

Состав

действующее вещество: ursodeoxycholic acid;

1 капсула содержит урсодезоксихолевой кислоты (в пересчете на 100 % сухое вещество) 250 мг;

вспомогательные вещества: крахмал кукурузный, гидроксипропилцеллюлоза, натрия кроскармеллоза, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат, желатин.

Лекарственная форма

Капсулы.

Основные физико-химические свойства: твердые желатиновые капсулы номером 0, корпус и крышка белого цвета. Содержание капсулы – гранулы или порошок белого или почти белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа

Средства, применяемые для лечения печени и желчевыводящих путей. Средства, применяемые при билиарной патологии. Код АТХ А05А А02.

Средства, применяемые при заболеваниях печени, липотропные вещества. Код АТХ А05В.

Фармакодинамика

Незначительное количество урсодезоксихолевой кислоты имеется в желчи человека.

В случае перорального применения она снижает насыщенность желчи холестерином, подавляя его поглощение в кишечнике и снижая секрецию холестерина в желчи. Возможно, благодаря дисперсии холестерина и образованию жидких кристаллов происходит постепенное растворение желчных камней.

Согласно современным знаниям считают, что эффект урсодезоксихолевой кислоты при заболеваниях печени и холестаза обусловлен относительной заменой липофильных, подобных к детергентам токсичных желчных кислот гидрофильной цитопротекторной нетоксичной урсодезоксихолевой кислотой, улучшением секреторной способности гепатоцитов и иммунорегуляторных

процессов.

Применение детям

Муковисцидоз

Доступная информация из клинических отчетов, которая касается длительного применения урсодезоксихолевой кислоты (в течение периода до 10 лет) при лечении детей с гепатобилиарными нарушениями, связанными с муковисцидозом.

Существуют данные в пользу того, что применение урсодезоксихолевой кислоты может уменьшить пролиферацию в желчных протоках, остановить прогрессирование гистологических изменений и даже устранить гепатобилиарные изменения, при условии начала терапии на ранних стадиях муковисцидоза. Для лучшей эффективности лечения с применением урсодезоксихолевой кислоты должно быть начато сразу же после уточнения диагноза муковисцидоза.

Фармакокинетика

При пероральном введении урсодезоксихолевая кислота быстро абсорбируется в тонкой кишке и верхнем отделе подвздошной кишки путем пассивного транспорта, а в терминальном отделе подвздошной кишки – путем активного транспорта. Степень абсорбции обычно составляет 60–80 %. После всасывания желчная кислота подлечит в печени почти полной конъюгации с аминокислотами глицином и таурином и после этого выводится с желчью. Клиренс первого прохождения через печень составляет до 60 %.

В зависимости от суточной дозы и основного нарушения или состояния печени более гидрофильная урсодезоксихолевая кислота аккумулируется в желчи. В то же время наблюдается относительное уменьшение других более липофильных желчных кислот.

Под влиянием кишечных бактерий происходит частичная деградация до 7-кетолитохолевой и литохолевой кислот. Литохолевая кислота является гепатотоксической и вызывает повреждения паренхимы печени у ряда видов животных. У человека поглощается лишь незначительное ее количество, которое в печени сульфатируется и таким образом детоксицируется, прежде чем быть выведенной с желчью и, наконец, с калом.

Биологический период полураспада урсодезоксихолевой кислоты составляет 3,5–5,8 дня.

Показания

Для растворения рентгеноотрицательных холестериновых желчных камней размером не более 15 мм в диаметре у больных с функционирующим желчным пузырем, несмотря на присутствие в нем желчного(ых) камня(ей).

Для лечения билиарного рефлюкс-гастрита.

Для симптоматического лечения первичного билиарного цирроза (ПБЦ) при отсутствии декомпенсированного цирроза печени.

Для лечения гепатобилиарных расстройств при муковисцидозе у детей в возрасте от 6 до 18 лет.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к любому веществу, входящему в состав лекарственного средства.

Острое воспаление желчного пузыря или желчных протоков.

Непроходимость желчных протоков (закупорка общего желчного протока или протоки пузыря).

Частые эпизоды печеночных коликов.

Рентгеноконтрастные кальцифицированные камни желчного пузыря.

Нарушение сократимости желчного пузыря.

Неудачный результат портоэнтеростомии или отсутствие адекватного желчного оттока у детей с атрезией желчных путей.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Капсулы Урсомакса 250 мг нельзя применять одновременно с холестирамином, холестиполом или антацидными препаратами, содержащими гидроокись алюминия и/или смектит, поскольку эти препараты связывают урсодезоксихолевую кислоту в кишечнике и таким образом препятствуют ее поглощению и эффективности. Если применение препаратов, содержащих одно из названных веществ, необходимо, их нужно принимать минимум за 2 часа до или через 2 часа после приема капсул Урсомакса 250 мг.

Капсулы Урсомакса 250 мг могут усилить поглощение циклоспорина из кишечника. У пациентов, которые лечатся циклоспорином, врач должен проверять концентрацию этого вещества в крови и в случае необходимости корректировать дозу циклоспорина.

В отдельных случаях капсулы Урсомакса 250 мг могут уменьшать поглощения ципрофлоксацина.

Известно, что совместное применение урсодезоксихолевой кислоты (500 мг/сутки) и розувастатина (20 мг/сутки) приводило к некоторому повышению концентрации розувастатина в плазме. Клиническая значимость данного взаимодействия, а также значимость к другим статинам, неизвестна.

Урсодезоксихолевая кислота снижает максимальную концентрацию (C_{max}) в плазме крови и площадь под кривой (AUC) для кальциевого антагониста нифедипина. Рекомендуется тщательное наблюдение за результатом совместного применения нифедипина и урсодезоксихолевой кислоты. Может потребоваться повышение дозы нифедипина.

Кроме того, сообщалось об ослаблении терапевтического действия дапсона.

Эти сведения, а также данные, полученные *in vitro*, позволяют предположить, что урсодезоксихолевая кислота потенциально может вызвать индукцию ферментов цитохрома P450 3A. Но в хорошо спланированном исследовании взаимодействия с будесонидом, что является доказанным субстратом цитохрома P450 3A, подобного эффекта не наблюдалось.

Эстрогенные контрацептивы, а также препараты для уменьшения концентрации холестерина в крови могут усиливать секрецию холестерина печенью и, таким образом, способствовать камнеобразованию в желчном пузыре, что является противоположным эффектом для урсодезоксихолевой кислоты, используемой для их растворения.

Особенности применения

Капсулы Урсомакса 250 мг нужно принимать под наблюдением врача.

В течение первых 3 месяцев терапии врач должен проводить мониторинг показателей функции печени (аспартатаминотрансфераза, аланинаминотрансфераза и гамма-глутамилтрансфераза) каждые 4 недели, в дальнейшем – каждые 3 месяца. Это позволяет определить наличие или отсутствие ответа на лечение у пациентов с первичным билиарным циррозом, а также своевременно выявить потенциальные нарушения функции печени, особенно у пациентов с первичным билиарным циррозом на поздних стадиях.

Применение для растворения холестериновых желчных камней

Для оценки терапевтического эффекта и для своевременного выявления кальцификации желчных камней, в зависимости от размера камня, следует проводить визуализацию желчного пузыря (пероральная холецистография) с осмотром затмений в положениях пациента стоя и лежа на спине (ультразвуковой контроль) через 6–10 месяцев после начала лечения.

Если желчный пузырь нельзя визуализировать на рентгеновских снимках или в случаях кальцификации камней, нарушение сократимости желчного пузыря или частых желчных коликов капсулы Урсомакса 250 мг принимать нельзя.

Женщины, принимающие Урсомакс 250 мг в капсулах для растворения желчных камней, должны использовать эффективный негормональный метод контрацепции, поскольку гормональные контрацептивы могут повышать образование камней в желчном пузыре.

Лечение пациентов с первичным билиарным циррозом (ПБЦ) на поздней стадии

Крайне редко сообщалось о декомпенсации цирроза печени, которая частично может регрессировать после прекращения терапии.

У пациентов с ПБЦ очень редко возможно усиление симптомов в начале лечения, например, может усиливаться зуд. В таких случаях дозу Урсомакса 250 мг в капсулах нужно снизить до одной капсулы Урсомакса 250 мг в сутки; затем дозу следует постепенно повышать, как описано в разделе «Способ применения и дозы».

При появлении диареи следует уменьшить дозировку; если диарея не прекращается, лечение следует прекратить.

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

Влияния на способность управлять автомобилем и пользоваться механизмами не наблюдалось.

Применение в период беременности или кормления грудью

Исследования на животных не показали влияния урсодезоксихолевой кислоты на фертильность. Данные о влиянии на фертильность у человека отсутствуют.

Данные по применению урсодезоксихолевой кислоты беременным женщинам недостаточны. Результаты исследований на животных свидетельствуют о

наличии репродуктивной токсичности на ранних стадиях беременности. Капсулы Урсомакса не следует применять во время беременности, за исключением случаев крайней необходимости. Женщины репродуктивного возраста могут принимать препарат только при условии, если они используют надежные средства контрацепции.

Рекомендуется использовать негормональные противозачаточные средства или пероральные контрацептивы с низким содержанием эстрогенов. Пациенткам, которые получают урсодезоксихолевую кислоту 250 мг в капсулах для растворения камней в желчном пузыре, следует использовать эффективные негормональные средства контрацепции, поскольку гормональные пероральные контрацептивы могут усиливать камнеобразования в желчном пузыре. До начала лечения следует исключить возможность беременности.

По данным нескольких зафиксированных случаев применения препарата матерям, кормящим грудью, содержание урсодезоксихолевой кислоты в грудном молоке было крайне низким, поэтому не следует ожидать развития каких-либо нежелательных явлений у детей, получающих такое молоко.

Способ применения и дозы

Возрастных ограничений по применению Урсомакса нет. Для пациентов, масса тела которых меньше 47 кг или у которых возникают трудности при глотании капсул Урсомакса, доступна другая лекарственная форма урсодезоксихолевой кислоты – суспензия.

Для растворения холестериновых желчных камней

Примерно 10 мг урсодезоксихолевой кислоты/кг массы тела:

Масса тела	Количество капсул
до 60 кг	2
61-80 кг	3
81-100 кг	4
больше 100 кг	5

Капсулы следует принимать не разжевывая, запивая водой, 1 раз в сутки вечером перед сном.

Препарат следует принимать регулярно.

Необходимое для растворения желчных камней время обычно составляет 6–24 месяца. Если уменьшение размеров желчных камней не наблюдается после 12 месяцев приема, продолжать терапию нецелесообразно.

Эффективность лечения нужно проверять каждые 6 месяцев с помощью ультразвукового или рентгеновского исследования. Дополнительными исследованиями нужно проверять, не состоялась ли со временем кальцификация камней. Если это случилось, лечение следует прекратить.

Для лечения билиарного рефлюкс-гастрита

1 капсула Урсомакса 250 мг один раз в день с некоторым количеством жидкости вечером перед сном.

Обычно для лечения гастрита с рефлюксом желчи капсулы Урсомакса 250 мг принимают в течение 10–14 дней. Длительность лечения зависит от состояния больного. Врач должен принимать решение о продолжительности лечения в каждом случае индивидуально.

Для симптоматического лечения первичного билиарного цирроза

Суточная доза зависит от массы тела и варьирует от 3 до 7 капсул (14 ± 2 мг урсодезоксихолевой кислоты/кг массы тела).

В первые 3 месяца лечения капсулы Урсомакса 250 мг нужно принимать, распределив суточную дозу на 3 приема в течение дня. При улучшении показателей функции печени суточную дозу можно принимать 1 раз в день вечером.

Масса тела (кг)	Суточная доза (мг/кг массы тела)	Капсулы			
		первые 3 месяца			в дальнейшем
		утро	день	вечер	вечер (1 раз в день)
47-62	12-16	1	1	1	3
63-78	13-16	1	1	2	4
79-93	13-16	1	2	2	5
94-109	14-16	2	2	2	6
больше 110		2	2	3	7

Капсулы нужно глотать целиком, запивая жидкостью. Необходимо соблюдать регулярность приема.

Применение капсул Урсомакса 250 мг при первичном билиарном циррозе может быть неограниченным во времени.

У пациентов с первичным билиарным циррозом в редких случаях в начале лечения могут ухудшаться клинические симптомы, например может усиливаться зуд. Если это случилось, терапию следует продолжать, принимая 1 капсулу Урсомакса 250 мг в сутки, после чего постепенно повышать дозу (увеличивая каждую неделю суточную дозу на 1 капсулу) до достижения назначенного режима дозирования.

Применение детям

Для детей с муковисцидозом в возрасте от 6 до 18 лет доза составляет 20 мг/кг/сутки и распределяется на 2-3 приема, с последующим увеличением дозы до 30 мг/кг/сутки в случае необходимости.

Масса тела (кг)	Суточная доза (мг/кг)	Урсомакс, капсулы, по 250 мг		
		Утро	День	Вечер
20-29	17-25	1		1
30-39	19-25	1	1	1
40-49	20-25	1	1	2
50-59	21-25	1	2	2
60-69	22-25	2	2	2
70-79	22-25	2	2	3
80-89	22-25	2	3	3
90-99	23-25	3	3	3
100-109	23-25	3	3	4
>110		3	4	4

Дети

Для растворения холестериновых желчных камней, лечения билиарного рефлюкс-гастрита и симптоматического лечения ПБЦ:

Нет принципиальных возрастных ограничений для применения Урсомакса детям, но капсулы не назначают детям с массой тела менее 47 кг. Если масса тела ребенка меньше 47 кг и/или если ребенок испытывает трудности с

глотанием, рекомендуется применять урсодезоксихолевую кислоту в виде суспензии.

Для лечения гепатобилиарных расстройств при муковисцидозе:

Применять детям в возрасте от 6 до 18 лет.

Передозировка

В случаях передозировки может возникнуть диарея. Другие симптомы передозировки маловероятны, поскольку поглощение урсодезоксихолевой кислоты уменьшается при увеличении дозы, и поэтому большая ее часть выводится с калом.

В случае появления диареи дозу следует уменьшить, а в случаях постоянной диареи терапию следует прекратить.

В специфических мероприятиях необходимости нет, и последствия диареи необходимо лечить симптоматично, с восстановлением баланса жидкости и электролитов.

Дополнительная информация по особым группам пациентов

Длительная терапия высокими дозами урсодезоксихолевой кислоты (28–30 мг/кг/сутки) у пациентов с первичным склерозирующим холангитом (применение по незарегистрированным показаниям) была связана с более высокой частотой серьезных нежелательных явлений.

Побочные реакции

Нарушения пищеварительного тракта: сообщалось о случаях пастообразных испражнений или диарею на протяжении лечения урсодезоксихолевой кислотой.

Очень редко при лечении первичного желчного цирроза отмечалась сильная абдоминальная боль с локализацией в правом подреберье.

Расстройства гепатобилиарной системы.

Очень редко при лечении урсодезоксихолевой кислотой возможна кальцификация желчных камней.

В течение терапии развитых стадий первичного билиарного цирроза очень редко наблюдается декомпенсация цирроза печени, которая частично регрессировала после прекращения лечения.

Нарушения со стороны иммунной системы.

Очень редко возможны аллергические реакции, которые включают сыпь, крапивницу.

Срок годности

3 года.

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 10 капсул в блистере. По 10 блистеров в пачке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

ООО «ФАРМЕКС ГРУП».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Украина, 08301, Киевская обл., г. Борисполь, ул. Шевченко, дом 100.

Источник инструкции

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