МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ И СОЦИАЛЬНОГО РАЗВИТИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

ЖЕЛКИЗОЛ®

лиофилизат для приготовления раствора для инфузий

Регистрационный номер:

Торговое название препарата: Желкизол®

Международное непатентованное название: омепразол.

Химическое название:
5-метокси-2-(4-метокси-3,5-диметил-2-пиридин)-метил)-сульфинил)-1Н-бензимидазол натрия моногидрат

Лекарственная форма: лиофилизат для приготовления раствора для инфузий.

Состав: Каждый флакон содержит:
Активное вещество: омепразола натрия моногидрат 44,6 мг (в пересчете на омепразол 40 мг).
Вспомогательные вещества: динатрия эдетат 1,5 мг.

Описание: лиофилизированная масса белого или почти белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа: желез желудка секрецию понижающее средство - протонного насоса ингибитор.

Код АТХ: A02BC01

Фармакологические свойства

Фармакодинамика
Специфический ингибитор протонного насоса: тормозит активность Н+/К+-АТФ-азы в париетальных клетках желудка, блокируя заключительную стадию секреции соляной кислоты, тем самым, снижает кислотопродукцию. Снижает базальную и стимулированную секрецию независимо от природы раздражителя.
Омепразол является пролекарством и активируется в кислой среде секреторных канальцев париетальных клеток желудка.
Воздействие является дозозависимым и обеспечивает эффективное ингибирование и базальной, и стимулированной секреции кислоты, независимо от природы стимулирующего фактора.

Фармакокинетика
Связь с белками плазмы – 90-95 % (альбумин и кислый альфа1-гликопротеин). Период полувыведения (T½) для заключительной фазы кривой концентрации в плазме-времени после внутривенной инфузии омепразола равен, приблизительно, 40 минутам (при печеночной недостаточности - 3 ч); общий клиренс плазмы равен от 0,3 до 0,6 л/мин. Измене-

ния величины периода полувыведения в ходе лечения не происходит. Практически полностью метаболизируется в печени с участием ферментной системы цитохрома P_{450} (CYP), с образованием шести фармакологически неактивных метаболитов (гидроксиомепразол, сульфидные и сульфоновые производные и других). Значительная часть метаболизма омепразола зависит от полиморфно экспрессируемой специфической изоформы CYP2C19 (S-мефенитоин гидроксилаза), отвечающей за образование гидроксиомепразола, главного плазменного метаболита. Является ингибитором изофермента CYP2C19. Выведение почками (70-80%) и с желчью (20-30 %). При хронической почечной недостаточности выведение снижается пропорционально снижению клиренса креатинина. У пожилых пациентов выведение уменьшается, биодоступность возрастает.

Показания к применению

- Язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки (в том числе профилактика рецидивов).
- Рефлюкс-эзофагит.
- Гиперсекреторные состояния (синдром Золлингера-Эллисона, стрессовые язвы желудочно-кишечного тракта, полиэндокринный аденоматоз, системный мастоцитоз).
- НПВП-гастропатия.
- Профилактика аспирации кислого содержимого желудка в дыхательные пути во время общей анестезии (синдром Мендельсона).

Противопоказания

Гиперчувствительность, детский возраст, беременность, период лактации.

С осторожностью

Почечная и/или печеночная недостаточность.

Способ применения и дозы

Для внутривенной инфузии.

Для лечения пациентов, которым не подходит пероральный прием препарата, при тяжелом обострении язвенной болезни, рефлюкс-эзофагите и НПВП-гастропатии, рекомендуемая суточная доза препарата Желкизол® составляет 40 мг для введения в форме внутривенной инфузии.

У пациентов с синдромом Золлингера-Эллисона препарат назначают в начальной дозе 60 мг/сут. Доза должна подбираться индивидуально, возможно назначение более высоких доз (80-120 мг/сут). Если суточная доза составляет свыше 60 мг, ее следует разделить на 2-3 инфузии в течение суток.

Для профилактики аспирации кислого содержимого желудка в дыхательные пути во время общей анестезии (синдром Мендельсона) препарат назначают на ночь в дозе 40 мг и не менее чем за 2 часа до анестезии / операции в дозе 40 мг.

У пожилых пациентов нет необходимости корректировать дозу.

Приготовление инфузионного раствора

Раствор для внутривенного вливания (инфузии) готовится непосредственно перед использованием. Для приготовления раствора для внутривенного вливания (инфузии) следует использовать только 5 % раствор глюкозы без консервантов. Для растворения 40 мг лиофилизированного порошка омепразола во флакон добавляют не менее 5 мл растворителя и осторожно встряхивают до полного растворения лиофилизата. Приготовленный раствор, содержащий 40 мг омепразола, перед инфузией разбавляют в 100 мл 5 % раствора глюкозы без консервантов для проведения внутривенного вливания (инфузии) в течение не менее 30 мин. До инфузии следует убедиться в отсутствии в растворе взвешенных частиц. Химическая и физическая стабильность приготовленного раствора омепразола наблюдается в течение 6 часов с момента растворения омепразола в 5 % растворе глюкозы.

Побочное действие

Со стороны органов кроветворения: в отдельных случаях - лейкопения, тромбоцитопения, агранулоцитоз, панцитопения.

Со стороны системы пищеварения: диарея или запоры, боль в животе, тошнота, рвота, метеоризм; в редких случаях - повышение активности «печеночных» ферментов, нарушения вкуса; в отдельных случаях - сухость во рту, стоматит, у больных с предшествующим тяжелым заболеванием печени - гепатит (в том числе, с желтухой), нарушение функции печени.

Со стороны нервной системы: у больных с тяжелыми сопутствующими соматическими заболеваниями - головокружение, головная боль, возбуждение, депрессия, у больных с предшествующим тяжелым заболеванием печени - энцефалопатия.

Со стороны опорно-двигательного аппарата: в отдельных случаях - артралгия, миастения, миалгия.

Со стороны кожных покровов: редко - кожная сыпь и/или зуд, в отдельных случаях - фотосенсибилизация, мультиформная экссудативная эритема, алопеция.

Аллергические реакции: крапивница, ангионевротический отек, лихорадка, бронхоспазм, интерстициальный нефрит и анафилактический шок.

Прочие: редко - гинекомастия, недомогание, нарушения зрения, периферические отеки, усиление потоотделения, образование желудочных гландулярных кист во время длительного лечения (следствие ингибирования секреции соляной кислоты, носит доброкачественный, обратимый характер).

Передозировка

По данным клинических исследований при внутривенной инфузии до 270 мг препарата за сутки и в дозе до 650 мг за три дня дозозависимых побочных эффектов не было выявлено.

Симптомы: спутанность сознания, нечеткость зрения, сонливость, сухость во рту, головная боль, тошнота, тахикардия, аритмия.

Лечение: симптоматическое. Гемодиализ недостаточно эффективен.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Может снижать абсорбцию эфиров ампициллина, солей железа, итраконазола и кетоконазола (омепразол повышает pH желудка).

Являясь ингибитором цитохрома P_{450}, может повышать концентрацию и снижать выведение диазепама, антикоагулянтов непрямого действия (варфарина), фенитоина (лекарственных средств, которые метаболизируются в печени посредством цитохрома CYP2C19), что в некоторых случаях может потребовать уменьшения доз этих лекарственных средств.

В то же время, длительное применение омепразола в дозе 20 мг 1 раз в сутки в комбинации с кофеином, теофиллином, пироксикамом, диклофенаком, напроксеном, метопрололом, пропранололом, этанолом, циклоспорином, лидокаином, хинидином и эстрадиолом не приводило к изменению их концентрации в плазме.

Концентрации омепразола и кларитромицина в плазме крови возрастают во время совместного перорального приема этих препаратов, в то время как доказательств взаимодействия омепразола с метронидазолом и амоксициллином не выявлено.

Особые указания

Перед началом терапии необходимо исключить наличие злокачественного процесса (особенно при язве желудка), так как лечение, маскируя симптоматику, может отсрочить постановку правильного диагноза.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и механизмами

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышен-

ной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска
Лиофилизат для приготовления раствора для инфузий.
По 40 мг активного вещества во флакон бесцветного стекла, укупоренный хлорбутиловой пробкой и алюминиевым колпачком с пластиковой крышкой.
1 флакон вместе с инструкцией по применению помещают в картонную пачку.
10 пачек помещают в картонную коробку.

Условия хранения
В плотно закрытой упаковке, в защищенном от света месте, при температуре не выше 20 °С.
Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности
2 года.
Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек
По рецепту.

Производитель
Юкеа Фармасьютикал Групп Ко., Лтд., Китай.
Адрес фирмы: 100176, КНР, Пекин, Пекинская зона экономического и технологического развития, ХонгДа Миддл Роуд, 6.
Тел.: 86-10-67877195 / факс: 86-10-67878191.
www.youcareyk.com

Представительство в РФ/Претензии потребителей направлять по адресу:
ЗАО «Институт Здоровья», 630015, г. Новосибирск, ул. Королева, 40, корпус 3, офис 5. Телефон (383) 362-12-03; web-сайт: www.iz-nsk.ru; e-mail: iz@iz-nsk.ru.

Представитель фирмы
Директор ЗАО «Институт Здоровья» Г.И. Попов