизопростола в течение первого триместра беременности сопровождается значительным повышением риска возникновения двух врожденных пороков развития: последовательность Мебиуса (т. е. паралич VI и VII черепно-мозговых нервов) и терминальные аксиальные дефекты конечностей. Наблюдались и другие дефекты, в том числе артрогрипоз.

Риск разрыва матки возрастает с увеличением гестационного возраста плода и при наличии в анамнезе предыдущей хирургической операции на матке, в том числе кесарева сечения. Многоплодность также, по-видимому, является фактором риска возникновения разрыва матки.

Мизопростол быстро метаболизируется в организме матери до мизопростоловой кислоты, которая является биологически активной и проникает в грудное молоко. Мизопростол не следует принимать кормящим грудью матерям, поскольку

проникновение мизопростоловой кислоты в молоко может вызывать у младенцев, находящихся на грудном вскармливании, нежелательные эффекты, такие как диарея.

Влияние на способность управления транспортом и работу с механизмами

Сайтотек может вызывать головокружение, поэтому, пациентов следует предупредить о необходимости соблюдения осторожности при управлении автотранспортными средствами и работе с механизмами.

Нежелательные побочные эффекты

Частота реакций распределена в соответствии с классификацией ВОЗ: очень частые ($\geq 10\%$), частые ($\geq 1\%$ и $< 10\%$), нечастые ($\geq 0,1\%$ и $< 1\%$), редкие ($\geq 0,01\%$ и $< 0,1\%$), очень редкие ($< 0,01\%$), неизвестно – невозможно определить частоту на основании имеющихся данных.

Нарушения со стороны иммунной системы: неизвестно - анафилактическая реакция.

Нарушения со стороны нервной системы: частые - головокружение, головная боль.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: очень частые - диарея; частые - боль в животе, запор, диспепсия, метеоризм, тошнота, рвота.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: очень частые - сыпь.

Беременность, послеродовые и перинатальные состояния: неизвестно – амниотическая эмболия, избыточное сокращение маточной мускулатуры, гибель эмбриона, неполный выкидыш, преждевременные роды, неотхождение плаценты, разрыв матки, перфорация матки.

Нарушения со стороны половых органов и молочной железы: нечастые - вагинальное кровотечение (в том числе у женщин в постменопаузе), межменструальное кровотечение, нарушение менструального цикла, спазмы маточной мускулатуры; редкие - меноррагия, дисменорея; неизвестно - маточное кровотечение.

Врожденные, наследственные и генетические нарушения: неизвестно - врожденные пороки развития.

Общие расстройства и нарушения в месте введения: нечасто – лихорадка; неизвестно – озноб.

Диарея и боль в животе были зависимыми от дозы, обычно возникали в начале лечения и проходили без лечения. Были зарегистрированы редкие случаи тяжелой диареи, приводящей к сильному обезвоживанию организма.

Характер нежелательных явлений, связанных с применением Сайтотека, аналогичен таковому при одновременном применении НПВС

В клинических исследованиях более 15 000 пациентов получили, по крайней мере, одну дозу мизопростола. Нежелательные реакции наблюдались преимущественно со стороны желудочно-кишечного тракта.

Профиль нежелательных реакций с частотой $> 1\%$ был аналогичным в подострых (продолжительностью от 4 до 12 недель) и долгосрочных (до 1 года) клинических исследованиях.

Безопасность долгосрочного (более 12 недель) применения мизопростола была показана в нескольких исследованиях, в которых пациенты получали лечение препаратами непрерывно в течение периода до одного года. Это включает отсутствие нежелательных или необычных изменений морфологии слизистой оболочки желудка, которые определялись с помощью желудочной биопсии.

Передозировка

Токсическая доза мизопростола у человека не определялась. В клинических исследованиях пациенты переносили препарат в дозе 1200 мкг/сут. в течение 3 месяцев без существенных нежелательных эффектов.

К клиническим признакам, которые могут свидетельствовать о передозировке, относятся седативный эффект, тремор, судороги, одышка, боль в животе, диарея, повышение температуры, ощущение сердцебиения, артериальная гипотензия и брадикардия.

Лечени: так как мизопростол метаболизируется подобно жирным кислотам, диализ не является эффективным методом лечения при передозировке. В случае передозировки рекомендуется проводить симптоматическое лечение.

Условия отпуска из аптек

Отпускается по рецепту врача.

Условия хранения

Хранить в сухом месте при температуре не выше 30 °С.

Срок годности

3 года

Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Упаковка

Блистеры по 28 и 60 таблеток.

Производитель

Пирамал Хелскейр ОК Лтд.

Уолтон Роуд, Морпет, Нортумберлэнд, NE61 3YA, Объединенное Королевство

Держатель регистрационного сертификата

«Пфайзер Эйч. Си. Пи. Корпорэйшн», 235, ул. Восток 42, 10017 Нью Йорк, США