

Омега Інста: швидке та надійне полегшення печії

Відповідно до визначення Всесвітньої організації охорони здоров'я, гастроєзофагеальна рефлюксна хвороба (ГЕРХ) характеризується як наявність симптомів, що погіршують якість життя пацієнта, а також ушкоджень або ускладнень, які виникають унаслідок ретроградного руху вмісту шлунка у стравохід, ротоглотку та/або дихальні шляхи. ГЕРХ є дуже поширеним захворюванням: в економічно розвинених країнах ГЕРХ виявляють приблизно у 20% дорослого населення, натомість у країнах, що розвиваються, цей показник може сягати 40%. Трьома клінічними формами ГЕРХ є ерозивний езофагіт, неерозивна рефлюксна хвороба і стравохід Барретта. Ведення ГЕРХ, що супроводжується печією, зазвичай складається з корекції способу життя та зменшення концентрації кислоти у просвіті стравоходу, що досягається шляхом її локальної нейтралізації або пригнічення секреції у шлунку за допомогою медикаментозної терапії чи антирефлюксного хірургічного втручання. Як зазначено в усіх сучасних настановах, препаратами для лікування ГЕРХ є інгібітори протонної помпи (ІПП).

**ІПП з відстроченим вивільненням:
нерозв'язані питання й обмеження**

Усі ІПП є слабкими основами та мають однаковий механізм дії. Після перорального прийому ІПП всмоктуються в тонкій кишці й потоком крові транспортуються в парієтальні клітини шлунка, накопичуються в секреторних каналах і при низьких значеннях рН конвертуються у свою активну форму (тетрациклічний сульфенамід). Останній незворотно зв'язується з ферментом H^+K^+-ATP азою, блокуючи кислотопродукцію.

Оскільки ІПП характеризуються коротким періодом напіврозпаду,

їх стабільний антисекреторний ефект досягається повільно, як правило, через 3-5 днів. Після першого перорального прийому пригнічуються протонні помпи, які активні на даний момент, після другого – ті, що стали активними після прийому першої дози і т. д. Цей процес повторюється до досягнення динамічної рівноваги (у середньому на третій день прийому ІПП), коли інгібується приблизно 70% протонних помп.

Більшість ІПП є кислотолабільними і при пероральному застосуванні можуть зазнавати руйнівного впливу HCl у шлунку. У зв'язку з цим вони виготовляються у желатинових

капсулах (омепразол, лансопризол, езомепразол) або у формі таблеток із захисною кишково-розчинною оболонкою (пантопризол, рабепризол, езомепразол). Пероральне використання таких форм ІПП знижує швидкість потрапляння в системний кровоток, що дозволяє вважати їх лікарськими засобами сповільненого вивільнення (delayed-release – DR).

**Омес Інста – омепразол
із негайним вивільненням**

Результати систематичного огляду досліджень ефективності ІПП у лікуванні ГЕРХ показали, що більшість пацієнтів не отримують повного полегшення денних і нічних симптомів після прийому першої дози. Відсутність швидкої відповіді на терапію ІПП може викликати у пацієнта незадоволення лікуванням і призводити до невиправданого підвищення дози або заміни препарату.

Для подолання обмежень ІПП з відстроченим вивільненням у пацієнтів із ГЕРХ був створений Омез Інста – єдиний в Україні омепразол із негайним вивільненням (immediate release – IR) у формі порошку для приготування пероральної суспензії, не покритий кишково-розчинною оболонкою, у саше. Уміст саше (порошок омепразолу 20 мг та бікарбонат натрію 1680 мг як буфер) необхідно розчинити у 30 мл води і випити.

При пероральному застосуванні омепразол IR відрізняється швидкою абсорбцією: середній час досягнення максимальної концентрації омепразолу в плазмі крові ($t_{\max}$) становить лише 25 хв.

Ефективну абсорбцію омепразолу в препараті Омез Інста забезпечує бікарбонат натрію (двовуглекислий натрій, сода), який захищає не покритий кишково-розчинною оболонкою омепразол від кислотної деградації у шлунку. Бікарбонат натрію, діючи як буфер, також швидко нейтралізує кислоту шлункового соку. Крім того, він чинить збудливу дію на рецептори слизової оболонки шлунка, що збільшує виділення гастрину та формує вторинне посилення шлункової секреції. Проте цей, на перший погляд,

недолік бікарбонату натрію в препараті Омез Інста (омепразол IR) використаний як спосіб швидкої стимуляції парієтальних клітин та активації великої кількості протонних pomp, що дозволяє значно прискорити початок дії ІПП.

У дослідженнях фармакодинаміки омепразол IR продемонстрував чіткі переваги над ІПП з відстроченим вивільненням (DR) (Freston J.W. et al., 2003). Так, у перші 30 хв після прийому омепразол DR не чинив ефекту на кислотність шлунка, натомість омепразол IR знижував концентрацію кислоти на 78% порівняно з початковим рівнем. Із 4-ї по 6-ту годину після прийому середнє зменшення кислотності шлунка порівняно з початковою становило 65% для омепразолу IR і тільки 27% для контрольної групи. Отже, антисекреторний ефект омепразолу IR розвивається швидше і початково є сильнішим.

Важливо, що швидкий антисекреторний ефект омепразолу IR (Омез Інста) досягається не за рахунок скорочення тривалості дії. Прийом омепразолу IR уранці асоціюється з надійним контролем постпрандіальної кислотності протягом усього дня з першої доби лікування (Howden C.W., 2005).

У дослідженні В. Goldlust і співавт. (2004) пацієнти приймали омепразол IR 20 мг уранці протягом 7 днів; на 8-й день вони отримали дві дози по 20 мг – уранці й увечері. Додавання вечірньої дози підтримувало рН шлунка >4 упродовж значно більшого часу протягом доби і в нічні години (рис. 1).

Клінічні дослідження омепразолу IR

У подвійному сліпому дослідженні ІІІ фази пацієнтів віком 18-75 років із неускладненою ГЕРХ і частим виникненням симптомів (2-3 рази на тиждень) рандомізували для прийому омепразолу ІR або DR 20 мг разом з відповідним плацебо. Пацієнти приймали препарати самостійно під час першого епізоду печії і могли продовжувати лікування до 3 днів. Повне стійке зменшення вираженості симптомів упродовж перших 30 хв після прийому досягалося утричі частіше у групі омепразолу ІR порівняно з контрольною групою омепразолу DR ($p=0,0199$).

У відкритому рандомізованому дослідженні D.M. Orbelo та співавт. (2014) порівнювали ефективність ранкового і вечірнього прийому омепразолу IR 40 мг у пацієнтів з тяжким рефрактерним рефлюксним езофагітом. Після 8 тиж лікування загоєння ерозій за даними ендоскопії було досягнуто загалом у 88% пацієнтів, а в решти 12% спостерігалось значне покращення. Повне полегшення печії відбулося у 77 vs 65% випадків при прийомі препарату вранці або ввечері,

Dr.Reddy's

ОМЕЗ

Інста

Лікує печію швидко полегшує симптоми**

швидкий ефект*

24

один раз на добу

сприяє попередженню «синдрому рикошету»¹

*10-30 хв (при прийомі натще за 1 годину до прийому їжі). **Стричненку підвищеної кислотності шлункового соку (гіперацидність). 1. Ефективність і безпека засоби інгібітора протонної помпи (немає даного висловлювання при гастрофобігачній рефлексній болесні, результаті дослідження ІНС-ІА ПЕРСПЕКТИВА, В. І. Симоненков, et al. ЛЕНАШІЙ ВРАЧ, АВГУСТ 2014, № 8, www.vrach.ru).

ОМЕЗ ІНСТА. Витяг з інструкції для медичного застосування. Склад: діюча речовина: omeprazole, 1 саше містить омепразолу 20 мг, допоміжні речовини: натрію гідрокарбонату, ксиліту, цукрози, цукрози, ксилітану, камеди, ароматизатор мятний. **Лікарська форма.** Порошок для орального суспензії. **Фармакотерапевтична група:** Засоби для лікування патологій шлунка та gastrofobicheskoy рефлексної хвороби. Інгібітори протонного насоса. Омепразол, код АТХ А02B.C01. **Показання.** Лікування печії, стричненню підвищеної кислотності шлункового соку (гіперацидність). **Протипоказання.** Підвищена чутливість до омепразолу, замінених бензімідазолів або до будь-якої з допоміжних речовин. Одночасне застосування з алкалоїдами, складовою переносимістю галактози, дефіцит лактази або синдромом мальабсорбції глюкози та галактози, мальабсорбції глюкози. Омепразол не можна приймати одночасно з нитрогліцерином. **Спосіб застосування та дози.** Застосовувати внутрішньо за 1 годину до прийому їжі. Вист саше розчинити у 30 мл води (2 столових ложки). Препарат не слід змішувати з іншими рідинами або з їжею. Суспензію розмешувати та випити одразу після приготування. У порожню склянку із залишками суспензії додати воду і випити залишок препарату. Рекомендована доза для дорослих та дітей віком від 12 років – 1 саше 1 раз на добу. При резистентності до лікування частини саше слід прожовтувати та з'їсти. **Побічні реакції.** Побічні реакції, що можуть виникати при застосуванні омепразолу, систематизовані за класами органів. Жодне з яких не було визнано дозозалежним. З боку шлунково-кишкового тракту: часті – діарея, запор, біль у животі, нудота, блювання, метеоризм, регургітація кислим вмістом шлунка, рідко – сухість у роті, свербіж, канцерозна шлунково-кишкового тракту, диспепсія, апетиту, інфекційний коліт, пачкваті, інколи з летальним наслідком, анемія, запалення кишкової атрофії слизової оболонки кишечника, нещипний ді. **Умови зберігання.** Зберігати у недоступному для дітей, сухому, захищеному від світла місці при температурі не вище 25 °С. **Категорія відпуску.** Без рецепта. **Виробник.** Д. Редді & С. Лабтораторіс Лід (Виробництво дивізію). **ВЛ.** С. Кооп. Намагар роуд, Бада, округ Солан, Кімал Прадеш, Індія. Відпущається без рецепта. ІА/02/25/03/01. Німа М02B.C01/1 від 15.02.2017. За додатковою інформацією звертатися за адресою: ТОВ «Д. Редді & С. Лабтораторіс», Сполучене Штати, 103-й 11-й, м. Київ, Україна, 02151, тел.: +38044952173. Інформація про лікарський засіб призначена для медичних та фармацевтичних працівників. Перед призначенням ознайомитися з повним текстом інструкції до медичного застосування.

Омін-3-0413.2.2017 (0-1)

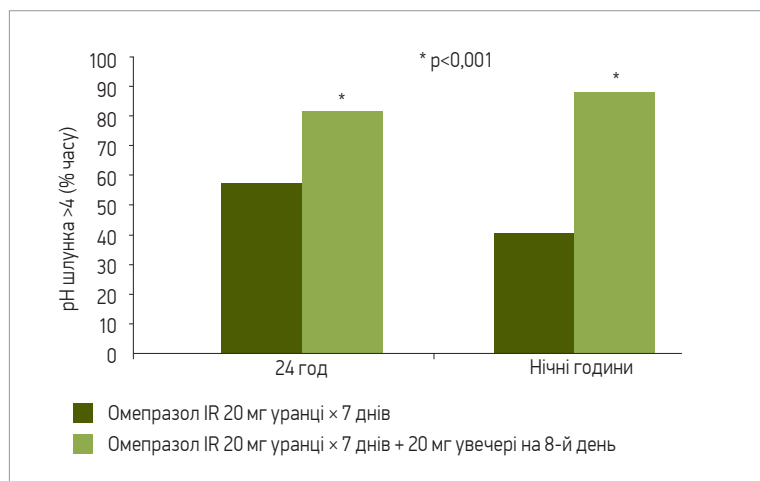


Рис. 1. Вплив додаткової вечірньої дози омепразолу IR 20 мг на добову та нічну кислотність шлунка

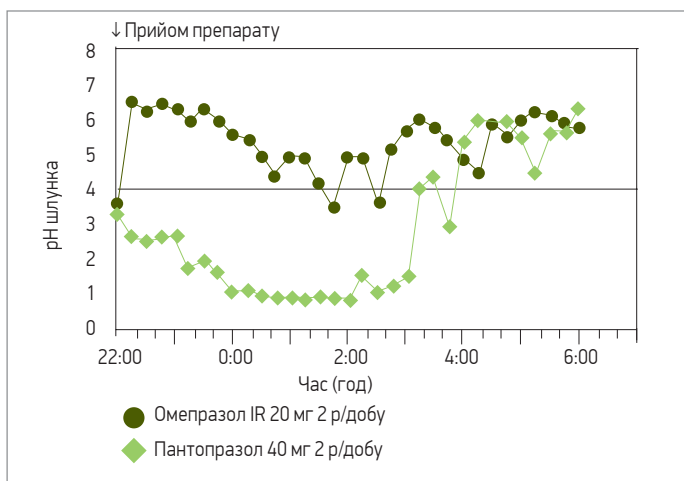


Рис. 2. Середній рН шлунка в нічні години на 7-й день лікування омепразолом IR 20 мг 2 р/добу та пантопразолом 40 мг 2 р/добу

кислотної регургітації – у 72 vs 73% випадків відповідно. Отже, одноразовий прийом омепразолу IR (вранці або ввечері) є ефективним у лікуванні тяжкого рефлюксного езофагіту та зменшенні вираженості симптомів ГЕРХ.

Нещодавно був проведений систематичний огляд рандомізованих досліджень із застосування омепразолу IR у лікуванні ГЕРХ (Higuera-de-la-Tijera F., 2018). Отримані докази переконливо свідчать, що порівняно зі стандартним ІПП DR омепразол IR характеризується значно швидшим початком дії.

Майже 40% пацієнтів з ГЕРХ на тлі прийому звичайних ІПП у режимі 1 р/добу мають кислотні прориви. Як правило, вони спостерігаються в період з 22:00 до 06:00, при цьому внутрішньошлунковий рН знижується

до 4,0 і нижче і зберігається довше 1 год. Нічні кислі симптоми ГЕРХ чинять більш негативний вплив на якість життя, ніж денні. Крім того, нічна печія призводить до розладу сну з подальшим зниженням працездатності. У дослідженні D.I. Castell і співавт. (2005) порівнювали здатність омепразолу IR і DR контролювати нічну шлункову кислотність при дозуванні 1 або 2 рази на добу. Після однократного прийому омепразолу IR 40 мг або пантопразолу 40 мг у 1-й день спостерігалася статистично значима різниця в середній частці часу з рН >4,0 (p=0,017) і середньому рН шлунка (p=0,008) у нічні години на користь омепразолу IR. На 6-й день лікування рівень рН шлунка >4,0 зберігався протягом 54,7 та 26,5% нічного часу для омепразолу IR і пантопразолу відповідно.

При двократному дозуванні на 7-й день омепразол IR 20 мг підтримував рівень рН >4,0 упродовж більшості часу вночі, на відміну від пантопразолу 40 мг (рис. 2). Ці результати свідчать, що омепразол IR забезпечує ефективний контроль шлункової кислотності в нічні години і завдяки цьому дозволяє подолати проблему нічних кислотних проривів у пацієнтів із ГЕРХ, резистентною до лікування звичайними ІПП.

Інші переваги ОмеЗ Інста в лікуванні печії при ГЕРХ

Завдяки швидшим абсорбції та початку кислотосупресивної дії, надійному контролю шлункового рН протягом 24 год омепразол IR (ОмеЗ Інста) можна вважати препаратом вибору для лікування ГЕРХ у режимі «за потребою», а також

використовуватися для терапії печії при ГЕРХ у пацієнтів з нічними кислотними проривами (Минушкин О.Н., Масловский Л.В. Омепразол в терапии кислотозависимых заболеваний. – Медицинский совет, 2015, № 13).

Клінічні переваги омепразолу IR не обмежуються кращими фармакокінетичними й фармакодинамічними показниками. Рідка лікарська форма омепразолу IR є більш зручною у застосуванні, ніж ІПП DR у формі таблеток чи капсул, у пацієнтів із гастропарезом або сповільненим спорожненням шлунка. Крім того, у пацієнтів із гастропарезом відбувається постійна стимуляція секреції кислоти через тривале перебування у шлунку їжі; у таких випадках пролонгований антисекреторний ефект омепразолу IR має додаткову користь.

Іншими групами пацієнтів із ГЕРХ, які можуть отримувати специфічну користь у контролі печії саме від омепразолу IR, є особи із затрудненим ковтанням, а також які не снідають регулярно чи не завжди дотримуються вимоги приймати ІПП DR перед їжею (омепразол IR можна застосовувати незалежно від уживання їжі), хворі, які працюють у нічну зміну або часто подорожують (через проблеми зі своєчасним прийомом ІПП DR), та, як зазначалося вище, пацієнти, котрі бажають використовувати ІПП у режимі «за потребою» для контролю печії при ГЕРХ.

Підготував **Олексій Терещенко**



АНОНС



III науково-практична конференція

WORLD THROMBOSIS DAY:

Тромбопрофілактика в Україні.

Сучасні світові тенденції

11 жовтня, м. Київ

Місце проведення: конференц-хол «ДЕПО» (вул. Антоновича, 52)



Учасники отримують національний та міжнародний сертифікати.

Надається можливість перегляду online.

Реєстрація на сайті: wtd-ukraine.org

АНОНС

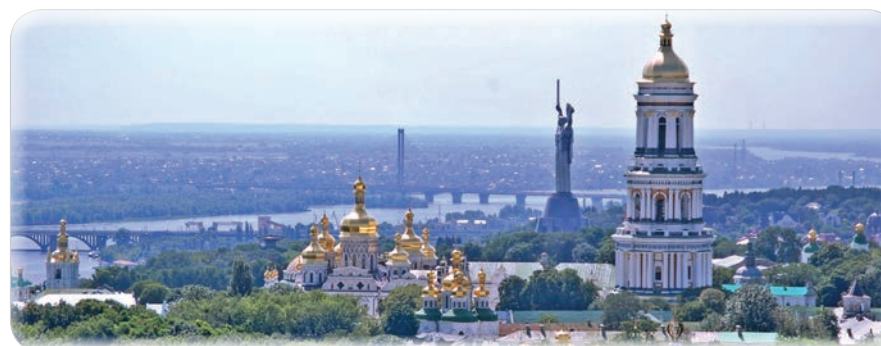
II Міжнародний конгрес

**Рациональне використання
антибіотиків у сучасному світі.
Antibiotic resistance STOP!**



RESISTANCE

15-16 листопада, м. Київ



Захід проводитиметься у рамках Всесвітнього тижня належного застосування антибіотиків.

Детальна інформація на сайті: <http://antibiotic-congress.com>

Контактна інформація

Ірина Хоменко

тел.: (098) 613 33 01

E-mail: Homenko.medexpert@gmail.com

www.med-expert.com.ua

ОМЕЗ

Інста

**Лікує печію
швидко полегшує
симптоми^{*,**}**

24

**один раз
на добу**

**швидкий
ефект***

РИКОШЕТ

**сприяє попередженню
«синдрому рикошету»¹**



*10-30 хв (при прийомі натще за 1 годину до прийому їжі). **спричинену підвищеною кислотністю шлункового соку (гіперацидністю). 1. Эффективность и безопасность ингибитора протонной помпы немедленного высвобождения при гастроэзофагеальной рефлюксной болезни: результаты исследования ИНСТА-ПЕРСПЕКТИВА, В. И. Симаненков, et al., ЛЕЧАЩИЙ ВРАЧ, АВГУСТ 2014, № 8, www.lvrach.ru.

ОМЕЗ ІНСТА. Витяг з інструкції для медичного застосування. Склад: діюча речовина: omeprazole; 1 саше містить омепразолу 20 мг; допоміжні речовини: натрію гідрокарбонат, ксиліт, цукроза, цукралоза, ксантанова камедь, ароматизатор м'ятний. **Лікарська форма.** Порошок для оральної суспензії. **Фармакотерапевтична група:** Засоби для лікування пептичної виразки та гастроэзофагеальної рефлюксної хвороби. Інгібітори протонного насоса. Омепразол. Код АТХ А02В С01. **Показання.** Лікування печії, спричиненої підвищеною кислотністю шлункового соку (гіперацидністю). **Протипоказання.** Підвищена чутливість до омепразолу, заміщених бензimidазолів або до будь-якої з допоміжних речовин. Одночасне застосування з атазанавіром; спадкова непереносимість галактози, дефіцит лактази або синдром мальабсорбції глюкози та галактози; метаболічний алкалоз. Омепразол, як і інші інгібітори протонної помпи, не слід застосовувати одночасно з нелфінавіром. **Спосіб застосування та дози.** Застосовувати внутрішньо за 1 годину до прийому їжі. Вміст саше розчинити у 30 мл води (2 столових ложки). Препарат не слід змішувати з іншими рідинами або з їжею. Суспензію розмішувати та випивати одразу після приготування. У порожню склянку із залишками суспензії долити воду і випити залишки препарату. Рекомендована доза для дорослих та дітей віком від 12 років – 1 саше 1 раз на добу. При резистентності до лікування і частій печії слід проконсультуватися з лікарем. **Побічні реакції.** Побічні реакції, що можуть виникати при застосуванні омепразолу, систематизовані за класами органів. Жодне з явищ не було визнано дозозалежним. З боку шлунково-кишкового тракту: часто – діарея, запор, біль у животі, нудота, блювання, метеоризм, регургітація кислим вмістом шлунка; рідко – сухість у роті, стоматит, кандидоз шлунково-кишкового тракту, відсутність апетиту, мікроскопічний коліт, панкреатит (інколи з летальним наслідком), зміна забарвлення калу, атрофія слизової оболонки язика, інші побічні дії. **Умови зберігання.** Зберігати у недоступному для дітей, сухому, захищеному від світла місці при температурі не вище 25 °С. **Категорія відпуску.** Без рецепта. **Виробник.** Д-р Редді'с Лабораторіс Лтд (Виробнича дільниця - VI), с. Кхол, Налагар роад, Бадді, округ Солан, Хімачал Прадеш, Індія. Відпускається без рецепта. UA/0235/03/01, Наказ МОЗУ №141 від 15.02.2017. За додатковою інформацією звертайтеся за адресою: ТОВ «Др.Редді'с Лабораторіс», Столичне шосе, 103, оф. 11-А, м. Київ, Україна, 03131, тел. +380444923173. Інформація про лікарський засіб призначена для медичних та фармацевтичних працівників. Перед призначенням ознайомтеся з повним текстом інструкції до медичного застосування.