



Новое в терапии гастроэзофагеальной рефлюксной болезни

Существующие российские и зарубежные рекомендации по лечению гастроэзофагеальной рефлюксной болезни (ГЭРБ) отводят центральную роль ингибиторам протонной помпы (ИПП), как наиболее эффективным и безопасным средствам. Вместе с тем, и при лечении препаратами этой группы возникают определенные проблемы, такие как недостаточная скорость купирования симптомов, сохранение симптомов на фоне непрерывной терапии, резистентная к терапии ночная симптоматика, резко ухудшающая качество жизни пациентов.

Ингибиторы протонной помпы: вспоминаем механизмы действия

Все доступные ИПП (омепразол, рабепразол, пантопразол, лансопразол, эзомепразол) нестабильны в кислой среде и защищены от действия соляной кислоты кишечнорастворимой оболочкой для предотвращения их разрушения. Они всасываются в тонкой кишке и переносятся с кровью в париетальные клетки желудка, где превращаются в активную форму и блокируют действующие протонные помпы. Поступление ИПП в протонные помпы возможно при определенной концентрации препарата в крови. Интервал времени достижения максимальной концентрации ИПП в крови составляет от 1 до 6 ч. Плазменные концентрации снижаются ниже уровня, при котором препарат поступает в протонную помпу через 4–10 ч после его приема. Париетальные клетки, которые начали функционировать через 4–10 ч после приема ИПП, остаются не заблокированными, так как концентрация препарата в плазме падает ниже терапевтического порога и кислотная продукция восстанавливается.

Блокированные протонные помпы не замещаются в течение 3–4 дней, что приводит к развитию макси-

Мгновенная нейтрализация кислоты в желудке гидрокарбонатом натрия защищает омепразол от разрушения...

мального действия ИПП на 3–5 день лечения. При однократном утреннем приеме все традиционные ИПП наиболее эффективно блокируют дневную секрецию соляной кислоты, в ночное время кислотная продукция частично восстанавливается и развивается так называемый «ночной кислотный прорыв».

ИПП, покрытые кислотозащитной кишечнорастворимой оболочкой, называются препаратами замедленного высвобождения, так как абсорбция препаратов начинается только после растворения защитной

оболочки, что занимает определенное время. В связи с тем, что ИПП требуют активации протонных помп для максимального антисекреторного эффекта, их назначают за 15–60 мин до приема пищи. Представленные данные позволяют отметить определенные издержки традиционных ИПП: отсутствие быстрого начала действия, необходимость приема пищи после употребления препарата, возникновение ночного кислотного прорыва при использовании стандартных доз ИПП.

Решение проблемы: защищенный быстродействующий омепразол

В июле 2011 г. появился и стал доступен для практического использования пока единственный в России быстродействующий омепразол – ОМЭЗ® Инста (Д-р Редди'с Лабораторис Лтд.). Препарат выпускается в форме порошка для приготовления суспензии и содержит 20 мг омепразола и 1680 мг гидрокарбоната натрия. Мгновенная нейтрализация кислоты в желудке гидрокарбонатом натрия защищает омепразол от разрушения и позволяет не заключать его в кишечнорастворимую оболочку и использовать в виде порошка. Это приводит к существенному возрастанию скорости всасывания омепразола. Пиковые концентрации в плазме возникают в среднем через 30 мин (от 10 до 90 мин). Быстрое повышение рН желудка под действием гидрокарбоната натрия стимулирует выработку гастрина, который, в свою очередь, активирует работу протонных помп париетальных клеток желудка и делает их восприимчивыми к действию омепразола. При этом необходимость принимать препарат перед едой отпадает. Следует отметить, что уровень кислотности при использовании препарата ОМЭЗ® Инста снижается уже в первые минуты после приема препарата, что связано с нейтрализацией кислоты гидрокарбонатом натрия, после чего развивается кислотоблокирующий эффект омепразола.

Доказанная эффективность

Фармакодинамические исследования, выполненные на здоровых добровольцах, показали, что процент снижения кислотной продукции при использовании дозы быстродействующего омепразола 20 мг и 40 мг составил 82% и 84%, сред-

...уровень кислотности при использовании препарата ОМЭЗ® Инста снижается уже в первые минуты после приема...

нее время с рН >4 – 12,2 и 18,6 ч, средний рН 4,2 и 5,2 соответственно. В рандомизированном открытом перекрестном испытании однократный ежедневный прием 40 мг быстродействующего омепразола обеспечивал достоверно более полный контроль желудочного рН в ночное время по сравнению с 40 мг пантопразола замедленного высвобождения, даже при использовании последнего 2 раза в сутки. Пантопразол был выбран в качестве препарата сравнения в связи с тем, что именно этот препарат рекомендуется FDA для купирования приступов ночной изжоги. Средние значения рН в ночное время составили 4,7 для 40 мг быстродействующего омепразола и 2,0 и 1,7 для 40 мг пантопразола, применяемого 1 и 2 раза в день соответственно.

Сравнение эффективности быстродействующего омепразола и омепразола замедленного высвобождения в режиме по требованию у больных с симптоматической неэрозивной рефлюксной болезнью показало 83% пациентов в 2 раза более быстрое купирование изжоги при использовании быстродействующего омепразола. Эти данные свидетельствуют о том, что быстродействующий омепразол может быть препаратом выбора при лечении ГЭРБ в режиме «по требованию». Высокая скорость наступления эффекта быстродействующего омепразола позволяет оптимизировать лечение и эрозивной формы ГЭРБ, так как даже при использовании одного из наиболее мощных ИПП – эзомепразола, до полного исчезновения изжоги в среднем проходит 5 дней, при лечении другими ИПП замедленного высвобождения – 8–9 дней; более половины пациентов в первые дни после их назначе-

ния продолжают страдать от изжоги даже при использовании самых современных ИПП в дозе не менее 40 мг. В этой ситуации назначение препарата ОМЭЗ® Инста в первые 5 дней лечения позволит достичь быстрого эффекта, после чего пациент может получать традиционные

ИПП замедленного высвобождения.

Борьбе с ночной симптоматикой

Еще одной проблемой, возникающей при лечении ГЭРБ, является предотвращение эпизодов ночной симптоматики (изжоги, внепищеводных проявлений). Было показано, что гастроэзофагеальные рефлюксы индуцируют многократные пробуждения, сокращающие продолжительность физиологического сна. При этом низкое качество сна, вызванное ночной изжогой, обуславливает развитие дневной сонливости и раздражительности, снижение дневной активности, появление усталости, расстройства внимания. Особое значение ночные кислотные прорывы имеют у пациентов с тяжелыми формами эрозивной эзофагии и пищеводом Барретта. Было показано, что около 50% таких больных имеют продолжительные эпизоды закисления пищевода в ночное время при лечении двойными дозами ИПП замедленного высвобождения даже при отсутствии развития симптомов. В этой ситуации добавление H₂-блокаторов (ранитидин 150–300 мг на ночь) к терапии ИПП позволяло контролировать ночную секрецию соляной кислоты в первые дни приема, однако через 1–4 нед развивалась толерантность к действию блокаторов рецепторов гистамина. Приведенные выше данные свидетельствуют об эффективности применения быстродействующего омепразола у больных с ночным кислотным прорывом.

Л.В.Масловский, О.Н.Минушкин
Кафедра гастроэнтерологии ФГБУ
«Учебно-научный медицинский
центр» Управления делами
Президента РФ



Быстродействующий омепразол (ОМЭЗ® Инста) обладает рядом преимуществ по сравнению с ИПП замедленного высвобождения.

- Быстрое создание высоких концентраций препарата в плазме.
- Антацид стимулирует протонные помпы и усиливает действие препарата.
- Быстрое начало действия антацида сменяется быстрым действием омепразола.
- ОМЭЗ® Инста может использоваться через назогастральный зонд, при расстройствах глотания.
- ОМЭЗ® Инста может приниматься независимо от приема пищи.
- ОМЭЗ® Инста может использоваться при «ночных кислотных прорывах».
- ОМЭЗ® Инста может эффективно использоваться в режиме «по требованию».