

## **Состав**

*действующее вещество:* холестирамин резин (cholestyramine resin), сополимер стирола и дивинилбензола с четвертичными аммониевыми функциональными группами;

1 пакетик с порошком содержит холестирамин резину 4 г;

*другие составляющие:* сахароза, кислота лимонная безводная, кремния диоксид коллоидный безводный, краситель желтый запад FCF (E 110), краситель D&C желтый № 10 (хинолиновый желтый E 104), краситель D&C желтый № 10 алюминиевый лаковый 1, пропиленгликоля альгинат, апельсиновый ароматизатор, содержащий: апельсиновый ароматизатор, мальтодекстрин, акация (гумиарабик E 414), бутилгидрокситолуол (E 321).

## **Лекарственная форма**

Порошок для оральной суспензии.

*Основные физико-химические свойства:* мелкий порошок беловатого или желтоватого цвета со слабым запахом апельсина. Доли постороннего материала отсутствуют.

## **Фармакотерапевтическая группа**

Гиполипидемические средства. Холестирамин. Код АТХ C10A C01.

## **Фармакодинамика**

Холестирамин – анионообменная смола с четвертичными аммониевыми группами на основе полистирольного полимерного каркаса. В виде хлорида он связывает желчные кислоты *in vivo* и *in vitro*, обменивая хлоридион на ионы желчных кислот.

## **Фармакокинетика**

Единственным предшественником желчных кислот в организме является холестерин. При нормальном пищеварении желчные кислоты секретируются в кишечнике. Основная часть желчных кислот всасывается в кишечник и возвращается в печень по системе кишечно-печеночной циркуляции. В сыворотке крови здоровых людей содержится только небольшое количество желчных кислот.

Холестирамин в кишечнике связывается с желчными кислотами с образованием нерастворимого комплекса, выводимого с калом. Таким образом часть желчных кислот не возвращается в печень по системе кишечно-печеночной циркуляции.

В результате потери значительного количества желчных кислот с калом при приеме холестерамина происходит усиленное холестериновое окисление с образованием желчных кислот, при этом отмечается снижение содержания бета-липопротеида или липопротеида низкой плотности в плазме крови, а также снижение содержания холестерина в сыворотке крови. Поэтому, несмотря на увеличение синтеза холестерина в печени, его содержание в плазме крови снижается.

## **Показания**

Холестирамин показан как средство адъювантной терапии (в качестве дополнения к диете и физическим упражнениям) для снижения повышенного содержания холестерина в сыворотке крови пациентов с первичной гиперхолестеринемией с целью уменьшения риска атеросклеротических поражений коронарных артерий и инфаркта миокарда.

Холестирамин можно применять как средство снижения повышенного содержания холестерина у пациентов с комбинированной гиперхолестеринемией и гипертриглицеридемией, однако препарат не показан в случае, когда гипертриглицеридемия является доминирующей патологией.

Холестирамин можно применять для симптоматического лечения диареи, вызванной желчными кислотами у больных с синдромом короткого кишечника, а также для снятия зуда при холестазах в связи с частичной обструкцией желчевыводящих путей.

## **Противопоказания**

Холестирамин противопоказан при полной обструкции желчевыводящих путей, когда желчь совсем не попадает в кишечник.

Препарат противопоказан в случае повышенной чувствительности к действующему веществу или другим компонентам, входящим в состав препарата.

## **Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий**

Холестирамин как ионообменник имеет выраженную аффинность не только к желчным кислотам, но и другим анионам. Сложно априорно предположить,

будет ли оказывать влияние применение холестирамина на поглощение из кишечника тех или иных лекарственных средств. Потенциально необходимо рассматривать возможность такого взаимодействия лекарственных средств с холестирамином, если только отсутствие такого взаимодействия не подтверждено клиническими исследованиями.

Холестирамин может снижать усвоение таких препаратов для перорального применения как препараты тироксина, варфарина, хлортиазид (кислый), фенилбутазон, тетрациклин, пенициллин G, дигиталис. Следует иметь в виду, что при отмене холестерамина возможно развитие токсических явлений, обусловленных препаратами дигиталиса, если доза последнего была повышена с учетом снижения его усвоения под влиянием холестерамина. Холестирамин может также влиять на фармакокинетику препаратов, подверженных кишечнo-печеночной рециркуляции, таких как эстрогены.

Проведены исследования по взаимодействию холестерамина и различных ингибиторов HMG-CoA редуктазы. Хотя холестирамин снижает биодоступность этих ингибиторов, клинические эффекты снижения содержания холестерина при применении ингибиторов HMG-CoA редуктазы и холестерамина оказываются аддитивными.

Необходимо иметь в виду, что холестирамин может связывать другие лекарственные средства. Поэтому другие лекарственные средства следует принимать не позднее чем за 1 час до приема холестерамина и не ранее 4-6 часов (а лучше еще позже) после приема холестерамина.

## **Особенности применения**

Перед тем как начать лечение холестерамином, необходимо попробовать другие средства для снижения содержания холестерина (диетотерапия, снижение массы тела). Необходимо также заняться лечением основных заболеваний, таких как гипотиреоз, сахарный диабет, нефротический синдром, диспротеинемия, обструктивные болезни печени, которые могут быть причиной гиперхолестеринемии. Необходимо также проверить, не приводит ли применение других лекарственных средств к увеличению содержания холестерина липопротеидов низкой плотности. При применении холестерамина положительная тенденция к снижению уровня холестерина отмечается уже в течение первого месяца лечения. Прием препарата может быть продлен для закрепления полученного эффекта.

Существует вероятность того, что применение холестерамина в виде хлорида может привести к гиперхлоремическому ацидозу, что особенно верно у лиц

младшего возраста, где относительная доза препарата будет выше.

Применение холестерамина может приводить к запорам или усиливать существующие запоры. В таком случае следует снизить дозу препарата или даже отменить препарат. Возможно также обострение геморроя из-за запоров. В любом случае желательно не доводить больного до такого состояния, особенно при наличии клинических симптомов поражения коронарных артерий.

Холестирамин может вызвать стеаторею или усиливать уже существующую стеаторею. В таких случаях может потребоваться снижение дозы препарата.

Воздействие на усвоение витаминов: поскольку холестирамин связывает желчные кислоты, он может препятствовать усвоению в кишечнике жирорастворимых витаминов А, D и К. При длительном применении холестерамина необходимо применять парентеральные формы смеси витаминов А и D.

Недостаток витамина К, развивающийся при длительном применении холестерамина, может приводить к гипопротромбинемии и повышенному риску кровотечений. При развитии таких явлений необходимо применять парентеральные формы витамина К1, предупреждение рецидивов возможно при пероральном применении витамина К1.

При длительном применении холестерамина возможно также снижение содержания фолата в сыворотке крови или эритроцитах. В таких случаях необходимо принимать препараты, содержащие фолиевую кислоту.

Лабораторное исследование. В первые месяцы применения холестерамина требуется регулярный контроль содержания холестерина в сыворотке крови. Периодический контроль необходим и в дальнейшем. Периодически необходимо контролировать содержание триглицеридов в сыворотке крови.

*Применение пациентам в возрасте от 60 лет.*

Адекватных исследований по эффективности холестерамина у лиц всех возрастов не проведено. Однако у лиц пожилого возраста побочные явления со стороны желудочно-кишечного тракта более вероятны.

*Вспомогательные вещества.*

Препарат содержит сахарозу. Если у вас установлена непереносимость некоторых сахаров, проконсультируйтесь с врачом, прежде чем принимать это лекарственное средство.

Препарат содержит краситель желтый запах FCF (E 110), который может вызвать аллергические реакции.

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

Данных нет, но следует учитывать возможность развития побочных реакций со стороны нервной системы, таких как головокружение, сонливость, утрата сознания.

### **Применение в период беременности или кормления грудью**

Поскольку холестирамин не всасывается в кишечнике, теоретически он может негативно влиять на плод при приеме в рекомендуемых дозах. Однако контролируемых клинических исследований применения препарата беременным женщинам не проводили. К тому же холестирамин может препятствовать всасыванию жирорастворимых витаминов в кишечнике, что может негативно влиять на развитие плода.

Препарат следует с осторожностью применять кормящим грудью женщинам, поскольку он может препятствовать всасыванию витаминов в кишечнике, что может приводить к неполноценному питанию ребенка.

Таким образом, применение препарата беременным и кормящим грудью женщинам возможно только в тех случаях, когда потенциальная польза от применения препарата превышает потенциальный риск для плода или ребенка.

### **Способ применения и дозы**

Холестирамин применять перорально.

Чтобы свести к минимуму возможные побочные явления со стороны желудочно-кишечного тракта, желательно начинать терапию с одной дозы препарата 1 раз в сутки. Затем через 1-2 дня дозировку можно увеличить.

Важна мотивация больного для соблюдения установленной схемы лечения, несмотря на побочные явления, возникающие со стороны желудочно-кишечного тракта. Для успешного лечения важную роль играет контроль соблюдения схемы приема препарата.

Рекомендуемая доза взрослым составляет 4 г холестерамина от 1 до 6 раз в сутки. Дозировку можно изменить, чтобы наиболее отвечать индивидуальным потребностям больного.

Препарат не следует принимать в сухом виде, предназначен только для применения в виде водной суспензии.

Приготовление препарата для приема: цвет препарата может варьировать от серии до серии, что не влияет на качество самого препарата.

Для приготовления суспензии содержимое 1 пакетика поместить в стакан 120-180 мл воды или напитка, не содержащих углекислого газа (молоко или фруктовый сок). Через 1 минутку порошок интенсивно перемешать в жидкости. Порошок можно размешать в супе или соке с мякотью, выжатом из фруктов (яблоко или ананасов).

## **Дети**

Безопасность и эффективность применения холестерамина детям не установлены.

## **Передозировка**

Один случай передозировки был описан у пациента, принимавшего препарат в течение нескольких недель в дозе, составлявшей 150% максимально рекомендованной суточной дозы. Никаких существенных явлений при этом отмечено не было. Основным следствием при передозировке возможно нарушение проходимости желудочно-кишечного тракта. Наличием такой непроходимости, степенью ее выраженности и определяется необходимая симптоматическая терапия.

## **Побочные реакции**

Чаще при применении холестирамина отмечаются запоры, особенно при высокой дозе препарата и у пациентов пожилого возраста (60 лет). В большинстве случаев эти побочные явления снимаются общепринятой в таких случаях терапией. В отдельных случаях может потребоваться временное снижение дозы или прекращение применения препарата.

Реже возникают такие побочные явления как ощущение растяжения желудка, метеоризм, вздутие живота, тошнота, рвота, диарея, стеаторея, анорексия, изжога, сыпь на коже, раздражение кожи, языка, перианальной зоны, склонность к кровотечениям. ухудшение зрения во тьме вследствие недостатка витамина А, гиперхлоремический ацидоз у детей, остеопороз, проявления недостатка витамина D.

Иногда наблюдалось наличие уплотнений содержимого желчевыводящих путей, включая уплотнение содержимого желчного пузыря, что может быть проявлением заболевания печени, и не связано с применением препарата.

У одного больного при каждом приеме препарата наблюдались приступы желчной колики. Еще в одном случае был отмечен острый абдоминальный симптомокомплекс, при этом рентгенографически в поперечной кишке обнаруживали наличие пастообразной массы.

Наблюдались и другие побочные реакции, не все они могут быть обусловлены непосредственно приемом холестирамина. Это желудочно-кишечные и ректальные кровотечения, опорожнение черного цвета, геморроидальные кровотечения, язвы двенадцатиперстной кишки, дисфагия, икота, отрыжка, ректальная боль, обострение язвенной болезни, ощущение кислого привкуса, обострение панкреатита.

*Изменения лабораторных характеристик:* нарушение функций печени.

*Гематологические изменения:* изменения величины протромбинового времени (снижение или увеличение), экхимозы, анемия, кровотечения десны.

*Со стороны скелетно-мышечной системы:* боли в спине, мышцах, суставах, артрит.

*Неврологические изменения:* головные боли, головокружение, тревожные состояния, повышенная утомляемость, шум в ушах, потеря сознания, сонливость, ишионевралгия, парестезия.

*Со стороны почек:* гематурия, дизурия, жженный запах мочи, диурез (увеличение выделения мочи).

*Со стороны органов зрения:* увеит.

*Реакции гиперчувствительности:* крапивница, бронхиальная астма, затруднение дыхания, свистящее дыхание.

*Другие изменения:* снижение или увеличение массы тела, повышение либидо, отек желез, отек, кариес.

## **Срок годности**

3 года.

## **Условия хранения**

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

**Упаковка**

По 9 г порошка в пакете, по 30 пакетов в картонной коробке.

**Категория отпуска**

По рецепту.

**Производитель**

Фармасайнс Инк.

**Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности**

6111 Роялмаунт Авеню, 100, Монреаль, Квебек H4P 2T4, Канада

**Источник инструкции**

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