

ІНСТРУКЦІЯ для медичного застосування препарату ОМЕПРАЗОЛ (OMEPRAZOL)

Склад:

діюча речовина: omeprazole;

1 флакон містить омепразол натрію, еквівалентно омепразолу 40 мг;

допоміжні речовини: натрію карбонат безводний.

Лікарська форма. Порошок ліофілізований для приготування розчину для ін'єкцій.

Фармакотерапевтична група.

Засоби для лікування пептичної виразки та гастроезофагеальної рефлюксної хвороби. Інгібітори «протонного насоса». Омепразол. Код АТС А02В С01.

Клінічні характеристики.

Показання.

Рекомендується застосовувати при лікуванні пацієнтів, які не можуть приймати капсули, і/або тяжкохворих пацієнтів у випадку наступних захворювань:

- виразка шлунка і дванадцятипалої кишки;
- рефлюкс-езофагіт;
- синдром Золлінгера-Еллісона.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до активної речовини або до будь-якого неактивного компонента препарату; одночасне застосування з атазанавіром; дитячий вік; вагітність або період годування груддю.

Спосіб застосування та дози.

Пацієнтам, які не можуть приймати омепразол перорально, і/або тяжкохворим рекомендується внутрішньовенна ін'єкція/інфузія Омепразолу у дозі 40 мг. Звичайний курс лікування до переходу на пероральні засоби становить 2-3 дні.

Пацієнтам із синдромом Золлінгера-Еллісона дозу підбирають індивідуально. Може виникнути потреба у підвищенні добової дози або збільшенні кількості введень.

Препарат повинен застосовуватись лише внутрішньовенно і не може вводитись будь-яким іншим шляхом.

Розчин необхідно використати одразу після приготування, але не пізніше ніж через 3 години. Розведений розчин Омепразолу не можна зберігати у холодильнику. Невикористаний розчин слід знищити.

При внутрішньовенних ін'єкціях кожний окремий флакон з дозою, що містить ліофілізований порошок омепразолу 40 мг, слід розчиняти в 10 мл стерильної води для ін'єкцій. Засіб у вигляді внутрішньовенної ін'єкції слід вводити повільно (протягом 5 хвилин).

При внутрішньовенних інфузіях окремий флакон з дозою слід розчиняти в 100 мл 0,9 % розчину натрію хлориду або в 100 мл 5 % розчину глюкози. Інші розчини використовувати не рекомендується. Препарат у вигляді внутрішньовенної інфузії вводять протягом 20-30 хвилин.

Пацієнти з порушеннями функції печінки. У пацієнтів з печінковою недостатністю період напіввиведення препарату значно подовжується. Можливе зменшення добової дози омепразолу до 20 мг.

Пацієнти з порушеннями функції нирок. Для пацієнтів з порушеннями функції нирок немає необхідності в корегуванні дози.

Пацієнти літнього віку. Для пацієнтів літнього віку немає необхідності в корегуванні дози.

Діти. Ефективність і безпечність застосування препарату Омепразол, порошок ліофілізований для приготування розчину для ін'єкцій, при лікуванні дітей не встановлені, тому препарат не рекомендований дітям.

Побічні реакції.

При застосуванні препарату протягом короткого періоду небажані ефекти виникають рідко і зазвичай бувають слабкими і тимчасовими. Вони частіше спостерігаються на початку лікування. Тяжкі небажані ефекти спостерігаються дуже рідко.

Під час прийому Омепразолу найчастіше спостерігались небажані ефекти:

З боку травного тракту: діарея, запор, абдомінальний біль, нудота, метеоризм і блювання. Як правило, ці побічні реакції не вимагали припинення лікування.

Алергічні реакції: висипання, свербіж та кропив'янка, які зазвичай зникали після припинення прийому Омепразолу.

З боку центральної нервової системи: головний біль.

Менш поширені побічні ефекти:

З боку травного тракту: сухість у роті, порушення смакових відчуттів, стоматит, кандидоз, зміни у результатах тестів функції печінки (рідко – помітне підвищення їх значень), поодинокі випадки клінічних проявів енцефалопатії у пацієнтів з тяжким захворюванням печінки, гепатит із жовтяницею або без неї, печінкова недостатність.

З боку центральної нервової системи та психіки: головний біль, підвищене потовиділення, вертиго, слабкість, агресія, депресія, сонливість, галюцинації, оборотна сплутаність свідомості, переднепритомний стан, порушення сну, збудження, запаморочення, парестезія.

З боку системи кровотворення: поодинокі випадки панцитопенії, лейкопенії, агранулоцитозу, тромбоцитопенії.

З боку сечовидільної системи: інтерстиціальний нефрит, ниркова недостатність.

З боку серцево-судинної системи: периферичний набряк.

Алергічні реакції: реакції гіперчутливості (ангіоневротичний набряк, гарячка, дуже рідко – анафілактичний шок).

Дерматологічні реакції: фотосенсибілізація, випадання волосся, мультиформна еритема, дерматит.

В окремих випадках спостерігались такі тяжкі явища, як токсичний епідермальний некроліз і синдром Стівенса-Джонсона, але причинно-наслідковий зв'язок цих реакцій із застосуванням омепразолу не виявлений.

Ендокринні розлади: гінекомастія.

З боку дихальної системи: бронхоспазм.

З боку опорно-рухового апарату: міалгія, артралгія, слабкість м'язів.

Інші: нечіткість зору, гіпонатріємія, нездужання, гарячка. У тяжкохворих пацієнтів у поодиноких випадках після внутрішньовенного введення високих доз омепразолу відзначались необоротні порушення зору. Однак причинно-наслідковий зв'язок такої реакції із застосуванням омепразолу не встановлений.

Передозування.

Симптоми: апатія, головний біль, тахікардія, нудота, блювання, метеоризм, діарея.

Лікування: симптоматична терапія.

Специфічного антидоту не існує.

Омепразол зв'язується з білками плазми крові, в результаті чого погано виводиться при діалізі.

Внутрішньовенна доза більше 270 мг один раз на добу і 650 мг протягом трьох днів при проведенні клінічних досліджень не виявили ознак передозування.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Ефективність та безпека застосування препарату Омепразол у вагітних не встановлені, тому його не рекомендується призначати у період вагітності.

Омепразол виділяється у грудне молоко, але його вплив на дитину невідомий, тому не рекомендується застосовувати препарат у період годування груддю.

Діти.

Ефективність і безпека застосування Омепразолу у дітей не встановлені, тому не слід призначати препарат цій категорії пацієнтів.

Особливості застосування.

Перед початком терапії необхідно виключити наявність злоякісного процесу (особливо у пацієнтів з виразкою шлунка), оскільки лікування препаратом може маскувати симптоматику і подовжити термін встановлення правильного діагнозу.

Лікування хворих літнього віку і пацієнтів з порушеннями функції нирок не потребує спеціального підбору доз.

Для пацієнтів з порушеною функцією печінки може бути необхідне зниження дози, оскільки омепразол метаболізується в печінці, і час його виведення у таких пацієнтів більш тривалий. Для пацієнтів з тяжкими захворюваннями печінки рекомендована добова доза становить не більше 20 мг.

Тривале зменшення кислотності шлункового соку може призвести до збільшення кількості бактерій, присутніх у шлунково-кишковому тракті і тим самим дещо підвищити ризик виникнення інфекцій травного тракту, спричинених *Salmonella* та *Campylobacter*.

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

Малоймовірно, що препарат впливає на здатність керувати автомобілем або працювати з іншими механізмами.

Враховуючи те, що в чутливих хворих при застосуванні препарату можуть виникнути побічні реакції (запаморочення, сонливість, галюцинації, оборотна сплутаність свідомості тощо), таким пацієнтам на час прийому препарату слід утриматися від керування

автотранспортом або роботи з іншими механізмами, що потребують концентрації уваги.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Вплив омепразолу на фармакокінетику інших лікарських засобів.

Внаслідок глибокого і довготривалого гальмування секреції шлункової кислоти в результаті прийому омепразолу, теоретично можливо, що омепразол може заважати абсорбції препаратів, для яких значення рН шлункового соку є важливим визначним фактором їх біодоступності. Тому слід уникати одночасного застосування Омепразолу, ліофілізованого порошку для приготування розчину для ін'єкцій, з кетоконазолом, ітраконазолом, складними ефірами ампіциліну та солями заліза.

Омепразол пригнічує фермент CYP2C19 і тому є можливим підвищення концентрації в плазмі лікарських засобів, які метаболізуються цим ферментом (діазепаму, варфарину, фенітоїну). Слід контролювати концентрацію цих препаратів в плазмі або протромбінове число при застосуванні антикоагулянту варфарин і розглядати можливість зменшення дози таких препаратів при їх одночасному застосуванні з Омепразолом.

При одночасному застосуванні кларитроміцину або еритроміцину з омепразолом концентрації останнього у плазмі збільшувалися. Концентрації омепразолу у плазмі не змінювалися при застосуванні його з амоксициліном або метронідазолом.

Одночасне застосування омепразолу з атазанавіром призводить до суттєвого зниження впливу останнього. Тому не слід застосовувати їх одночасно.

Застосування омепразолу разом з такролімусом може призвести до підвищення концентрації такролімусу в сироватці. Рекомендується спостерігати за рівнем такролімусу в плазмі пацієнта на початку та/або

після завершення лікування омепразолом у разі їх одночасного прийому.

Можлива взаємодія з ліками, які метаболізуються в печінці за допомогою ферментної системи цитохрому P450: може підвищитись концентрація в плазмі ніфедипіну, амінопирину і дисульфіраму. Необхідно корегувати дозування цих препаратів.

При одночасному застосуванні з омепразолом ефективність преднізолону та циклоспорину може зменшитись. Необхідно корегувати дозування цих препаратів.

Вплив інших лікарських засобів на фармакокінетику омепразолу

Лікарські засоби, що пригнічують ферменти CYP2C19 та CYP3A (інгібітори ВІЛ-протеази, кетоконазол, ітраконазол), можуть підвищити концентрації омепразолу у плазмі крові.

Омепразол не впливає на інші релевантні ізоформи ферменту CYP: відмічалась відсутність метаболічної взаємодії омепразолу із субстратами ферменту CYP1A2 (кофеїн, фенацетин, теофілін), CYP2C9 (S-варфарин, піроксикам, диклофенак, напроксен), CYP2D6 (метопролол, пропранолол) CYP2E1 (етанол) і CYP3A (циклоспорин, лідокаїн, хінідин, естрадіол, будесонід).

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Омепразол контролює кислотну секрецію шляхом пригнічення шлункової H⁺/K⁺-АТФази («протонного насоса»), ензиму, який відповідає за кінцеву стадію в секреції соляної кислоти парієтальними клітинами шлунка. Це забезпечує ефективне пригнічення як базальної, так і стимульованої секреції незалежно від природи збудника. Препарат не впливає на ацетилхолінові або гістамінові рецептори. Для швидкого ефекту і зворотного регулювання секреції соляної кислоти достатньо призначення препарату 1 раз на добу, що приводить до швидкого зниження кислотності шлункового вмісту приблизно на 90 % тривалістю понад 24 години.

Окрім дії на кислотність шлунка, омепразол зменшує загальний об'єм шлункового соку і гальмує виробництво пепсину.

Фармакокінетика. Після внутрішньовенного введення омепразолу початок антисекреторної дії настає протягом однієї години, з максимальною дією, яка настає протягом двох годин. Разова внутрішньовенна доза омепразолу 40 мг чинить аналогічну дію на кислотність шлунка протягом 24 годин, як і повторні пероральні дози 20 мг на день.

Незважаючи на те, що період напіврозпаду омепразолу дуже короткий (близько 50 хвилин), антисекреторна дія триває довше за рахунок зв'язування з ферментом Н⁺/К⁺-АТФази. Після припинення застосування препарату секреторна діяльність відновлюється поступово, протягом 3-5 днів. Інгібіторна дія омепразолу на базальну секрецію є дозозалежною і збільшується при повторному щоденному введенні, досягаючи рівноваги після чотирьох днів.

Видимий обсяг розподілу омепразолу у здорових добровольців і в пацієнтів з нирковою недостатністю майже однаковий. Обсяг розподілу знижений у пацієнтів літнього віку з печінковою недостатністю. Зв'язування омепразолу з білками плазми становить близько 95 %. Середній період напіврозпаду омепразолу становить приблизно 40 хвилин. Омепразол майже повністю метаболізується через систему цитохром Р450 в печінці. Не було повідомлень, що будь-який метаболіт чинить дію на секрецію шлункової залози. Майже 80 % дози омепразолу, який застосовується внутрішньовенно, виводиться у вигляді метаболітів із сечею і залишкова частина – з калом.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості: порошок ліофілізований від білого до світлого жовтого кольору, без видимих включень.

Несумісність. Не застосовувати розчинники, які не вказані в розділі «Спосіб застосування та дози».

Термін придатності. 2 роки.

Умови зберігання.

Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С.

Зберігати в недоступному для дітей місці.

Упаковка.

Лікарський засіб вміщують у флакони з темного скла, закупорені гумовою пробкою та алюмінієвим обтискним ковпачком, спорядженим кришкою фліп-оф, що забезпечує контроль першого відкриття.

По 1 флакону разом з інструкцією для медичного застосування вміщують у пачку з картону для споживчої тари.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник.

Напрод Лайф Саєнсес Пвт.Лтд.

Місцезнаходження.

Джі-17/1, Ем.Ай.Ді.Сі., Тарапур, Бойсар, Діст-Тейн 401 506, штат Махараштра, Індія.

Заявник.

М.Біотек Лтд.

Місцезнаходження.

36, Бат Роуд, Хоунслоу ТВ3 3ЕФ Сполучене Королівство.