

ИНСТРУКЦИЯ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ПИЛОТРИП КИТ

Торговое название препарата: Пилотрип Кит

Действующее вещество (МНН): Лансопразол, Кларитромицин, Амоксициллина тригидрат

Лекарственная форма: капсулы, капсулы, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Состав:

Состав на одну капсулу (Амоксициллин 500 мг):

активное вещество: Амоксициллина тригидрата эквивалентного амоксициллину 500 мг;

вспомогательные вещества: Тальк очищенный, магния стеарат, твердая желатиновая капсула (Размер 0).

Состав на одну капсулу (Лансопразол 30 мг):

активное вещество: Пеллеты лансопразола (Пеллеты, покрытые кишечнорастворимой оболочкой эквивалентные 30 мг лансопразола)*.

вспомогательные вещества: Твердая желатиновая капсула (Размер 1).

*Пеллеты содержат также Маннитол, Сахарозу, Натрия лаурил сульфат, Динатрия гидроген фосфат, Кальция карбонат, Кроскармеллозу натрия, Повидон К-30, Гидроксипропил метилцеллюлозы фталат (HPMC – Phthalate) HP – 55, Цетиловый спирт, Триацетин, Титана диоксид, Изопропиловый спирт, Ацетон, нейтральные гранулы.

Состав на одну таблетку (Кларитромицин 500 мг):

активное вещество: Кларитромицин.

вспомогательные вещества: Микрокристаллическая целлюлоза, прежелатиновый крахмал*, лактоза, магния стеарат, натрия крахмал гликолят (Тип А), коллоидный титана диоксид, вода очищенная**

*Включен избыток влаги на 10%

*Испаряется во время производства.

Описание:

Капсула Амоксициллина 500 мг: Твердая желатиновая капсула (размер №0), крышечка капсулы серого цвета, а корпус капсулы кремового цвета, на обеих частях нанесена надпись «Square».

Капсула содержит гранулированный порошок от белого до кремово-белого цвета.

Капсула Лансопразола: Твердая желатиновая капсула (размер №1), крышечка капсулы темно-коричневого цвета с надписью «Square» и прозрачный корпус капсулы с надписью «Lanso 30». Капсула содержит сферические пеллеты от белого до почти белого цвета.

Таблетка, покрытая пленочной оболочкой Кларитромицины: Таблетки, покрытые оболочкой светло-голубого цвета в форме капсул с гравировкой «Square» с одной стороны и риской с другой стороны.

Фармакотерапевтическая группа: Комбинация для эрадикации *Helicobacter pylori*.

Код АТХ: A02BD07

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Лансопразол- это ингибитор протонной помпы, который подавляет выработку желудочного сока.

Амоксициллин - антибиотик пенициллина. Он действует, подавляя синтез стенок бактериальных клеток. Он ингибирует поперечные связи между линейными полимерными цепями пептидогликана, которые составляют основной компонент клеточных стенок как грамположительных, так и грамотрицательных бактерий.

Кларитромицин - антибиотик группы макролидов. Он предотвращает рост бактерий, препятствуя их синтезу белка. Он связывается с субъединицей SOS бактериальной рибосомы и, таким образом, ингибирует трансляцию пептидов.

Фармакокинетика

Абсорбция

Амоксициллин полностью диссоциирует в водном растворе при физиологическом pH. Амоксициллин стабилен в кислой секреции желудочного сока и быстро всасывается из желудочно-кишечного тракта после приема внутрь. Биодоступность амоксициллина после перорального приема составляет примерно 70%. Время достижения максимальной концентрации в плазме (T_{max}) составляет примерно один час.

Ниже представлены фармакокинетические результаты исследования, в котором доза амоксициллина 250 мг три раза в день вводилась натошак группам здоровых добровольцев.

C_{max}	T_{max}^*	$AUC_{(0-24h)}$	$T_{1/2}$
($\mu g/ml$)	(h)	($\mu g \cdot h/ml$)	(h)
3.3 ± 1.12	1.5 (1.0-2.0)	26.7 ± 4.56	1.36 ± 0.56
* Среднее значение (диапазон)			

В диапазоне от 250 до 3000 биодоступность пропорциональна дозе (измеряется как C_{max} и AUC). Одновременный прием пищи не влияет на абсорбцию.

Для выведения амоксициллина можно использовать гемодиализ.

Распределение

Около 18% от общего количества амоксициллина в плазме связано с белком, а кажущийся объем распределения составляет от 0,3 до 0,41 / кг.

Исследования на животных не показали значительного удержания в тканях материала, полученного из лекарственного средства. Амоксициллин, как и большинство пенициллинов, может быть обнаружен в грудном молоке.

Амоксициллин проникает через плацентарный барьер.

Биотрансформация

Амоксициллин частично выводится с мочой в виде неактивной пеницилловой кислоты в количествах, эквивалентных от 10 до 25% начальной дозы.

Лансопразол

Поглощение и распределение

Лансопразол демонстрирует высокую (80-90%) биодоступность при однократном приеме. Пиковые уровни в плазме достигаются в течение 1,5–2 часов. Прием пищи снижает скорость всасывания лансопразола и снижает биодоступность примерно на 50%. Связывание с белками плазмы составляет 97%.

Исследования показали, что гранулы из открытых капсул дают эквивалентную AUC , как и неповрежденная капсула, если гранулы суспендированы в небольшом

количестве апельсинового, яблочного или томатного сока, смешанного со столовой ложкой яблочного или грушевого пюре или посыпанного столовой ложкой йогурта, пудинга или творога. Эквивалентная AUC также была показана для гранул, суспендированных в яблочном соке, вводимых через назогастральный зонд.

Биотрансформация и выведение

Лансопризол интенсивно метаболизируется в печени, а метаболиты выводятся как почечным, так и желчным путем. Метаболизм лансопризола в основном катализируется ферментом CYP2C19. Фермент CYP3A4 также способствует метаболизму. Период полувыведения из плазмы колеблется от 1 до 2 часов после однократного или многократного приема у здоровых субъектов. Доказательств накопления после многократных доз у здоровых людей нет. В плазме были обнаружены сульфон, сульфидные и 5-гидроксильные производные лансопризола. Эти метаболиты обладают очень низкой антисекреторной активностью или совсем не обладают ею.

Исследование с лансопризолом, меченным ^{14}C , показало, что примерно одна треть введенного излучения выводится с мочой, а две трети - с фекалиями.

Кларитромицин

H. pylori ассоциирован с кислотной пептической болезнью, включая язву двенадцатиперстной кишки и язву желудка, при которых около 95% и 80% пациентов соответственно инфицированы этим агентом. *H. pylori* также играет важную роль в развитии рецидива язвы и желудка у таких пациентов.

Клинические исследования с использованием различных схем эрадикации *H. pylori* показали, что эрадикация *H. pylori* предотвращает рецидив язвы.

Кларитромицин быстро и хорошо всасывается из желудочно-кишечного тракта после перорального приема таблеток Кларитромицина. Микробиологически активный метаболит 14-гидроксикларитромицин образуется при первом прохождении метаболизма. Кларитромицин можно назначать независимо от приема пищи, поскольку пища не влияет на степень биодоступности таблеток кларитромицина. Пища немного задерживает начало абсорбции кларитромицина и образование 14-гидроксиметаболита.

Фармакокинетика кларитромицина не линейна, тем не менее, равновесное состояние достигается в течение 2 дней после дозирования. 250 мг два раза в день. 15-20% неизмененного препарата выводится с мочой. С 500 мг два раза в день. при суточной дозировке экскреция с мочой больше (примерно 36%). 14-гидроксикларитромицин является основным метаболитом в моче и составляет 10-15% дозы. Большая часть оставшейся дозы выводится с фекалиями, в основном с желчью. 5-10% исходного препарата извлекается с фекалиями.

Кларитромицин обеспечивает концентрацию в тканях, в несколько раз превышающую уровни циркулирующего препарата. Повышенные уровни были обнаружены как в ткани миндалин, так и в легочной ткани. Кларитромицин на 80% связывается с белками плазмы на терапевтических уровнях. Кларитромицин также проникает в слизь желудка.

Показания к применению

Эрадикация *Helicobacter pylori* при:

- язвенной болезни желудка;
- язвенной болезни двенадцатиперстной кишки;
- хроническом гастрите

Способ применения и дозы

Применение препарата Пилотрип Кит, обеспечивает оптимальные дозы лансопразола, амоксициллина и кларитромицина для успешной эрадикации *Helicobacter pylori*. Принимают по 30 мг Лансопразола (1 капсула), 1000 мг Амоксициллина (2 капсулы) и 500 мг Кларитромицина (1 таблетка) два раза в день - утром и вечером. Один блистер два раза в день, в течение 7-14 дней или по рекомендации врача.

Препараты принимаются вместе в один прием, перед едой.

Суточная доза: 60мг Лансопразола, 2000мг Амоксициллина, 1000мг Кларитромицина.

Пилотрип Кит назначается взрослым и детям старше 12 лет с массой тела более 40 кг.

У пациентов с активной язвой, следует рассмотреть вопрос о продолжении монотерапии ингибиторами протонной помпы после проведения эрадикации *Helicobacter pylori*.

Побочные действия

Основные клинические побочные реакции.

Сообщалось о серьезных и иногда фатальных реакциях гиперчувствительности (анафилактоидных) у пациентов, принимающих амоксициллин. Эти реакции чаще возникают у людей с гиперчувствительностью к пенициллину в анамнезе. Кларитромицин не следует применять беременным женщинам, за исключением клинических обстоятельств, когда альтернативная терапия не подходит.

Побочные реакции, о которых сообщалось как возможно или вероятно связанных с лечением (> 3%) в клинических испытаниях при одновременном назначении всех трех компонентов этой терапии, перечислены ниже и разделены по системам организма. Пищеварительная система: тошнота, рвота, диарея, темный стул, сухость во рту, глоссит, монилиоз полости рта, стоматит, изменение цвета языка; Костно-мышечная система - миалгия; Нервная система - спутанность сознания, головная боль, головокружение; Кожно-аллергические реакции; Мочеполовая система - вагинит, вагинальный монилиаз.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к лансопразолу, кларитромицину и другим макролидным антибиотикам, амоксициллину, пенициллину или другим бета-лактамам антибиотикам (пенициллины, карбапенемы, цефалоспорины или монобактамы); любому из вспомогательных компонентов.

Пилотрип Кит, не следует применять пациентам с выраженными нарушениями функции печени или почек, в связи с тем, что в настоящее время накоплено недостаточно клинических данных об эффективности и безопасности использования комбинаций лансопразола, амоксициллина и кларитромицина у таких пациентов.

Лекарственные взаимодействия

Лансопразол метаболизируется через систему цитохрома P450, в большей степени особенно через изоферменты CYP3A и CYP2C19. Исследования на здоровых людях показали, что лансопразол не имеет клинически значимых взаимодействий с другими лекарствами, метаболизируемыми системой цитохрома P450, такими как варфарин, антипирин, индометацин, ибупрофен, фенитоин, пропранолол, преднизолон,

диазепам, кларитромицин или терфенадин.

Применение кларитромицина у пациентов, получающих теофиллин, может быть связано с увеличением концентрации теофиллина в сыворотке крови.

Сообщалось о взаимодействии эритромицина и/или кларитромицина с карбамазепином, циклоспорином, такролимусом, гексобарбиталом, фенитоином, альфетанилом, дизопирамидом, ловастатином, бромокриптином, вальпроатом, терфенадином, цизапридом, пимизолидом и пимозидом.

Амоксициллин может уменьшать эффективность контрацептивов для приема внутрь. При одновременном применении амоксициллина с бактерицидными антибиотиками (в т.ч. аминогликозидами, цефалоспоридами, циклосерином, ванкомицином, рифампицином) проявляется синергизм; с бактериостатическими антибиотиками (в т.ч. макролидами, хлорамфениколом, линкозамидами, тетрациклинами, сульфаниламидами) - антагонизм.

Амоксициллин усиливает действие непрямых антикоагулянтов подавляя кишечную микрофлору, снижает синтез витамина К и протромбиновый индекс.

Амоксициллин уменьшает действие лекарственных средств, в процессе метаболизма которых образуется ПАБК.

Пробенецид, диуретики, аллопуринол, фенилбутазон, НПВС уменьшают канальцевую секрецию амоксициллина, что может сопровождаться увеличением его концентрации в плазме крови.

Антациды, глюкозамин, слабительные средства, аминогликозиды замедляют и уменьшают, а аскорбиновая кислота повышает абсорбцию амоксициллина.

Особые указания

Применение у детей и подростков. Назначение препарата Пилотрип Кит не рекомендуется детям в возрасте до 12 лет и массой тела менее 40 кг.

Лансопразол: при применении ингибиторов протонной помпы следует помнить о возможности развития суперинфекций грибковой и бактериальной природы, вследствие снижения кислотности желудочного сока. При развитии суперинфекций следует отменить Пилотрип Кит и назначить соответствующую патогенетическую терапию.

Амоксициллин: Во время введения высоких доз амоксициллина важно поддерживать адекватное потребление жидкости и мочевыделение, чтобы уменьшить вероятность возникновения кристаллурии. У больных с катетером в мочевом пузыре необходимо регулярно проверять проходимость катетера.

Кларитромицин: из-за возможности возникновения перекрестной резистентности возбудителей к кларитромицину и другим макролидным антибиотикам (эритромицину, линкомицину, клиндамицину), совместное назначение нескольких препаратов этой группы не рекомендуется.

Следует с осторожностью принимать кларитромицин совместно с триазоловыми бензодиазепинами (триазоламом, мидазоламом). Следует с осторожностью назначать кларитромицин одновременно с ингибиторами ГМГ-КоА-редуктазы (статины) - ловастатином или симвастатином - в связи с риском развития рабдомиолиза. Такие пациенты должны наблюдаться на предмет проявления признаков миопатии.

В случае развития диареи на фоне приема антибактериальных препаратов, следует оценить состояние пациента с точки зрения возможного риска развития псевдомембранозного колита

При возникновении острых реакций гиперчувствительности (анафилаксия, синдром Стивена-Джонсона, эпидермальный некролиз, геморрагический васкулит) следует незамедлительно прекратить прием препарата Пилотрип®, и принять меры по купированию аллергической реакции.

Применение во время беременности и кормления грудью

Применение препарата Пилотрип Кит в период беременности и кормления грудью не рекомендуется.

Влияние на способность управлять автомобилем и сложными механизмами

Исследования влияния на способность управлять автомобилем и машинами не проводились. Однако могут возникнуть нежелательные эффекты (например, аллергические реакции, головокружение, судороги), которые могут повлиять на способность управлять автомобилем и работать с механизмами.

Передозировка

Симптомы крайне редко: тошнота, рвота, диарея, абдоминальные боли, головокружение, нарушение водноэлектролитного баланса как следствие тошноты и рвоты. При длительном применении в высоких дозах - нейротоксические реакции и тромбоцитопения (исчезают после отмены препарата).

Лечение: промывание желудка, назначение активированного угля солевых слабительных, коррекция водно-электролитного баланса, адекватный прием жидкости и поддержание диуреза (для снижения риска кристаллурии).

Форма выпуска

Каждый блистер состоит из: 1 капсула «Лансопразола», 1 таблетка, покрытая оболочкой «Кларитромицина» и 2 капсулы «Амоксициллина».

14 блистеров вместе с инструкцией по медицинскому применению в пачку из картона.

Условия хранения

Хранить в сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 30°C

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не следует применять после истечения срока годности.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Производитель

SQUARE Pharmaceuticals Limited,
Пабна, Бангладеш.

Наименование и адрес организации, принимающей претензии (предложения) по качеству лекарственных средств на территории Республики Узбекистан

ООО «Нео-фарм»

Республика Узбекистан, 100179, г. Ташкент, Алмазарский р-н, Массив Чимбай 5 А.

Тел.: +99871 229 27 09.