

УТВЕРЖДАЮ

И.О. Руководитель Департамента
государственного контроля
лекарственных средств, изделий
медицинского назначения и
медицинской техники МЗ РФ

«29» 07 2004 г. А.А. Толочков

ОДОБРЕНО

Фармакологическим комитетом МЗ РФ

«29» 07 2004 г.

Протокол № 76

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению препарата АЦИЛОК

Регистрационный номер

Торговое название: Ацилок

Международное непатентованное название: ранитидин

Химическое рациональное название: N-[2-[[[5-(диметиламино)метил]-2-фуранил]метил]тио]этил]-N'-метил-2-нитро-1,1-этендиамин (в виде гидрохлорида).

Лекарственная форма: таблетки, покрытые оболочкой; раствор для внутривенного и внутримышечного введения

СОСТАВ

Каждая таблетка содержит: активного вещества 150 мг или 300 мг ранитидина (в виде гидрохлорида).

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, кальция дигидрофосфат, кальция стеарат, натрия дигидрофосфат, краскармеллоза натрия, кремния диоксид коллоидный, краситель Опадрай ОУС 51004 (зеленый).

В каждой ампуле содержится активного вещества 50 мг ранитидина (в виде гидрохлорида).

Вспомогательные вещества: фенол, калия дигидрофосфат, динатрия гидрофосфат дигидрат, уголь древесный.

Описание

Таблетки 150 мг: круглые, двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой зеленого цвета.

Таблетки 300 мг: капсуловидной формы, двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой зеленого цвета.

Раствор: прозрачный бесцветный или с желтоватым оттенком раствор, не содержащий частиц и волокон.

Фармакотерапевтическая группа: H₂-гистаминовых рецепторов блокатор

Код АТХ: A02BA02

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

Фармакодинамика. Ранитидин блокирует гистаминовые H₂-рецепторы париетальных клеток слизистой оболочки желудка, снижает базальную и стимулированную секрецию соляной кислоты, вызванную раздражением барорецепторов, пищевой нагрузкой, действием гормонов и биогенных стимуляторов (гастрин, гистамин, пентагастрин). Ранитидин уменьшает объем желудочного сока и содержание соляной кислоты в нем, повышает рН содержимого желудка, что приводит к снижению активности пепсина. После перорального приема в терапевтических дозах не влияет на уровень пролактина. Ингибирует микросомальные ферменты.

Продолжительность действия после однократного приема до 12 часов.

Фармакокинетика. Быстро всасывается, прием пищи не влияет на степень абсорбции. При приеме внутрь биодоступность ранитидина составляет примерно 50%. Максимальные концентрации в плазме достигаются через 2-3 часа после приема. Связь с белками плазмы не превышает 15%. Незначительно метаболизируется в печени с образованием десметилранитидина и S-окиси ранитидина. Обладает эффектом «первого прохождения»

через печень. Скорость и степень элиминации мало зависят от состояния печени. Период полувыведения после приема внутрь – 2,5 часа, при клиренсе креатинина 20-30 мл/мин – 8-9 часов. Выводится в основном с мочой (60-70%, в неизменном виде – 35%), незначительное количество – с калом.

При внутривенном введении 93 % дозы выводится с мочой, причем 70 % ранитидина выводится в неизменном виде.

Плохо проникает через гематоэнцефалический барьер. Проникает через плаценту. Выделяется с грудным молоком (концентрация в грудном молоке у женщин в период лактации выше, чем в плазме).

ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ

Таблетки

Лечение и профилактика обострений язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки; язвы желудка и 12-перстной кишки, связанные с приемом нестероидных противовоспалительных препаратов (НПВП); рефлюкс-эзофагит, эрозивный эзофагит, синдром Золлингера-Эллисона; лечение и профилактика послеоперационных, «стрессовых» язв верхних отделов желудочно-кишечного тракта; профилактика рецидивов кровотечений из верхних отделов желудочно-кишечного тракта; профилактика аспирации желудочного сока при операциях под общей анестезией (синдром Мендельсона).

Раствор для внутривенного и внутримышечного введения

Профилактика кровотечений при «стрессовых язвах» и рецидивирующих кровотечениях у пациентов с язвенной болезнью желудка и двенадцатиперстной кишки; профилактика развития синдрома Мендельсона.

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

Повышенная чувствительность к ранитидину или другим компонентам препарата. Беременность, лактация. Детский возраст до 12 лет.

С осторожностью – почечная и/или печеночная недостаточность, цирроз печени с портосистемной энцефалопатией в анамнезе, острая порфирия (в т. ч. в анамнезе).

СПОСОБ ПРИМЕНЕНИЯ И ДОЗЫ

Таблетки

Принимают независимо от приема пищи, не разжевывая, запивая небольшим количеством жидкости.

Взрослые и дети старше 12 лет:

Язвенная болезнь желудка и 12-перстной кишки. Для лечения обострений назначают по 150 мг 2 раза в сутки (утром и вечером) или 300 мг на ночь. При необходимости – по 300 мг 2 раза в сутки. Продолжительность курса лечения – 4-8 недель. Для профилактики обострений назначают по 150 мг на ночь, курящим пациентам – 300 мг на ночь.

Язвы, связанные с приемом НПВП. Назначают по 150 мг 2 раза в сутки или 300 мг на ночь в течение 8-12 недель. Профилактика образования язв при приеме НПВП – по 150 мг 2 раза в сутки.

Послеоперационные и «стрессовые» язвы. Назначают по 150 мг 2 раза в сутки в течение 4-8 недель.

Эрозивный рефлюкс-эзофагит. Назначают по 150 мг 2 раза в сутки или 300 мг на ночь. При необходимости доза может быть увеличена до 150 мг 4 раза в сутки. Курс лечения 8-12 недель. Длительная профилактическая терапия – 150 мг 2 раза в сутки.

Синдром Золлингера-Эллисона. Начальная доза составляет 150 мг 3 раза в сутки, при необходимости доза может быть увеличена. Длительность лечения – по мере необходимости.

Профилактика рецидивирующих кровотечений. По 150 мг 2 раза в сутки. Длительность лечения – по мере необходимости.

Профилактика развития синдрома Мендельсона. Назначают в дозе 150 мг за 2 часа до наркоза, а также, желателно 150 мг накануне вечером.

При наличии сопутствующего нарушения функции печени может потребоваться снижение дозы.

Для больных с почечной недостаточностью при клиренсе креатинина менее 50 мл/мин рекомендуемая доза составляет 150 мг в сутки.

Раствор для внутривенного и внутримышечного введения

Профилактика кровотечений при «стрессовых язвах» и рецидивирующих кровотечениях у пациентов с язвенной болезнью желудка и двенадцатиперстной кишки.

Внутримышечные инъекции: 50 мг (2 мл) каждые 6-8 часов.

Внутривенные инъекции: 50 мг (2 мл) каждые 6-8 часов. Содержимое ампулы (50 мг) разводится 0,9% раствором хлорида натрия или декстрозой для инъекций до получения общего объема 20 мл и медленно вводится в течение 5 минут. Препарат назначают парентерально до тех пор, пока невозможен пероральный прием.

Профилактика развития синдрома Мендельсона. 50 мг внутримышечно или внутривенно за 45-60 минут до общей анестезии.

Для больных с почечной недостаточностью при клиренсе креатинина менее 50 мл/мин рекомендуемая разовая доза составляет 25 мг.

ПОБОЧНЫЕ ЭФФЕКТЫ

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, сухость во рту, запор, рвота, диарея, абдоминальные боли, повышение активности «печеночных» трансаминаз, гепатоцеллюлярный, холестатический или смешанный гепатит, острый панкреатит.

Со стороны органов кроветворения: лейкопения, тромбоцитопения, агранулоцитоз, панцитопения, гипо- и аплазия костного мозга, иммунная гемолитическая анемия.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: снижение артериального давления, брадикардия, аритмия, атрио-вентрикулярная блокада, асистолия (при парентеральном введении).

Со стороны нервной системы: повышенная утомляемость, сонливость, головная боль, головокружение, спутанность сознания, шум в ушах, раздражительность, галлюцинации (в основном у пожилых пациентов и тяжелых больных), непроизвольные движения.

Со стороны органов чувств: нечеткость зрительного восприятия, парез аккомодации.

Со стороны опорно-двигательного аппарата: артралгия, миалгия.

Со стороны эндокринной системы: гиперпролактинемия, гинекомастия, аменорея, снижение либидо, импотенция.

Аллергические реакции: крапивница, кожная сыпь, ангионевротический отек, анафилактический шок, бронхоспазм, мультиформная экссудативная эритема.

Прочие: алоpecia, гиперкреатининемия, повышение активности глутаматтранспептидазы, острая порфирия.

ПЕРЕДОЗИРОВКА

Симптомы: судороги, брадикардия, желудочковые аритмии.

Лечение: симптоматическое. При развитии судорог – диазепам внутривенно, при брадикардии или желудочковых аритмиях – атропин, лидокаин. Гемодиализ – эффективен.

ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ

Курение табака снижает эффективность ранитидина.

Увеличивает концентрацию метопролола в сыворотке крови на 50%, при этом период полувыведения метопролола увеличивается с 4,4 до 6,5 ч.

Вследствие повышения pH содержимого желудка при одновременном приеме может уменьшиться всасывание итраконазола и кетоконазола.

Угнетает метаболизм в печени феназона, аминофеназона, диазепамы, гексобарбитала, пропранолола, диазепамы, лидокаина, фенитоина, теофиллина, аминофиллина, непрямых антикоагулянтов, глипизиды, буформина, метронидазола, антагонистов кальция.

Лекарственные средства, угнетающие костный мозг, увеличивают риск нейтропении.

При одновременном применении с антацидами, сукральфатом в высоких дозах возможно замедление абсорбции ранитидина, поэтому перерыв между приемом этих препаратов должен быть не менее 2 часов.

ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ

Лечение ранитидином может маскировать симптомы, связанные с карциномой желудка, поэтому перед началом лечения необходимо исключить наличие рака-язвы.

Ранитидин нежелательно резко отменять (синдром «рикошета»).

При длительном лечении ослабленных больных в условиях стресса возможны бактериальные поражения желудка с последующим распространением инфекции.

Безопасность и эффективность ранитидина у детей до 12 лет не установлены.

В период лечения необходимо воздерживаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Блокаторы H_2 -гистаминорецепторов следует принимать через 2 часа после приема итраконазола или кетоконазола во избежание значительного уменьшения их всасывания.

Прием ранитидина может быть причиной ложноположительной реакции на проведение пробы на белок в моче.

Блокаторы H_2 -гистаминорецепторов могут противодействовать влиянию пентагастрина и гистамина на кислотообразующую функцию желудка, поэтому в течение 24 часов, предшествующему тесту, применять блокаторы H_2 -гистаминорецепторов не рекомендуется.

Блокаторы H_2 -гистаминорецепторов могут подавлять кожную реакцию на гистамин, приводя таким образом к ложноположительным результатам (перед проведением диагностических кожных проб для выявления аллергической кожной реакции немедленного типа использование блокаторов H_2 -гистамино-рецепторов рекомендуется прекратить).

ФОРМА ВЫПУСКА

Таблетки покрытые оболочкой 150 мг и 300 мг. По 10 таблеток в стрипах из алюминиевой фольги. 2 или 10 стрипов вместе с инструкцией по применению в картонной пачке.

Раствор для внутривенного и внутримышечного введения 25 мг/мл в ампулах по 2 мл.

5 ампул, помещенные в блистер, вместе с инструкцией по применению в пачке из картона.

УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ

Список Б. При температуре не выше 25°C, в защищенном от света и недоступном для детей месте. Раствор не замораживать.

СРОК ГОДНОСТИ

Таблетки - 3 года. Раствор - 2 года. Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

УСЛОВИЯ ОТПУСКА ИЗ АПТЕК

По рецепту.

ПРОИЗВОДИТЕЛЬ

«Кадила Фармасьютикалз Лтд.», Индия

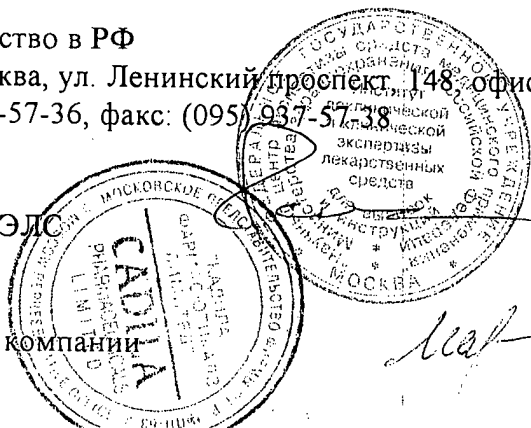
Представительство в РФ

117571, г. Москва, ул. Ленинский проспект, 148, офис 205.

Тел.: (095) 937-57-36, факс: (095) 937-57-38

Директор ИДКЭЛС

Представитель компании



В.В.Чельцов