

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату

УРСОХОЛ®
(URSOCHOL)

Склад:

діюча речовина: ursodeoxycholic acid;

1 капсула містить урсодеоксихолієвої кислоти 250 мг;

допоміжні речовини: крохмаль картопляний, метилцелюлоза, кремнію діоксид колоїдний безводний, магнію стеарат.

Лікарська форма. Капсули.

Фармакотерапевтична група.

Засоби, що застосовуються при біліарній патології.

Код АТСА05А А02.

Засоби, що застосовуються при захворюваннях печінки, ліпотропні речовини.

Код АТСА05В.

Клінічні характеристики.

Показання.

- Розчинення рентгеннегативних холестеринових жовчних каменів розміром не більше 15 мм у діаметрі у хворих із функціонуючим жовчним міхуром, незважаючи на присутність у ньому жовчного(их) каменя(нів).
- Лікування гастриту з рефлюксом жовчі.
- Симптоматичне лікування первинного біліарного цирозу (ПБЦ) за умови відсутності декомпенсованого цирозу печінки.

Протипоказання.

- Підвищена чутливість до діючої речовини або до інших компонентів препарату.
- Гостре запалення жовчного міхура.
- Гостре запалення або непрохідність жовчних проток.
- Застосування хворим із жовчним міхуром, що не візуалізується рентгенологічними методами, з кальцифікованими каменями жовчного міхура, з порушенням скоротливості жовчного міхура, з частими жовчними коліками.
- Цироз печінки у стадії декомпенсації.

Спосіб застосування та дози.

Вікових обмежень для застосування Урсохолу® немає. Препарат застосовувати внутрішньо хворим з масою тіла більше 47 кг. Для пацієнтів, які мають масу тіла менше 47 кг або у яких виникають труднощі при ковтанні капсул застосовувати препарат у формі суспензії.

Для розчинення холестеринових жовчних каменів.

Препарат застосовувати 1 раз на добу увечері перед сном у дозі приблизно 10 мг/кг маси тіла.

Маса тіла (кг)	Капсули
----------------	---------

47-60 кг

2

61-80 кг
3

Капсули ковтати цілими, запиваючи невеликою кількістю рідини. Слід додержуватись регулярності прийому.

Тривалість лікування зазвичай становить 6-24 місяці. Якщо зменшення розмірів жовчних каменів не спостерігається після 12 місяців, терапію препаратом слід припинити.

Ефективність лікування потрібно перевіряти за допомогою ультразвукового або рентгенівського дослідження через кожні 6 місяців. Необхідно проводити додаткові дослідження для виявлення можливої кальцифікації каменів. Якщо це трапилось, лікування слід припинити.

Для лікування гастриту з рефлюксом жовчі.

Препарат застосовувати 1 раз на добу увечері перед сном у дозі 1 капсула. Капсули ковтати цілими, запиваючи невеликою кількістю рідини.

Тривалість лікування залежить від стану хворого і зазвичай становить 10-14 днів. Лікар повинен приймати рішення про тривалість лікування у кожному випадку індивідуально.

Для симптоматичного лікування первинного біліарного цирозу (ПБЦ).

Добова доза препарату залежить від маси тіла і становить приблизно 14 ± 2 мг/кг маси тіла. У перші 3 місяці лікування розподілити добову дозу на 3 прийоми, у подальшому при покращенні показників функції печінки препарат застосовувати 1 раз на добу увечері.

Маса тіла (кг)	Добова доза (мг/кг маси тіла)	Капсули			
		перші 3 місяці			у подальшому
		ранок	день	вечір	вечір (1 раз на добу)
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
понад 110		2	2	3	7

Капсули ковтати цілими, запиваючи невеликою кількістю рідини. Слід додержуватись регулярності прийому.

Тривалість лікування препаратом при первинному біліарному цирозі може бути необмеженою у часі.

У пацієнтів з первинним біліарним цирозом на початку лікування можливе погіршення клінічних симптомів, наприклад, посилення свербіжу. Якщо це трапилось, терапію слід продовжувати, приймаючи препарат у дозі 1 капсула на добу, після чого поступово підвищувати дозу (збільшуючи добову дозу на 1 капсулу кожного тижня) до досягнення призначеного режиму дозування.

Побічні реакції.

З боку травного тракту: пастоподібні випорожнення або діарея, при лікуванні первинного біліарного цирозу – можливий абдомінальний біль з локалізацією у правому підребер'ї.

З боку гепатобіліарної системи: кальцифікація жовчних каменів, при терапії розвинених стадій первинного біліарного цирозу – декомпенсація печінкового цирозу, яка частково регресувала після припинення лікування.

З боку імунної системи: реакції гіперчутливості, у тому числі: висипання, свербіж, кропив'янка.

Передозування.

Симптоми: може мати місце діарея. Інші симптоми передозування мало ймовірні, оскільки поглинання урсодезоксихолевої кислоти зменшується при збільшенні дози і тому більша її кількість екскретується з фекаліями.

Лікування: зменшення дози препарату, а у випадку постійної діареї – відміна препарату, симптоматична терапія, направлена на відновлення балансу рідини та електролітів.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Період вагітності. Достатніх даних про застосування урсодезоксихолевої кислоти, зокрема у I триместрі вагітності, немає. Препарат не слід застосовувати у період вагітності, окрім випадків крайньої необхідності. Рішення про це може прийняти тільки лікар.

Перед початком лікування виключити можливість вагітності. Жінкам репродуктивного віку препарат призначати тільки за умов надійної контрацепції.

Період годування груддю. Через відсутність достовірних даних про здатність урсодезоксихолевої кислоти проникати у грудне молоко препарат не слід застосовувати у період годування груддю. У разі необхідності застосування препарату годування груддю слід припинити.

Діти.

Немає принципових вікових обмежень для застосування препарату дітям, але капсули не слід застосовувати дітям з масою тіла менше 47 кг. Якщо дитина має труднощі з ковтанням та/або її маса тіла менше 47 кг рекомендовано застосовувати препарат у формі суспензії.

Особливості застосування.

Препарат застосовувати під наглядом лікаря.

Протягом перших 3 місяців терапії слід проводити моніторинг параметрів функції печінки: визначати у плазмі крові рівень ферментів аспартатамінотрансферази (SGOT), аланінтрансамінази (SGPT) та гамма-глутамілтранспептидази (γ -GT) кожні 4 тижні, у подальшому – кожні 3 місяці.

Для оцінки терапевтичного ефекту та своєчасного виявлення кальцифікації жовчних каменів слід перевіряти стан жовчного міхура в положенні стоячи та лежачи на спині за допомогою ультразвукового дослідження або холецистографії кожні 6-10 місяців. При наявності ознак кальцифікації жовчних каменів лікування слід припинити.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами.

Препарат не впливає на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

При одночасному застосуванні препарату з іншими лікарськими засобами можливе:

з антацидними препаратами, які містять алюміній; холестираміном, холестиполом – зниження абсорбції урсодезоксихолевої кислоти в кишечнику. Не застосовувати одночасно дані лікарські засоби. Якщо застосування препаратів, що містять одну з цих речовин, є необхідним, їх слід застосовувати принаймні за 2 години до або після прийому капсул Урсохолу[®] ;

з циклоспорином – підвищення абсорбції останнього в кишечнику. Необхідний періодичний контроль рівня циклоспору в крові та у разі необхідності – коригування його дози;

з ципрофлоксацином – зниження абсорбції останнього в кишечнику;

з пероральними гіпоглікемічними препаратами – посилення дії останніх;

з гіполіпідемічними препаратами (клофібрат, безафібрат, пробуцол), естрогенами – послаблення дії урсодезоксихолевої кислоти внаслідок підвищення рівня холестерину у жовчі.

Урсодезоксихолева кислота знижує максимальну концентрацію (C_{max}) у плазмі крові і площу під кривою (AUC) для кальцієвого антагоніста нітрендипіну. Виходячи з цього, а також з єдиного повідомлення про взаємодію з речовиною дапсоном (зменшення терапевтичного ефекту) та з досліджень *in vitro*, можна припустити, що препарат індукуює активність ферменту цитохрому P450 3A4, що приймає участь у метаболізмі лікарських засобів.

Отже, у випадку одночасного застосування препаратів, які метаболізуються за участю цього ферменту, слід дотримуватися обережності і враховувати, що може знадобитися корегування дози.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Незначну кількість урсодезоксихолевої кислоти знайдено у жовчі людини. Після перорального застосування урсодезоксихолева кислота знижує насиченість жовчі холестерином, пригнічуючи його поглинання у кишечнику і знижуючи секрецію холестерину в жовч. Можливо, завдяки дисперсії холестерину та утворенню рідких кристалів відбувається поступове розчинення жовчних каменів.

Згідно з сучасними даними вважають, що ефект урсодезоксихолевої кислоти при захворюваннях печінки та холестази обумовлений відносною заміною ліпофільних, подібних до детергентів токсичних жовчних кислот гідрофільною цитопротекторною нетоксичною урсодезоксихолевою кислотою, покращенням секреторної здатності гепатоцитів та імунорегуляторними процесами.

Фармакокінетика.

Після застосування всередину препарат швидко і повністю абсорбується: у тощій та верхній клубовій кишках – шляхом пасивного транспортування, а в термінальній клубовій кишці – шляхом активного транспортування. Біологічна доступність у середньому становить 60-80 %. Час досягнення максимальної концентрації у плазмі крові – 30-60 хвилин. Проникає крізь плацентарний бар'єр. Метаболізується в печінці шляхом кон'югації з амінокислотами гліцином та таурином. Кліренс першого проходження через печінку становить до 60 %. Виділяється з організму з жовчю. Залежно від добової дози та основного порушення або стану печінки більш гідрофільна урсодезоксихолева кислота акумулюється в жовчі. Водночас спостерігається відносне зменшення інших більш ліпофільних жовчних кислот. Біологічний період напіврозпаду урсодезоксихолевої кислоти становить 3,5-5,8 дня.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості: тверді непрозорі желатинові капсули з кришечкою і корпусом білого кольору, що містять порошок або гранули білого кольору.

Термін придатності. 2 роки.

Умови зберігання.

Зберігати у недоступному для дітей місці в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С.

Упаковка.

По 10 капсул у контурній чарунковій упаковці; по 5 або по 10 контурних чарункових упаковок у пачці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник.

ПрАТ «Фармацевтична фірма «Дарниця».

Місцезнаходження.

Україна, 02093, м. Київ, вул. Бориспільська, 13.