

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Гастрозол, 20 мг, капсулы.

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: омепразол

Каждая капсула содержит 20 мг омепразола.

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: лактозы моногидрат (см.раздел 4.3).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Капсулы.

Непрозрачные капсулы №2. Корпус белого цвета, крышечка розовато-коричневого цвета. Содержимое капсул – пеллеты от белого до почти белого цвета.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1 Показания к применению

Взрослые

- язва двенадцатиперстной кишки
- язва желудка
- НПВП ассоциированные язвы и эрозии желудка и двенадцатиперстной кишки
- эрадикация *Helicobacter pylori* при язвенной болезни
- рефлюкс-эзофагит
- симптоматическая гастроэзофагеальная рефлюксная болезнь (ГЭРБ)
- диспепсия, связанная с повышенной кислотностью
- синдром Золлингера-Эллисона

Дети

- гастроэзофагеальная рефлюксная болезнь у детей старше 2 лет
- язвенная болезнь двенадцатиперстной кишки, ассоциированная с *Helicobacter pylori* (в составе комбинированной терапии), у детей старше 4 лет

4.2 Режим дозирования и способ применения

4.2.1. Режим дозирования

Взрослые

Язва двенадцатиперстной кишки

Пациентам с активной язвой двенадцатиперстной кишки рекомендуется принимать омепразол по 1 капсуле (20 мг) 1 раз в сутки. Препарат обеспечивает быстрое устранение симптомов. У большинства пациентов заживление язвы наступает в течение 2-х недель. В тех случаях, когда в течение 2-х недель полное заживление язвы не наступает, заживление достигается при последующем 2-х недельном приеме препарата. Пациентам с язвой двенадцатиперстной кишки, мало восприимчивой к

лечению, обычно назначают омепразол 40 мг (2 капсулы) 1 раз в сутки; заживление язвы обычно наступает в течение 4-х недель. Для предотвращения рецидивов пациентам с язвой двенадцатиперстной кишки рекомендуют омепразол по 20 мг 1 раз в сутки. В случае необходимости дозу можно увеличить до 40 мг (2 капсулы) 1 раз в сутки.

Язва желудка

Рекомендуемая доза омепразола – 20 мг 1 раз в сутки. Препарат обеспечивает быстрое устранение симптомов. У большинства пациентов излечение наступает в течение 4-х недель. В тех случаях, когда после первого курса приема препарата заживление не наступает, обычно назначают повторный 4-недельный курс, в течение которого достигается заживление. Пациентам с язвой желудка, мало восприимчивой к лечению, обычно назначают омепразол 40 мг (2 капсулы) 1 раз в сутки; заживление обычно достигается в течение 8 недель. Для предотвращения рецидивов пациентам с язвой желудка рекомендуется доза 20 мг 1 раз в сутки. В случае необходимости дозу можно увеличить до 40 мг 1 раз в сутки.

НПВП ассоциированные язвы желудка или эрозии двенадцатиперстной кишки

При наличии НПВП ассоциированных язв желудка, двенадцатиперстной кишки или гастродуоденальных эрозиях у пациентов с прекращенной или продолжающейся терапией НПВП рекомендуемая доза омепразола 20 мг 1 раз в сутки. Препарат обеспечивает быстрое устранение симптомов, у большинства пациентов излечение наступает в течение 4-х недель. У тех пациентов, у которых не произошло излечение в течение периода исходной терапии, заживление обычно достигается при повторном 4-х недельном приеме препарата.

При язвах двенадцатиперстной кишки, эрозиях и симптомах диспепсии, связанных с приемом НПВП, рекомендуемая доза препарата 20 мг 1 раз в сутки.

Режимы эрадикации *Helicobacter pylori* при язвенной болезни

Трехкомпонентная схема лечения:

- омепразол 20 мг + амоксициллин 1000 мг + кларитромицин 500 мг по 2 раза в сутки утром и вечером в течение 7 дней;
- омепразол 20 мг + метронидазол 400 мг (или тинидазол 500 мг) + кларитромицин 250 мг по 2 раза в сутки утром и вечером в течение 7 дней;
- омепразол 40 мг (2 капсулы) 1 раз в сутки + амоксициллин 500 мг 3 раза в сутки + метронидазол 400 мг 3 раза в сутки в течение 7 дней.

Двухкомпонентная схема лечения:

- омепразол 40–80 мг (2–4 капсулы) + амоксициллин 1,5 г ежедневно (дозу следует делить на части) в течение 2 недель.

Для обеспечения полного заживления дальнейшее лечение проводить в соответствии с рекомендациями в разделах «Язва двенадцатиперстной кишки» и «Язва желудка». В тех случаях, когда после прохождения курса лечения проба на *Helicobacter pylori* остается положительной, курс лечения может быть повторен.

Рефлюкс-эзофагит

Рекомендуемая доза омепразола 20 мг 1 раз в сутки. Препарат обеспечивает быстрое устранение симптомов, у большинства пациентов излечение наступает в течение 4-х недель. В тех случаях, когда после первого курса приема препарата полное излечение

не наступает, обычно назначается повторный 4-х недельный курс лечения, в течение которого достигается излечение.

Пациентам с тяжелой формой рефлюкс-эзофагита рекомендуется омепразол 40 мг (2 капсулы) 1 раз в сутки; излечение обычно наступает в течение 8 недель.

Пациентам с рефлюкс-эзофагитом в стадии ремиссии назначают омепразол 20 мг 1 раз в сутки в виде длительных курсов поддерживающей терапии. В случае необходимости дозу можно увеличить до 40 мг.

Симптоматическая гастроэзофагеальная рефлюксная болезнь

Рекомендуемая доза препарата омепразол – 20 мг 1 раз в сутки. Препарат обеспечивает быстрое устранение симптомов. Если после 4-х недель лечения (20 мг 1 раз в сутки) симптомы не исчезают, рекомендуется дополнительное обследование пациента.

Диспепсия, связанная с повышенной кислотностью

Для облегчения болей и/или устранения ощущения дискомфорта в эпигастральной области, с изжогой или без изжоги, назначают омепразол – 20 мг 1 раз в сутки. Если после 4-х недель лечения симптомы не исчезают, рекомендуется дополнительное обследование пациента.

Синдром Золлингера-Эллисона

Пациентам с синдромом Золлингера-Эллисона препарат назначают в индивидуальной дозировке. Лечение продолжают по клиническим показаниям настолько долго, насколько это необходимо. Рекомендуемая начальная доза препарата – 60 мг (3 капсулы) ежедневно. У всех пациентов с тяжелой формой заболевания, а также в тех случаях, когда другие терапевтические методы не привели к желаемому результату, применение препарата было эффективным у более 90 % пациентов при ежедневном приеме 20–120 мг препарата. В тех случаях, когда суточная доза препарата превышает 80 мг (4 капсулы), дозу следует делить на две части и принимать по 2 капсулы 2 раза в сутки.

Особые группы пациентов

Пациенты с нарушением функции печени

У пациентов с нарушением функции печени биодоступность и период полужизни в плазме омепразола увеличиваются. В связи с этим доза 20 мг в сутки является достаточной (см. раздел 4.4).

Пациенты с нарушением функции почек

У пациентов с нарушением функции почек коррекция дозы не требуется.

Пациенты пожилого возраста

У пожилых лиц коррекция дозы не требуется.

Дети

Гастроэзофагеальная рефлюксная болезнь (ГЭРБ) у детей старше 2 лет (масса тела более 20 кг).

По 20 мг 1 раз в сутки. При необходимости доза может быть увеличена до 40 мг (2 капсулы) 1 раз в сутки. Продолжительность лечения при рефлюкс-эзофагите составляет 4-8 недель. Продолжительность лечения при симптоматическом лечении изжоги и кислой отрыжки при ГЭРБ составляет 2-4 недели. Если при применении

омепразола в течение 2-4 недель симптомы заболевания не исчезают, рекомендуется дальнейшее обследование.

Язвенная болезнь двенадцатиперстной кишки, ассоциированная с *Helicobacter pylori* (в составе комбинированной терапии) у детей старше 4 лет (масса тела более 31 кг).

С целью эрадикации *Helicobacter pylori* у детей старше 4 лет с язвенной болезнью двенадцатиперстной кишки комбинированную терапию проводят с учетом национальных и региональных рекомендаций в отношении бактериальной резистенции (с использованием соответствующих антибактериальных средств). Омепразол назначается по 20 мг 2 раза в сутки. Длительность лечения 7–14 дней

4.2.2. Способ применения

Препарат принимают внутрь, капсулы не разжевывают, обычно утром, запивая небольшим количеством воды (непосредственно перед едой или во время приема пищи).

Для пациентов с затруднением глотания и для детей, которые не могут проглотить капсулу

Следует открыть капсулу и проглотить содержимое, запив 100 мл теплой воды. Или смешать содержимое капсулы с кислой жидкостью, например, с яблочным соком или с негазированной водой. пациентам следует сообщить, что полученный дисперсионный раствор следует принимать немедленно (в течение 30 минут) и перемешивать непосредственно перед употреблением.

4.3 Противопоказания

- Гиперчувствительность к действующему веществу или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1;
- дефицит лактазы, сахаразы/изомальтазы, непереносимость лактозы, фруктозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция;
- совместное применение с эрлотинибом, позаконазолом, кларитромицином (у пациентов с печеночной недостаточностью), зверобоем;
- период грудного вскармливания (см. раздел 4.6);
- детский возраст до 18 лет, за исключением: гастроэзофагеальная рефлюксная болезнь - детский возраст до 2 лет и масса тела до 20 кг; язвенная болезнь двенадцатиперстной кишки, ассоциированная с *Helicobacter pylori* - детский возраст до 4 лет и масса тела менее 31 кг.

4.4 Особые указания и меры предосторожности при применении

При наличии любых тревожных симптомов (например, таких как значительная спонтанная потеря массы тела, повторная рвота, дисфагия, рвота с примесью крови или мелена), а также при наличии язвы желудка (или при подозрении на язву желудка) следует исключить наличие злокачественного новообразования, т.к. лечение омепразолом, маскируя симптоматику, может отсрочить постановку правильного диагноза.

Применение омепразола с препаратами атазанавир и нелфинавир.

Не рекомендуется совместное применение омепразола с такими препаратами, как атазанавир и нелфинавир.

Применение омепразола с клопидогрелом

По результатам исследований отмечено фармакокинетическое/фармакодинамическое взаимодействие между клопидогрелом (нагрузочная доза 300 мг и поддерживающая доза 75 мг/сут) и омепразолом (80 мг/сут внутрь), которое приводит к снижению экспозиции к активному метаболиту клопидогрела в среднем на 46 % и снижению максимального ингибирования АДФ-индуцированной агрегации тромбоцитов в среднем на 16 %. Поэтому следует избегать одновременного применения омепразола и клопидогрела (см. раздел 4.5).

Применение омепразола у пациентов с остеопорозом

Отдельные наблюдательные исследования указывают на то, что терапия ингибиторами протонного насоса может незначительно повышать риск связанных с остеопорозом переломов, однако в других подобных исследованиях повышения риска не отмечено. В рандомизированных, двойных слепых, контролируемых клинических исследованиях омепразола и эзомепразола, включая два открытых исследования с длительностью терапии более 12 лет, не была подтверждена связь переломов на фоне остеопороза с применением ингибиторов протонного насоса. Хотя причинно-следственная связь применения омепразола/эзомепразола с переломами на фоне остеопороза не установлена, пациенты с риском развития остеопороза или перелом на его фоне должны находиться под соответствующим клиническим наблюдением.

Влияние омепразола на концентрацию хромогранина А

Вследствие снижения секреции соляной кислоты повышается концентрация хромогранина А (CgA). Повышение концентрации CgA может оказывать влияние на результаты обследований для выявления нейроэндокринных опухолей. Для предотвращения данного влияния необходимо временно прекратить прием омепразола за 5 дней до проведения исследования концентрации CgA.

Применение омепразола при других состояниях

Следует соблюдать осторожность при наличии состояний: остеопороз, значительная спонтанная потеря в весе, частая рвота, дисфагия, рвота с кровью или мелена, а также при наличии язвы желудка (или подозрении на язву желудка).

4.5 Взаимодействия с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия.

Влияние омепразола на фармакокинетику других лекарственных препаратов

Применение омепразола с препаратами, всасывание которых зависит от кислотности среды желудка

Снижение секреции соляной кислоты в желудке при лечении омепразолом и другими ингибиторами протонного насоса может привести к снижению или повышению абсорбции других препаратов, всасывание которых зависит от кислотности среды. Так же, как и при применении других препаратов, подавляющих секрецию соляной кислоты, или антацидных средств, лечение омепразолом может привести к снижению всасывания эрлотиниба, кетоконазола или итраконазола, а также повышению

всасывания дигоксина. При одновременном применении омепразола (в дозе 20 мг в сутки) и дигоксина происходит увеличение биодоступности дигоксина на 10 %.

Применение омепразола с антиретровирусными препаратами

Было показано, что омепразол взаимодействует с некоторыми антиретровирусными препаратами. Механизмы и клиническое значение этих взаимодействий не всегда известны. Увеличение значения рН на фоне терапии омепразолом может влиять на всасывание антиретровирусных препаратов. Также возможно взаимодействие на уровне изофермента CYP2C19. При совместном применении омепразола и некоторых антиретровирусных препаратов, таких как атазанавир и нелфинавир, на фоне терапии омепразолом отмечается снижение их концентрации в сыворотке. В связи с этим совместное применение омепразола с антиретровирусными препаратами, такими как атазанавир и нелфинавир, не рекомендуется.

При одновременном применении омепразола и саквинавира было отмечено повышение концентрации саквинавира в сыворотке, при применении с некоторыми другими антиретровирусными препаратами, их концентрация не менялась.

Применение омепразола с препаратами, метаболизирующимися в печени с участием изофермента CYP2C19

Омепразол ингибирует CYP2C19 – основной изофермент, участвующий в его метаболизме. Совместное применение омепразола с другими препаратами, в метаболизме которых принимает участие изофермент CYP2C19, такими как диазепам, варфарин (R-варфарина) или другие антагонисты витамина К, фенитоин и цилостазол, может привести к замедлению метаболизма этих препаратов. Рекомендуется наблюдение за пациентами, принимающими фенитоин и омепразол, может потребоваться снижение дозы фенитоина. Однако сопутствующее лечение омепразолом в суточной дозе 20 мг не влияет на концентрацию фенитоина в плазме крови у пациентов, длительно принимающих препарат. При применении омепразола пациентами, получающими варфарин или другие антагонисты витамина К, необходим мониторинг международного нормализованного отношения; в ряде случаев может потребоваться снижение дозы варфарина или другого антагониста витамина К. В то же время сопутствующее лечение омепразолом в суточной дозе 20 мг не приводит к изменению времени коагуляции у пациентов, длительно принимающих варфарин.

Применение омепразола в дозе 40 мг один раз в сутки приводило к увеличению C_{max} и AUC цилостазола на 18 % и 26 % соответственно; для одного из активных метаболитов цилостазола увеличение составило 29 % и 69 % соответственно.

Применение омепразола с клопидогрелом

По результатам исследований отмечено фармакокинетическое/фармакодинамическое взаимодействие между клопидогрелом (нагрузочная доза 300 мг и поддерживающая доза 75 мг/сут) и омепразолом (80 мг/сут внутрь), которое приводит к снижению экспозиции к активному метаболиту клопидогрела в среднем на 46 % и снижению максимального ингибирования АДФ-индуцированной агрегации тромбоцитов в среднем на 16 %.

Клиническая значимость этого взаимодействия не ясна. Повышение риска сердечно-сосудистых осложнений при совместном применении клопидогрела и ингибиторов

протонного насоса, в том числе омепразола, не было показано в рандомизированных клинических исследованиях. Результаты ряда наблюдательных исследований противоречивы и не дают однозначного ответа о наличии или отсутствии повышенного риска тромбоэмболических сердечно-сосудистых осложнений на фоне совместного применения клопидогрела и ингибиторов протонного насоса.

Применение омепразола с препаратами других групп

Омепразол не влияет на метаболизм препаратов, метаболизируемых изоферментом CYP3A4, таких как циклоспорин, эстрадиол, будесонид, хинидин, лидокаин.

Не выявлено взаимодействие омепразола со следующими препаратами: антацидные средства, теофиллин, кофеин, пропранолол, этанол, S-варфарин, пироксикам, диклофенак, напроксен, метопролол.

Применение омепразола с такролимусом

При одновременном применении омепразола и такролимуса было отмечено повышение концентрации такролимуса в сыворотке крови.

Применение омепразола с метотрексатом

У некоторых пациентов сообщалось о незначительном повышении концентрации метотрексата в плазме крови при его одновременном применении с ингибиторами протонной помпы. При применении высоких доз метотрексата следует временно прекратить прием омепразола.

Влияние лекарственных препаратов на фармакокинетику омепразола

В метаболизме омепразола участвуют изоферменты CYP2C19 и CYP3A4. Совместное применение омепразола и ингибиторов изоферментов CYP2C19 и CYP3A4, таких как кларитромицин, эритромицин и вориконазол, может приводить к повышению концентрации омепразола в плазме крови за счет замедления метаболизма омепразола. Совместное применение омепразола и вориконазола приводит к более чем двукратному увеличению AUC омепразола. В связи с хорошей переносимостью высоких доз омепразола, при непродолжительном совместном применении указанных препаратов не требуется коррекция дозы омепразола. Лекарственные препараты, индуцирующие изоферменты CYP2C19 и CYP3A4, такие как, рифампицин и препараты зверобоя продырявленного, при совместном применении с омепразолом могут приводить к снижению его концентрации в плазме крови за счет ускорения метаболизма препарата.

Совместный прием омепразола с амоксициллином или метронидазолом не влияет на концентрацию омепразола в плазме крови.

4.6 Фертильность, беременность и лактация.

4.6.1 Беременность

Результаты исследований показали отсутствие побочного действия омепразола на здоровье беременных женщин, на плод или новорожденного. Омепразол может применяться во время беременности.

4.6.2 Кормление грудью

Применение препарата Гастрозол противопоказано в период грудного вскармливания (см. раздел 4.3). Необходимо принять решение либо о прекращении грудного

вскармливания, либо об отмене терапии Гастрозолом, принимая во внимание пользу грудного вскармливания для ребенка и пользу терапии для женщины.

4.6.3 Фертильность

Данные о негативном влиянии омепразола на фертильность отсутствуют.

4.7 Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

Гастрозол оказывает умеренное влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами.

Отсутствуют данные о влиянии препарата на способность управлять автомобилем или другими механизмами. Однако, в связи с тем, что во время терапии могут наблюдаться головокружение, нечеткость зрения и сонливость, следует соблюдать осторожность при управлении автотранспортом или во время работы с механизмами, требующей повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

4.8 Нежелательные реакции

Резюме профиля безопасности.

Наиболее значимыми нежелательными реакциями являются диарея, запор, боль в животе, тошнота, рвота, метеоризм, головная боль.

Резюме в форме структурированного списка нежелательных реакций.

Ниже приведены нежелательные реакции, не зависящие от режима дозирования омепразола, которые были отмечены в ходе клинических исследований, а также при постмаркетинговом применении. Перечисленные ниже нежелательные явления, отмеченные при применении омепразола, распределены по частоте возникновения в соответствии со следующей градацией: очень часто ($> 1/10$), часто ($> 1/100$ до $< 1/10$), нечасто ($> 1/1000$ до $< 1/100$), редко ($> 1/10000$ до $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$), неуточненная частота (невозможно оценить на основании имеющихся данных).

Желудочно-кишечные нарушения:

часто – диарея, запор, боль в животе, тошнота, рвота, метеоризм; *редко* – сухость во рту, стоматит, кандидоз желудочно-кишечного тракта, микроскопический колит.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей:

нечасто – повышение активности «печеночных» ферментов; *редко* – гепатит (с желтухой или без), печеночная недостаточность, энцефалопатия у пациентов с заболеваниями печени.

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы:

редко – лейкопения, тромбоцитопения, агранулоцитоз, панцитопения, гипохромная микроцитарная анемия у детей.

Нарушения со стороны нервной системы:

часто – головная боль; *нечасто* – вертиго, парестезии, сонливость; *редко* – нарушение вкуса.

Нарушения со стороны мышечной, скелетной и соединительной ткани:

нечасто – переломы бедра, костей запястья и позвонков; *редко* – артралгия, миалгия, мышечная слабость.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей:

нечасто – дерматит, сыпь, зуд, крапивница; *редко* – алопеция, фотосенсибилизация, мультиформная эритема, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз.

Нарушения со стороны иммунной системы:

редко – реакции гиперчувствительности (например, ангионевротический отек, лихорадка, анафилактическая реакция/анафилактический шок).

Нарушения метаболизма и питания:

редко – гипонатриемия; *очень редко* – гипокальциемия вследствие тяжелой гипомагниемии, гипокалиемия вследствие гипомагниемии; *неуточненная частота* – гипомагниемия.

Психические нарушения:

нечасто – бессонница; *редко* – возбуждение, агрессия, замешательство, галлюцинации, депрессия.

Нарушения со стороны органа зрения:

редко – нечеткость зрения.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения:

редко – бронхоспазм.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей:

редко – интерстициальный нефрит.

Нарушения со стороны репродуктивной системы и молочных желез:

редко – гинекомастия.

Общие нарушения и реакции в месте введения:

нечасто – недомогание; *редко* – потливость, периферические отеки.

Сообщалось о случаях образования железистых кист в желудке у пациентов, принимающих препараты, понижающие секрецию желез желудка, в течение длительного промежутка времени; проходят самостоятельно на фоне продолжения терапии.

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза – риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств-членов Евразийского экономического союза.

Россия

Адрес: 109012, г. Москва, Славянская площадь, д. 4, стр. 1

Уполномоченный орган (уполномоченная организация) государства - члена Евразийского экономического союза: Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения (Росздравнадзор)

Тел.: +7 (495) 698-45-38, +7 (499) 578-02-30

Факс: +7 (495) 698-15-73

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.ru

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»:
www.roszdravnadzor.gov.ru

4.9 Передозировка

Разовые пероральные дозы омепразола до 400 мг (20 капсул) не вызывали каких-либо тяжелых симптомов. Разовые дозы омепразола 560 мг при приеме взрослыми вызывали симптомы умеренной интоксикации. При увеличении дозы скорость элиминации препарата не изменялась, специфическое лечение при этом не требовалось.

Симптомы

Брадикардия, гипотензия, сердечная недостаточность, бронхоспазм, нарушения со стороны центральной нервной системы, головокружение, спутанность сознания, апатия, депрессия, сонливость, головная боль, нарушение зрения, дилатация сосудов, тахикардия, тошнота, рвота, метеоризм, боль в животе диарея, повышение потоотделения, «сухость» во рту.

Лечение

Симптоматическое. При необходимости — промывание желудка, назначение активированного угля. Гемодиализ недостаточно эффективен.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: средство понижающее секрецию желез желудка – протонного насоса ингибитор

Код АТХ А02ВС01

Механизм действия, фармакодинамические эффекты

Омепразол является слабым основанием. Концентрируется в кислой среде секреторных канальцев париетальных клеток слизистой оболочки желудка, активируется и ингибирует протонную помпу – фермент H^+ , K^+ - АТФазу. Влияние омепразола на последнюю стадию процесса образования соляной кислоты в желудке является дозозависимым и обеспечивает высокоэффективное ингибирование базальной и стимулированной секреции соляной кислоты независимо от стимулирующего фактора.

Влияние на секрецию желудочного сока

Омепразол при ежедневном пероральном применении обеспечивает быстрое и эффективное ингибирование дневной и ночной секреции соляной кислоты. Максимальный эффект достигается через 4 дня лечения. У пациентов с язвой двенадцатиперстной кишки омепразол 20 мг вызывает устойчивое снижение 24-часовой желудочной кислотности не менее чем на 80 %. При этом достигается снижение средней максимальной концентрации соляной кислоты после стимуляции пентагастрином на 70 % в течение 24 часов. У пациентов с язвой двенадцатиперстной кишки ежедневный прием 20 мг омепразола поддерживает внутрижелудочный показатель кислотности среды (рН) на уровне ≥ 3 в течение 17 часов в сутки. Ингибирование секреции соляной кислоты зависит от площади под кривой

концентрация-время (AUC) омепразола, а не от концентрации препарата в плазме крови в данный момент времени.

Действие на Helicobacter pylori

Омепразол обладает бактерицидным эффектом на *Helicobacter pylori in vitro*.

Эрадикация *Helicobacter pylori* при применении омепразола совместно с антибактериальными средствами сопровождается быстрым устранением симптомов, высокой степенью заживления дефектов слизистой оболочки желудочно-кишечного тракта и длительной ремиссией язвенной болезни, что снижает вероятность таких осложнений, как кровотечения, так же эффективно, как и постоянная поддерживающая терапия.

Другие эффекты, связанные с ингибированием секреции соляной кислоты

У пациентов, принимающих препараты, понижающие секрецию желез желудка, в течение длительного промежутка времени, чаще отмечается образование доброкачественных кист желудка, проходящих самостоятельно на фоне продолжения терапии. Эти явления обусловлены физиологическими изменениями в результате ингибирования секреции соляной кислоты.

Снижение секреции соляной кислоты в желудке под действием ингибиторов протонной помпы или других кислотно-ингибирующих агентов, приводит к повышению роста нормальной микрофлоры кишечника, что в свою очередь может приводить к незначительному увеличению риска развития кишечных инфекций, вызванных бактериями рода *Salmonella spp.* и *Campylobacter spp.*, а у госпитализированных пациентов также, вероятно, бактерией *Clostridium difficile*.

Во время лечения препаратами, понижающими секрецию желез желудка, концентрация гастрина в сыворотке крови повышается. Вследствие снижения секреции соляной кислоты повышается концентрация хромогранина А (CgA).

У детей и взрослых пациентов, длительно принимавших омепразол, отмечалось увеличение энтерохромаффиноподобных клеток, вероятно, связанное с увеличением концентрации гастрина в сыворотке крови. Клинической значимости данное явление не имеет.

Клиническая эффективность и безопасность

В клинических исследованиях было показано, что при язвенной болезни желудка и 12-перстной кишки применение омепразола в виде монотерапии обеспечивает выраженное антисекреторное действие и высокие темпы и сроки рубцевания язв.

Применение омепразола в составе комбинированной терапии для эрадикации *Helicobacter pylori* способствовало более эффективной эрадикации НР и заживлению гастродуоденальных язв в короткие сроки.

При гастроэзофагеальной рефлюксной болезни применение омепразола обеспечивает исчезновение клинических симптомов, восстановление слизистой оболочки пищевода и заживление эрозий.

5.2 Фармакокинетические свойства

Абсорбция.

Омепразол абсорбируется в тонкой кишке, обычно в течение 3–6 часов, время достижения максимальной концентрации (T_{max}) 0,5–3,5 часа. Биодоступность

после однократного приема внутрь составляет приблизительно 30–40 %, после постоянного приема 1 раз в сутки биодоступность увеличивается до 60 %. Прием пищи не влияет на биодоступность омепразола.

Распределение

Показатель связывания омепразола с белками плазмы составляет около 95 %, объем распределения составляет 0,3 л/кг.

Биотрансформация.

Практически полностью метаболизируется в печени. Основные ферменты, участвующие в процессе метаболизма, CYP2C19 и CYP2A4. Образующиеся метаболиты – сульфон и сульфид не оказывают значительного влияния на секрецию соляной кислоты. Является ингибитором изофермента CYP2C19.

Элиминация.

Период полувыведения составляет около 40 минут (30–90 минут). Около 80 % выводится в виде метаболитов почками, а остальная часть – через кишечник.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Не отмечено значительных изменений биодоступности омепразола у пожилых пациентов или у пациентов с нарушенной функцией почек. У пациентов с нарушенной функцией печени отмечается увеличение биодоступности омепразола и значительное уменьшение плазменного клиренса.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

маннитол

сахароза

натрия лаурилсульфат

натрия гидрофосфат (натрия фосфат двузамещенный)

кальция карбонат

лактозы моногидрат

гипромеллоза (гидроксипропилметилцеллюлоза)

метакриловой кислоты и этилакрилата сополимер [1:1]

пропиленгликоль

диэтилфталат

цетиловый спирт

натрия гидроксид

полисорбат-80 (твин-80)

повидон (поливинилпирролидон)

титана диоксид

тальк

6.2. Несовместимость

Не применимо.

6.3 Срок годности (срок хранения)

3 года.

6.4 Особые меры предосторожности при хранении

Хранить при температуре не выше 25 °С.

6.5 Характер и содержание первичной упаковки

Капсулы 20 мг.

По 7 капсул в контурную ячейковую упаковку.

По 7 или 10 капсул в контурную безъячейковую упаковку из фольги алюминиевой.

1, 2, 3 или 4 контурные упаковки вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

6.6. Особые меры предосторожности при уничтожении использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата и другие манипуляции с препаратом

Нет особых требований к утилизации.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

АО "Отисифарм", Россия

123112, г. Москва, ул. Тестовская, д. 10, эт. 12, пом. II, ком. 29

Тел: +7 (800) 775-98-19

Факс: +7 (495) 221-18-02

www.otcpharm.ru

7.1 Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

АО "Отисифарм", Россия

123112, г. Москва, ул. Тестовская, д. 10, эт. 12, пом. II, ком. 29

Тел: +7 (800) 775-98-19

Факс: +7 (495) 221-18-02

www.otcpharm.ru

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

Дата первой регистрации:

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата Гастрозол, 20 мг, капсулы доступна на официальном сайте уполномоченного органа государства – члена Евразийского союза в информационно-коммуникационной сети «Интернет» (www.rosminzdrav.ru) и (или) на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-коммуникационной сети «Интернет» (www.eaeunion.org).