

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**

ОМЕПРАЗОЛ, 20 мг, капсулы кишечнорастворимые.

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: омепразол.

Каждая капсула содержит 20 мг омепразола.

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: маннитол, сахароза, лактоза, пропиленгликоль (см. разделы 4.3 и 4.4).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Капсулы кишечнорастворимые.

Твердые желатиновые капсулы № 2 с корпусом и крышечкой желтого цвета. Содержимое капсул – сферические пеллеты белого или почти белого цвета.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ**4.1. Показания к применению**

ОМЕПРАЗОЛ показан к применению у взрослых и детей в возрасте от 2 лет.

Взрослые:

- язвенная болезнь желудка или двенадцатиперстной кишки (лечение и профилактика);
- НПВП – ассоциированные язвы и эрозии желудка и двенадцатиперстной кишки (лечение и профилактика);
- эрадикация *Helicobacter pylori* при язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки (в составе комбинированной терапии);
- рефлюкс-эзофагит;
- симптоматическая гастроэзофагеальная рефлюксная болезнь (ГЭРБ);
- диспепсия, связанная с повышенной кислотностью;
- синдром Золлингера-Эллисона.

Дети и подростки

Дети старше 2-х лет с массой тела не менее 20 кг:

- рефлюкс-эзофагит;
- симптоматическая гастроэзофагеальная рефлюксная болезнь.

Дети старше 4 лет и подростки:

- язва двенадцатиперстной кишки, вызванная *Helicobacter pylori* (в составе комбинированной терапии).

4.2. Режим дозирования и способ применения

Режим дозирования

Взрослые

Язвенная болезнь двенадцатиперстной кишки

При обострении язвенной болезни двенадцатиперстной кишки рекомендуется принимать препарат по 20 мг 1 раз в сутки. Обычно продолжительность терапии составляет две недели, при необходимости возможно увеличение курса терапии еще на 2 недели. Пациентам с язвенной болезнью двенадцатиперстной кишки, резистентной к лечению, обычно назначают препарат 40 мг 1 раз в сутки, в течение 4-х недель. Для профилактики рецидивов пациентам с язвенной болезнью двенадцатиперстной кишки - 20 мг 1 раз в сутки. В случае необходимости дозу можно увеличить до 40 мг 1 раз в сутки.

Язвенная болезнь желудка

При обострении язвенной болезни желудка рекомендуется принимать препарат по 20 мг 1 раз в сутки. Обычно продолжительность терапии составляет 4 недели. В тех случаях, когда после первого курса применения препарата полное заживление не наступает, назначают повторный 4-недельный курс лечения. Пациентам с язвенной болезнью желудка, резистентной к лечению, обычно назначают препарат 40 мг 1 раз в сутки, заживление обычно достигается в течение 8 недель. Для профилактики рецидивов пациентам с язвенной болезнью желудка - 20 мг 1 раз в сутки. В случае необходимости дозу можно увеличить до 40 мг 1 раз в сутки.

Режимы эрадикации, *Helicobacter pylori* при язвенной болезни: омепразол по 20 мг, кларитромицин по 500 мг, амоксициллин по 1000 мг одновременно 2 раза в день в течение 1 недели; омепразол по 20 мг, кларитромицин по 250 мг (в качестве альтернативы 500 мг), метронидазол по 400 мг (или по 500 мг или тинидазол по 500 мг) одновременно 2 раза в день в течение 1 недели; омепразол по 40 мг 1 раз в сутки, а также амоксициллин по 500 мг с метронидазолом по 400 мг (или по 500 мг или тинидазолом по 500 мг) оба 3 раза в день на протяжении 1 недели.

Рекомендованная доза омепразола в схемах эрадикации *Helicobacter pylori* в педиатрической практике составляет 1-2 мг на килограмм массы тела ребенка в сутки.

В тех случаях, если после проведенного лечения пациент *Helicobacter pylori*-позитивный, то возможен повторный курс лечения.

Лечение язвенно-эрозивных поражений желудка и двенадцатиперстной кишки, связанных с приемом нестероидных противовоспалительных препаратов (НПВП)

Рекомендуемая доза омепразола составляет 20 мг 1 раз в день. Курс лечения - 4 недели. Для пациентов, у которых не наступило заживление язвы, курс может быть продлен еще на 4 недели.

Профилактика язвенно-эрозивных поражений желудка и двенадцатиперстной кишки, связанных с приемом НПВП

В качестве профилактики НПВП-ассоциированных язвенно-эрозивных поражений желудка и двенадцатиперстной кишки у пациентов в группе риска (возраст более 60 лет, язвенно-эрозивные поражения желудка и двенадцатиперстной кишки в анамнезе, кровотечение из верхних отделов ЖКТ в анамнезе) рекомендуемая доза - 20 мг омепразола 1 раз в день.

Лечение рефлюкс-эзофагита

Рекомендуемая доза омепразола составляет 20 мг 1 раз в день. Курс лечения - 4 недели. Для пациентов, у которых не наступило излечение, курс может быть продлен еще на 4 недели. При тяжелом эзофагите рекомендуемая доза составляет 40 мг 1 раз в день, и курс лечения составляет 8 недель.

Симптоматическое лечение ГЭРБ

Рекомендуемая доза - 20 мг в день. Возможна индивидуальная корректировка дозы. Если симптомы сохраняются после 4 недель лечения в дозе 20 мг омепразола ежедневно, то требуется дальнейшее обследование. Рекомендованная доза омепразола для лечения ГЭРБ в педиатрической практике составляет 0,7-3,3 мг на килограмм массы тела ребенка в сутки.

Диспепсия, связанная с повышенной кислотностью

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

Лечение синдрома Золлингера-Эллисона

Доза устанавливается индивидуально. Рекомендуемая начальная доза - 60 мг один раз в сутки. При необходимости дозу увеличивают до 80-120 мг в сутки. При дозе более 80 мг её следует разделить на два приёма.

Особые группы пациентов

Пациенты пожилого возраста

Пациентам пожилого возраста коррекции режима дозирования не требуется.

Пациенты с нарушением функции печени

При печеночной недостаточности назначают по 10-20 мг (максимальная суточная доза 20 мг).

Пациенты с нарушением функции почек

Пациентам с нарушением функции почек коррекции режима дозирования не требуется.

Дети

Лечение ГЭРБ у детей старше 2 лет с массой тела более 20 кг

Рекомендуемая доза - 20 мг один раз в сутки. При необходимости возможно увеличение дозы до 40 мг один раз в сутки. Рекомендуемая продолжительность лечения в случае рефлюкс-эзофагита составляет 4-8 недель. Рекомендуемая продолжительность лечения в случае симптоматической гастроэзофагеальной рефлюксной болезни составляет 2-4 недели. Если после 2-4 недель лечения контроль симптомов заболевания не был достигнут, рекомендуется дополнительное обследование пациента.

Лечение язвенной болезни двенадцатиперстной кишки, вызванной Helicobacter pylori у детей старше 4 лет

При выборе соответствующей комбинированной терапии необходимо принимать во внимание официальные местные и национальные рекомендации с точки зрения бактериальной резистентности, длительность лечения (чаще всего 7 дней, но иногда может потребоваться до 14 дней) и соответствующие антибактериальные средства.

20 мг 1 раз в сутки в комбинации с антибактериальными препаратами (рекомендованная доза омепразола в схемах эрадикации *H. pylori* в педиатрической практике составляет 1-2 мг на килограмм массы тела ребенка в сутки).

Дети с массой тела 31-40 кг

Применение в комбинации с 2 антибиотиками: омепразол 20 мг, кларитромицин и амоксициллин у данной категории пациентов назначаются в режиме дозирования согласно инструкциям по применению кларитромицина и амоксициллина (применяют одновременно 2 раза в день в течение 1 недели).

Дети с массой тела более 40 кг

Применение в комбинации с 2 антибиотиками: омепразол 20 мг, кларитромицин и амоксициллин у данной категории пациентов назначаются в режиме дозирования согласно инструкциям по применению кларитромицина и амоксициллина (применяют одновременно 2 раза в день в течение 1 недели).

Лечение проводится под наблюдением специалиста.

Дети до 2 лет

Безопасность и эффективность ОМЕПРАЗОЛА у детей в возрасте до 2 лет на данный момент не установлены.

Способ применения

Внутрь, капсулы обычно принимают утром, предпочтительно отдельно от еды, глотать целиком, запивая достаточным количеством воды (содержимое капсулы нельзя разжевывать или измельчать), за 30 минут до еды. Не растворять в газированных напитках или молоке. Если пациент не может проглотить капсулу целиком, можно смешать ее содержимое со слегка подкисленной жидкостью, соком или фруктовым пюре и использовать в течение 30 минут.

4.3. Противопоказания

- гиперчувствительность к омепразолу, замещенным бензимидазолом или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1.;
- дефицит сахаразы/изомальтазы, непереносимость фруктозы, дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция;
- одновременное применение с кларитромицином (у пациентов с печеночной недостаточностью), зверобоем, эрлотинибом, позаконазолом, нелфинавиром и атазанавиром;
- детский возраст до 2 лет;
- детский возраст старше 2 лет по другим показаниям, кроме рефлюкс-эзофагита, симптоматической гастроэзофагеальной рефлюксной болезни;
- детский возраст старше 4 лет по другим показаниям кроме рефлюкс-эзофагита, симптоматической гастроэзофагеальной рефлюксной болезни и язвы двенадцатиперстной кишки, вызванной *Helicobacter pylori*.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

С осторожностью

Пациенты с остеопорозом.

При наличии таких симптомов, как значительная спонтанная потеря в весе, частая рвота, дисфагия, рвота с кровью или мелена, а также при наличии язвы желудка (или подозрении на язву желудка) следует исключить наличие злокачественного новообразования, поскольку лечение может привести к маскировке симптомов и, таким образом, задержать постановку диагноза.

Особые указания

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, поскольку лечение омепразолом может привести к сглаживанию симптоматики и отсрочить постановку диагноза. Не рекомендуется совместное применение омепразола с такими препаратами, как атазанавир и нелфинавир.

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). Отдельные наблюдательные исследования указывают на то, что терапия ингибиторами протонного насоса может незначительно повышать риск связанных с остеопорозом переломов, однако в других подобных исследованиях повышение 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 переломов на его фоне должны находиться под соответствующим клиническим наблюдением.

Ингибиторы протонной помпы связаны с очень редкими случаями подострой кожной красной волчанки (ПККВ). При возникновении повреждений, особенно на открытых солнцу участках кожи, и, если они сопровождаются артралгией, пациенту следует незамедлительно обратиться за медицинской помощью, а специалисту в области здравоохранения следует рассмотреть возможность прекращения приема омепразола. ПККВ после предыдущего лечения ингибитором протонной помпы может увеличить риск ПККВ при применении других ингибиторов протонной помпы.

Острый тубулоинтерстициальный нефрит (ТИН) наблюдался у пациентов, принимающих омепразол, и может возникнуть в любой момент во время терапии омепразолом. Острый тубулоинтерстициальный нефрит может прогрессировать до почечной недостаточности. При подозрении на острый тубулоинтерстициальный нефрит прием омепразола следует прекратить и незамедлительно начать соответствующее лечение.

Повышение концентрации CgA может оказывать влияние на результаты обследований для выявления нейроэндокринных опухолей (см. раздел 5.1). Для предотвращения данного

влияния терапии ингибиторами протонного насоса необходимо приостановить, как минимум, за 5 дней до проведения исследования концентрации CgA.

Если за это время концентрации CgA и гастрина не вернулись к нормальному значению, исследование следует повторить через 14 дней после прекращения приема омепразола.

Вспомогательные вещества

Препарат содержит лактозу

Пациентам с редко встречающейся наследственной непереносимостью фруктозы или глюкозо-галактозной мальабсорбцией не следует принимать этот препарат.

Препарат содержит маннитол

Препарат содержит маннитол, который может оказывать слабое слабительное действие.

Препарат содержит сахарозу

Пациентам с редко встречающейся наследственной непереносимостью фруктозы, глюкозо-галактозной мальабсорбцией или дефицитом сахаразы-изомальтазы не следует принимать этот препарат.

Препарат содержит пропиленгликоль

Препарат содержит пропиленгликоль, который может вызывать симптомы, схожие с приемом алкоголя.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Влияние омепразола на фармакокинетику других лекарственных препаратов

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.

Подобно другим препаратам, снижающим кислотность желудочного сока, лечение омепразолом может привести к снижению всасывания кетоназола, итраконазола, позаконазола и эрлотиниба, а также повышению всасывания таких препаратов, как дигоксин. Совместный прием омепразола в дозе 20 мг один раз в сутки и дигоксина повышает биодоступность дигоксина на 10 % (биодоступность дигоксина повышалась на величину до 30 % у 20 % пациентов).

Одновременный прием препарата ОМЕПРАЗОЛ с эрлотинибом или позаконазолом противопоказан (см. раздел 4.3). Было показано, что омепразол взаимодействует с некоторыми антиретровирусными препаратами. Механизмы и клиническое значение этих взаимодействий не всегда известны. Увеличение значения pH 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.

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-варфарин) 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.

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 проспективном рандомизированном незавершенном исследовании с участием более 3760 пациентов, получавших плацебо или омепразол в дозе 20 мг/сут. одновременно с терапией клопидогрелом и ацетилсалициловой кислотой (АСК), и не подтверждено дополнительным

нерандомизированным анализом клинических исходов масштабных проспективных рандомизированных исследований с участием более 47000 пациентов.

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.

При применении клопидогрела совместно с фиксированной комбинацией 20 мг эзомепразола и 81 мг АСК экспозиция к активному метаболиту клопидогрела снизилась почти на 40 % по сравнению с монотерапией клопидогрелом, при этом максимальные уровни ингибирования АДФ-индуцированной агрегации тромбоцитов были одинаковыми, что, вероятно, связано с одновременным приемом АСК в низкой дозе.

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

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

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

У некоторых пациентов отмечали незначительное повышение концентрации метотрексата на фоне совместного применения с ингибиторами протонного насоса. При назначении высоких доз метотрексата следует рассмотреть возможность временного прекращения приема 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 и вориконазол, может приводить к повышению концентрации омепразола в плазме крови за счет замедления метаболизма омепразола. Совместное применение вориконазола и омепразола приводит к более чем двукратному увеличению AUC омепразола. В связи с хорошей переносимостью высоких доз омепразола, при непродолжительном совместном применении указанных препаратов не требуется коррекции дозы омепразола.

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

Лекарственные препараты, индуцирующие изоферменты CYP2C19 и CYP3A4, такие

как рифампицин и препараты зверобоя продырявленного, при совместном применении с омепразолом могут приводить к снижению концентрации омепразола в плазме крови за счет ускорения метаболизма омепразола.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

Результаты исследований показали отсутствие побочного действия омепразола на здоровье беременных женщин, на плод или на новорожденного.

Омепразол может применяться во время беременности.

Лактация

Омепразол проникает в грудное молоко, однако при применении его в терапевтических дозах воздействие на ребенка маловероятно.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

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

4.8. Нежелательные реакции

Резюме нежелательных реакций

Частота нежелательных реакций классифицирована в соответствии с рекомендациями Всемирной организации здравоохранения: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$, $< 1/100$), редко ($\geq 1/10000$, $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$), частота неизвестна (по имеющимся данным установить частоту возникновения не представлялось возможным).

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы: редко – лейкопения, тромбоцитопения, агранулоцитоз, панцитопения.

Нарушения со стороны иммунной системы: редко – реакции гиперчувствительности (например, ангионевротический отек, лихорадка, анафилактическая реакция/анафилактический шок).

Нарушения метаболизма и питания: редко – гипонатриемия; частота неизвестна –

гипомагниемия, гипокальциемия вследствие тяжелой гипомагниемии, гипокалиемия вследствие гипомагниемии.

Психические нарушения: нечасто – бессонница; редко – возбуждение, агрессия, замешательство, галлюцинации, депрессия.

Нарушения со стороны нервной системы: часто – головная боль; нечасто – вертиго, парестезии, сонливость; редко – нарушение вкуса, энцефалопатия у пациентов с заболеваниями печени.

Нарушения со стороны органа зрения: редко – нечеткость зрения.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: редко – бронхоспазм.

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.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: нечасто – дерматит, сыпь, зуд, крапивница; редко – алопеция, фотосенсибилизация, мультиформная эритема, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз, острый генерализованный экзантематозный пустулез, лекарственная сыпь с эозинофилией и системными симптомами (DRESS-синдром); частота неизвестна – подострая кожная красная волчанка.

Нарушения со стороны мышечной, скелетной и соединительной ткани: редко – артралгия, миалгия, мышечная слабость.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей: редко – тубулоинтерстициальный нефрит (с возможным прогрессированием до почечной недостаточности); частота неизвестна – эректильная дисфункция.

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; кисты доброкачественные и 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.

Российская Федерация.

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения.

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

Телефон: +7 (800) 550-99-03.

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.ru

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»:

<https://www.roszdravnadzor.ru/>

4.9. Передозировка

Разовые пероральные дозы омепразола до 400 мг не вызывали каких-либо тяжелых симптомов. При приеме взрослыми 560 мг омепразола отмечалась умеренная интоксикация. При увеличении дозы скорость элиминации препарата не изменялась (кинетика первого порядка), специфическое лечение при этом не требовалось.

Симптомы

Головокружение, спутанность сознания, апатия, головная боль, дилатация сосудов, тахикардия, тошнота, рвота, метеоризм, диарея.

Лечение

Симптоматическое лечение, при необходимости промывание желудка, назначение активированного угля.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

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

Код АТХ: A02BC01

Механизм действия

Омепразол является слабым основанием. Концентрируется в кислой среде секреторных канальцев париетальных клеток слизистой оболочки желудка, активируется и ингибирует протонный насос – фермент H^+ , K^+ -АТФ-азу. 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.

Фармакодинамические эффекты

Влияние на секрецию желудочного сока

Омепразол при ежедневном пероральном применении обеспечивает быстрое и эффективное ингибирование дневной и ночной секреции соляной кислоты. Максимальный эффект достигается в течение 4 дней лечения. У пациентов с язвой двенадцатиперстной кишки 20 мг омепразола 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 20 мг омепразола при ежедневном пероральном применении поддерживает во внутрижелудочной среде значение кислотности на уровне $\text{pH} \geq 3$, в среднем, 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 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 железистых кист в желудке; кисты доброкачественные проходят 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 протонного насоса или других снижающих кислотность желудка средств 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, вероятно, также 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). Повышение концентрации CgA может оказывать влияние на результаты обследований для выявления нейроэндокринных опухолей (см. раздел 4.4). Для предотвращения данного влияния терапию ингибиторами протонного насоса необходимо приостановить, как минимум, за 5 дней до проведения исследования концентрации CgA. Если за это время концентрации CgA и гастрина не вернулись к нормальному значению, исследование следует повторить через 14 дней после прекращения приема омепразола.

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

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция и распределение

Омепразол абсорбируется в тонкой кишке, обычно в течение 3-6 часов. Биодоступность после приема внутрь составляет приблизительно 60 %. Приём пищи не влияет на биодоступность омепразола.

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

Биотрансформация

Омепразол полностью метаболизируется в печени. Основные ферменты, участвующие в процессе метаболизма - CYP2C19 и CYP3A4. Образующиеся метаболиты - сульфон, сульфид и гидроксид-омепразол не оказывают значительного влияния на секрецию соляной кислоты.

Общий плазменный клиренс составляет 0,3-0,6 л/мин. Биодоступность омепразола увеличивается приблизительно на 50 % при повторном приёме по сравнению с приемом разовой дозы.

Элиминация

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

Особые группы пациентов

Пациенты пожилого возраста

Не отмечено значительных изменений биодоступности омепразола у пожилых пациентов.

Пациенты с нарушением функции печени

У пациентов с нарушенной функцией печени отмечается увеличение биодоступности омепразола и значительное уменьшение плазменного клиренса.

Пациенты с нарушением функции почек

Не отмечено значительных изменений биодоступности омепразола у пациентов с нарушенной функцией почек.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Вспомогательные вещества

Маннитол.

Сахароза (сахар).

Натрия гидрофосфат (динатрия гидрофосфат).

Натрия лаурилсульфат.

Лактозы моногидрат.

Кальция карбонат.

Оболочка

Гипромеллоза.

Метакриловой кислоты и этакрилата сополимер.

Пропиленгликоль.

Диэтилфталат.

Цетиловый спирт.

Натрия гидроксид.

Полисорбат (ТВИН 80).

Повидон (поливинилпирролидон).

Титана диоксид.

Тальк.

Корпус капсулы

Краситель железа оксид желтый.

Титана диоксид.

Желатин.

Крышечка капсулы

Краситель железа оксид желтый.

Титана диоксид.

Желатин.

6.2. Несовместимость

Не применимо.

6.3. Срок годности (срок хранения)

3 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Хранить в защищенном от света месте, при температуре не выше 25 °С.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

По 7, 10 капсул в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 30, 60 или 100 капсул в банку полимерную с крышкой с контролем первого вскрытия.

На банку наклеивают этикетку из бумаги писчей или этикеточной, или самоклеящуюся.

Одну банку или 2, 4, 8 контурных ячейковых упаковок по 7 капсул, или 1, 2, 3, 5 контурных ячейковых упаковок по 10 капсул вместе с инструкцией по медицинскому применению помещают в картонную упаковку (пачку).

200, 400, 500, 600, 800, 1000 контурных ячейковых упаковок по 10 капсул с равным количеством инструкций по медицинскому применению помещают в коробку картонную, на которую наносят этикетку (для стационаров).

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

Особые требования отсутствуют.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация.

Акционерное общество «Усолье-Сибирский химико-фармацевтический завод» (АО «Усолье-Сибирский химфармзавод»).

665462, Иркутская обл., г. Усолье-Сибирское, северо-западная часть города, с северо-восточной стороны, в 115 м от Прибайкальской автодороги.

Тел. +7(39543)58910.

Факс: +7(39543)58908.

Электронная почта: usolpharm@usolpharm.ru

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация.

Акционерное общество «Усолье-Сибирский химико-фармацевтический завод» (АО «Усолье-Сибирский химфармзавод»).

665462, Иркутская обл., г. Усолье-Сибирское, северо-западная часть города, с северо-восточной стороны, в 115 м от Прибайкальской автодороги.

Тел. +7(39543)58910.

Факс: +7(39543)58908.

Электронная почта: usolpharm@usolpharm.ru

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

Дата первой регистрации:

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата ОМЕПРАЗОЛ доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно – коммуникационной сети «Интернет» <http://eec.eaeunion.org>.