

Состав и форма выпуска

Порошок для приготовления оральной суспензии.

1 пакетик с порошком содержит холестирамин резина 4 г.

Вспомогательные вещества: сахароза, лимонная кислота, кремния диоксид коллоидный, краситель желтый закат FCF (E 110), краситель D & C желтый № 10 (хинолин желтый E 104), краситель D & C желтый № 10 алюминиевый лаковый 15% (хинолин желтый E 104), пропиленгликоль альгинат, ароматизатор апельсиновый, что содержит ароматизатор апельсиновый, мальтодекстрин, акация (гуммиарабик E 414), бутилгидрокситолуол (E 321).

Фармакологическое действие

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

Фармакокинетика

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

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

В результате потери значительного количества желчных кислот с калом при приеме холестирамина происходит усиленное окисление холестерина с образованием желчных кислот, при этом отмечается снижение содержания бета-липопротеидов или липопротеидов 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 к применению

Холестирамин показан как средство адъювантной терапии (как дополнение к диете и физических упражнений) для снижения повышенного содержания холестерина в сыворотке

больных с первичной гиперхолестеринемией с целью уменьшения риска атеросклеротических поражений коронарных артерий и инфаркта миокарда.

Холестирамин можно применять как средство для снижения повышенного содержания холестерина у больных 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 вовсе 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 желчных кислот, но и в других анионов. Сложно априорно предсказать, будет оказывать влияние применение холестирамина на поглощение из кишечника тех или иных лекарственных средств. Потенциально необходимо рассматривать возможность такого взаимодействия лекарственных препаратов с холестирамином, если только отсутствие такого взаимодействия не доказана клиническими исследованиями.

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

Проведенные исследования по взаимодействию холестирамина и различных ингибиторов HMG-CoA редуктазы. Хотя холестирамин понижает биодоступность этих ингибиторов, клинические эффекты в отношении снижения содержания холестерина при применении ингибиторов HMG-CoA редуктазы и холестирамина 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 холестирамина и не ранее 4-6 часов (а лучше еще позже) после приема холестирамина.

Особенности применения

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

Прежде чем начать лечение холестирамином, 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 заболевания печени, которые могут быть причиной гиперхолестеринемии. Необходимо также проверить, не приводит применение других лекарств к увеличению содержания холестерина липопротеидов низкой плотности. При применении холестирамина 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 холестирамина в виде хлорида может привести к гиперхлоремической ацидоза, что особенно вероятно у лиц молодого возраста, где относительная доза препарата будет выше.

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

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

Влияние на усвоение витаминов: поскольку холестирамин связывает желчные кислоты, он может препятствовать усвоению в кишечнике жирорастворимых витаминов А, D и К.

При длительном применении холестирамина необходимо использовать парентеральные формы смеси витаминов А и D.

Недостаток витамина К, который развивается при длительном применении холестирамина, может приводить к гипопротромбинемии и повышенного риска возникновения кровотечений. При развитии таких явлений необходимо применять парентеральные формы витамина К1, предупреждение рецидивов возможно и при пероральном применении витамина К1.

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

Лабораторные исследования. В первые месяцы применения холестирамина требуется регулярный контроль содержания холестерина в сыворотке крови. Периодический контроль необходим и в дальнейшем. Периодически необходимо контролировать содержание триглицеридов в сыворотке крови.

Дети. Не проводились специальные клинические исследования по изучению безопасности и эффективности применения холестирамина у детей.

Применение у лиц старше 65 лет. Адекватных исследований по эффективности холестирамина у лиц разного возраста не проведено. Однако у пожилых людей побочные явления со стороны ЖКТ более вероятны.

Влияние на способность управлять автотранспортом или другими механизмами. Данных нет.

Способ применения и дозы

Холестирамин применять перорально.

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

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

Рекомендуемая доза для взрослых составляет 4 г холестирамина от 1 до 6 раз в сутки. Дозировку можно изменить, чтобы больше соответствовать индивидуальным потребностям больного.

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

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

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

Дети

Безопасность и эффективность применения колестирамина детям не установлены.

Побочные действия

Зачастую при применении холестирамина отмечаются запоры, особенно при высокой дозе препарата и у пожилых людей (старше 60 лет). В большинстве случаев эти побочные явления снимаются общепринятой в таких случаях терапией. В отдельных случаях может потребоваться временное снижение дозы или отмене препарата.

Реже встречаются такие побочные явления, как ощущение растяжения желудка, метеоризм, вздутие живота, тошнота, рвота, диарея, анорексия, изжога, сыпь на коже, раздражение кожи, языка, перианальной зоны, повышенная кровоточивость вследствие недостатка витамина К, ухудшение зрения в темноте результате недостатка витамина А, гиперхлоремический ацидоз у детей, остеопороз, проявления недостатка витамина D.

Иногда наблюдается наличие зневапненого материала в желчных путях, 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 ободочной кишке обнаруживали наличие пастообразной массы.

Наблюдались и другие побочные реакции, не все из них могут быть обусловлены непосредственно приемом холестирамина. Это желудочно-кишечные и ректальные кровотечения, темный кал, геморроидальные кровотечения, кровотечения язвы двенадцатиперстной кишки, дисфагия, икота, отрыжка, обострение приступов язвы, ощущение кислого привкуса, обострение панкреатита, дивертикулит.

Изменения лабораторных показателей: нарушение функции печени.

Гематологические изменения: изменения величины протромбинового времени (снижение или увеличение), носовые кровотечения, анемия, кровотечения десен.

Изменения со стороны опорно-двигательного аппарата: боль в спине, мышцах, суставах, артрит.

Неврологические изменения: головная боль, головокружение, тревожные состояния, утомляемость, шум в ушах, потеря сознания, сонливость, парестезии.

Изменения со стороны почек: гематурия, дизурия, изменение запаха мочи, диурез.

Изменения со стороны органов зрения: увеит.

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

Другие изменения: снижение или увеличение веса тела, повышение либидо, отек, кариес.

Передозировка

Один случай передозировки был описан у больного, принимал препарат в течение нескольких недель в дозе, составляла 150% от максимальной рекомендуемой суточной дозы. Никаких существенных явлений при этом отмечено не было. Основным последствием при передозировке может быть нарушение проходимости желудочно-кишечного тракта. Наличием такой непроходимости, степенью ее выраженности и определяется необходимая симптоматическая терапия.

Условия хранения

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

Срок годности

3 года.

Условия продажи

По рецепту.