



Кратка характеристика на продукта

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Omeprazol "Genericon" 20 mg gastro-resistant capsules, hard
Омепразол "Генерикон" 20 mg твърди стомашно-устойчиви капсули

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО

Приложение към
разрешение за употреба № 11-16384/12.07.07

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всяка твърда стомашно-устойчива капсула съдържа 20 mg омепразол (omeprazol) във вид на стомашно-устойчиви обвити гранули.

За пълния списък на помощните вещества, виж т.6.1.

709/19.12.06 *Мелни*

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Gastro-resistant capsule, hard
Твърда стомашно-устойчива капсула

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

- Язва на дванадесетопръстника
- Язва на стомаха
- Язви и ерозии на стомаха и дванадесетопръстника, свързани с нестероидни противовъзпалителни средства (НСПВС)
- В комбинирана терапия за унищожаване на *Helicobacter pylori* при пептична язвена болест
- Гастро-езофагеален рефлукс
- Симптоматична гастро-езофагеална рефлуксна болест
- Диспепсия, свързана с повишена киселинност
- Синдром на Zollinger-Ellison
- Пациенти с риск от аспирация на стомашното съдържимо под обща упойка (профилактика на киселинна аспирация)

4.2 Дозировка и начин на приложение

Капсулите се поглъщат цели с малко количество вода. Пациенти, които имат проблеми с преглъщането могат да отворят капсулите и съдържанието може да бъде погълнато или суспендирано в леко кисели течности (като сок, кисело мляко). Тази суспензия трябва да бъде приета за 30 минути. Другият начин е такива пациенти да смучат капсулата и да гълтат съдържанието ѝ. Чашата, която съдържа остатъци от съдържанието на капсулата трябва да бъде отмиа с малко количество течност (приблизително до половината от чашата) и след това да бъде изпита. Капсулите не се дъвчат и не се стриват.

Възрастни:

Язва на дванадесетопръстника

Препоръчителната доза за активна дуоденална язва е 20 mg Омепразол "Genericon" веднъж дневно. Симптомите се повлияват бързо и повечето от пациентите са излекувани за период от две седмици. За не напълно излекувани пациенти след начален курс на терапия, облекчението обикновено настъпва след още две седмици лечение.





Кратка характеристика на продукта

При пациенти с трудно повлияваща се язва на дванадесетопръстника се препоръчва 40 mg Omeprazol "Genericon" дневно. В повечето случаи излекуване настъпва след четириседмично лечение.

Язва на стомаха

Препоръчителната дневна доза е 20 mg Omeprazol "Genericon". Симптомите се повлияват бързо и повечето пациенти са излекувани за период от четири седмици. За не напълно излекувани пациенти след начален курс на терапия, облекчението обикновено настъпва след още четири седмици лечение.

При пациенти с трудно повлияваща се язва на стомаха се препоръчва 40 mg Omeprazol "Genericon" дневно. В повечето случаи излекуване настъпва след осем седмично лечение.

Язви и ерозии на стомаха и дванадесетопръстника, свързани с нестероидни противовъзпалителни средства (НСПВС)

Препоръчителната дневна доза е 20 mg Omeprazol "Genericon". Симптомите отзвучават бързо и повечето пациенти са излекувани за период от четири седмици. За не напълно излекувани пациенти след начален курс на терапия, облекчението обикновено настъпва след още четири седмици лечение. Дневна доза от 20 mg в допълнение към терапия с НСПВС се препоръчва за профилактика на стомашна и дуоденална язва или гастродуоденална ерозия при пациенти, прекарвали язва на стомаха или дванадесетопръстника и/или ерозия.

В комбинирана терапия за унищожаване на *Helicobacter pylori* при пептична язвена болест

Тройна терапия (Omeprazol "Genericon"/Кларитромицин/Амоксицилин): Препоръчителната доза за възрастни е 20 mg Omeprazol "Genericon", плюс 1 g Амоксицилин, плюс 500 mg Кларитромицин 2 пъти дневно за 7 дни или 20 mg Омепразол веднъж или два пъти дневно, предписан съвместно с 250 mg Кларитромицин и 500 mg Метронидазол, два пъти дневно в продължение на една седмица или 40 mg Omeprazol "Genericon" веднъж дневно с 500 mg Амоксицилин и 500 mg Метронидазол три пъти дневно в продължение на една седмица.

Двойна терапия: Препоръчителната доза за възрастни е 40 mg Omeprazol "Genericon" веднъж дневно плюс 1.5 g Амоксицилин (разделена в два, три приема) за 14 дни или 40 mg Omeprazol "Genericon" на ден с 500 mg Кларитромицин три пъти дневно в продължение на две седмици.

Ако пациентът е все още *H. Pylori* - позитивен независимо от лечението (тройна, двойна терапия), то последното трябва да се повтори или да бъде назначен различен дозов режим.

Гастро-езофагеален рефлукс

Препоръчителната дневна доза е 20 mg Omeprazol "Genericon". Симптомите се повлияват бързо и повечето пациенти са излекувани за период от четири седмици. За не напълно излекувани пациенти след начален курс на терапия, облекчението обикновено настъпва след още четири седмици лечение.

При пациенти с трудно повлияващ се гастро-езофагеален рефлукс се препоръчва най-често 40 mg Omeprazol "Genericon" дневно. В повечето случаи излекуване настъпва след осем седмично лечение.

За дългосрочно поддържане на пациенти с излекуван гастро-езофагеален рефлукс, препоръчаните дози са Omeprazol "Genericon" 10 mg веднъж дневно.

Симптоматична гастро-езофагеална рефлуксна болест

Препоръчаната дозировка е Omeprazol "Genericon" 20 mg веднъж на ден. Симптомите се облекчават бързо. Пациентите може да реагират добре и на 10 mg дневно, затова трябва да се определи индивидуална доза. Ако не се постигне контрол на симптомите след 4 седмици лечение с Omeprazol "Genericon" 20 mg дневно, се препоръчва допълнително изследване.





Кратка характеристика на продукта

Диспепсия, свързана с повишена киселинност

За облекчаване симптомите на пациенти с епигастрална болка / дискомфорт с или без киселини препоръчаната дозировка е Omeprazol "Genericon" 20 mg веднъж на ден. Пациентите може да реагират добре и на 10 mg дневно, поради това тази доза може да се счита като начална. Ако не се постигне контрол на симптомите след 4 седмици лечение с Omeprazol "Genericon" 20 mg дневно, се препоръчва допълнително изследване.

Синдром на Zollinger-Ellison

Препоръчителната доза е 60 mg Omeprazol "Genericon" веднъж дневно. Дозата трябва да се определи индивидуално. Състоянието на над 90% пациентите с остро заболяване, които не се повлияват от друго лечение може да бъде задоволително овладяно с дневни дози вариращи от 20 mg до 120 mg.

Доза по-голяма от 80 mg на ден, трябва да се раздели и да се дава на два приема.

Профилактика на киселинна аспирация

40 mg вечерта преди назначената хирургична процедура и 40 mg сутринта в деня на хирургията.

Деца:

Тежък гастроезофагеален рефлукс при деца над 2 годишна възраст:

Препоръчителните дози са както следва:

Тегло	Доза
10-20 kg	10 mg Omeprazol "Genericon"
>20 kg	20 mg Omeprazol "Genericon"

Дозата може да бъде коригирана до 20 mg или 40 mg, ако е необходимо.

Пациенти в напреднала възраст:

Не се налага промяна в дозировката при пациенти в напреднала възраст.

Пациенти с бъбречно увреждане:

Не е необходимо коригиране на дозата при пациенти с увредена бъбречна функция.

Пациенти с нарушена чернодробна функция:

Тъй като бионаличността и средният елиминационен полуживот се повишават при пациенти с чернодробно увреждане (с изключение на случаите на лечение на синдром на Zollinger-Ellison) максималната дневна доза следва да се ограничи до 10 mg, 20 mg.

4.3 Противопоказания

Свръхчувствителност към някоя от съставките на продукта.

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Преди лечение трябва да се изключи злокачествен процес при наличие на следните обезпокоителни симптоми (значителна загуба на телесното тегло, периодично повръщане, дисфагия, кървене или кървави изпражнения) или подозрение за язва на стомаха, тъй като лечението може да маскира симптомите и да забави поставянето на диагноза.

4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Поради намалена стомашна киселинност може да се промени абсорбцията на някои лекарства. Абсорбцията на кетоконазол ще намалее при лечение с Omeprazol "Genericon", както намалява и при лечение с други инхибитори на киселинната секреция или антагонисти.





Кратка характеристика на продукта

Тъй като омепразол се метаболизира в черния дроб посредством цитохром P450 2C19 (CYP2C19), той може да удължи елиминирането на диазепам, варфарин и фенитоин, които се метаболизират чрез чернодробно окисление. Препоръчва се да се наблюдават пациенти, приемащи фенитоин и варфарин и, ако се наложи, да се намалят дозите. Едновременното дневно перорално приложение на 20 mg Омепразол "Genericon" не променя кръвните концентрации на фенитоин при пациенти, подложени на лечение с фенитоин или времето за коагулация при тези пациенти, претърпяващи продължително лечение с варфарин.

Плазмените концентрации на омепразол и кларитромицин се повишават при съвместното им прилагане.

Резултатите, получени в резултат на серия от проучвания с омепразол и други вещества показват, че многократният орален прием на омепразол 20 mg до 40 mg не повлиява другите изоформи на CYP(2), тъй като не са установени взаимодействия с CYP1A2 (кофеин, фенацетин, теофилин), CYP 2C9 (S-варфарин, пироксикам, диклофенак и напроксен), CYP 2D6 (метопролол, пропранолол), CYP2E1 (етанол) и CYP3A субстрати (циклоспорин, лидокаин, хинидин, естрадиол, еритромицин и будезонид)..

Не е установено взаимодействие с храна и антиациди.

4.6. Бременност и кърмене

Резултатите от три проспективни, епидемиологични проучвания показват, че след приемане на омепразол не са наблюдавани нежелани реакции върху бременността или върху фетуса/новороденото дете.

Омепразол се отделя в кърмата. Съществува малка вероятност омепразол, прилаган в терапевтични дози, да оказва влияние върху детето през периода на кърмене. Въпреки това не може да се изключи потенциален риск. Лечението е показано само когато потенциалната полза за майката оправдава риска за фетуса/новороденото дете.

4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Няма информация Омепразол "Genericon" да повлиява способността за шофиране и работата с машини.

4.8. Нежелани лекарствени реакции

Стомашно-чревни нарушения

Чести ($\geq 1/100$; $< 1/10$): диария, констипация, флатуленция (с коремна болка в някои случаи), гадене и повръщане. Симптомите най-често отзвучават с продължаване на лечението.

Редки ($\geq 1/10,000$; $< 1/1,000$): Отцветяване на езика в кафяво и черно при едновременно прилагане с кларитромицин. Повечето от тези симптоми са обратими и отзвучават при спиране на лечението.

Много редки ($< 1/10,000$): сухота в устата, стоматит, кандидоза или панкреатит.

Хепато-билиарни нарушения:

Нечести ($\geq 1/1,000$; $< 1/100$): промени в стойностите на чернодробните ензими.

Много редки ($< 1/10,000$): хепатит с/без жълтеница, при пациенти с чернодробно заболяване - хепатопатия и енцефалопатия.

Нарушения на кръвотворната и лимфна системи:

Много редки ($< 1/10,000$): промени в кръвната картина, обратими промените включват левкопения или панцитопения и агранулоцитоза.





Кратка характеристика на продукта

Редки: хипохромна, микроцитна анемия при деца.

Нарушения на кожата и подкожната тъкан:

Нечести ($\geq 1/1,000$; $< 1/100$): сърбеж, обриви по кожата, алоpecia, еритема мултиформе, фоточувствителност и често изпотяване.

Редки ($\geq 1/10,000$; $< 1/1,000$): синдром на Stevens-Johnson и токсична епидермална некролиза.

Нарушения на мускулно-скелетната система:

Редки ($\geq 1/10,000$; $< 1/1,000$): мускулна слабост, миалгия, болки в ставите.

Нарушения на бъбреците:

Много редки ($< 1/10,000$): интерстициален нефрит.

Нарушения на нервната система:

Чести ($\geq 1/100$; $< 1/10$): сънливост, унесеност, безсъние, световъртеж, главоболие.

Редки ($\geq 1/10,000$; $< 1/1,000$): парестезия и леко объркване. Нарушения на паметта и халюцинации (предимно при много тежко болни пациенти и пациенти в напреднала възраст).

Много редки ($< 1/10,000$): възбудимост, депресия, (предимно при много тежко болни пациенти и пациенти в напреднала възраст).

Нарушения на сетивните органи:

Нечести ($\geq 1/1,000$; $< 1/100$): смущения в зрението (замъгляване, загуба на зрение, намаляване на зрителното поле) и нарушение в слуха (шум в ушите), промяна във вкуса.

Реакции на свръхчувствителност:

Много редки ($< 1/10,000$): уртикария, покачване на температурата, ангиоедем, бронхоспазъм, анафилактичен шок, алергичен васкулит, треска.

Други нежелани реакции:

Нечести ($\geq 1/1000$; $< 1/100$): периферен едем.

Много редки ($< 1/10,000$): хипонатриемия, гинекомастия.

4.9 Предозиране

Предозиране с омепразол е докладвано рядко. Дози до 560 mg са описани в литературата, а така също и индивидуални перорални дози до 2400 mg. Гадене, повръщане, виене на свят, коремна болка, диария и главоболие са съобщени след предозиране с омепразол. В индивидуални случаи са наблюдавани апатия, депресия и объркване. Симптомите са краткотрайни и от клиничните резултати не може да бъде направено заключение.

Степента на елиминиране остава непроменена при високи дози и не е необходимо специфично лечение.

5 ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: инхибитори на протонната помпа

АТС код: A02BC01

Омепразол е слаба основа, която се концентрира и превръща в активна форма в силно киселинната среда на междуклетъчните каналчета в париеталните клетки, където инхибира ензима H^+ , K^+ -АТФ-аза киселинната помпа. Този ефект върху последния етап от процеса на образуване на стомашна киселина зависи от дозата и осигурява високо ефективна инхибиране стимулираната и базалната киселинна секреция, независимо от стимула. Омепразол няма ефект





Кратка характеристика на продукта

върху рецепторите на ацетилхолин, гастрин и хистамин. Не са наблюдавани клинично значими фармакодинамични ефекти, освен този, дължащ се на инхибирането на киселинна секреция.

При перорално приложение 20 mg омепразол потиска бързо киселинната секреция, както през деня така и през нощта, а максимален ефект е регистриран след 4 дни. При пациенти с язва на дванадесетопръстника, 20 mg омепразол умерено редуцира киселинността до най-малко 80% за период от 24 часа. Максималната редукция на киселинната секреция (70%) след стимулация с пентагастрин е настъпила 24 часа след прием на омепразол.

Пероралното приложение на омепразол 20 mg покачва рН (> 3) при пациенти с гастродуодеална язва за около приблизително 17 часа.

По същия начин интравенозното приложение на омепразол ускорява процеса на дозозависима инхибиция на производството на стомашна киселина. Препоръчва се доза от 40mg i.v. за незабавно намаляване на стомашната киселинност, подобно на повтаряща се орална доза от 20mg. Тя води до незабавно намаляване на стомашната киселинност и среден спад за 24 часа с около 90%, както при венозните инжекции, така и при инфузионните разтвори.

Helicobacter pylori е свързан с развитието на язва на стомаха и дванадесетопръстника в 95% от случаите респ. 70% от пациентите са били заразени с него. Това е ключов фактор за развитието на гастрит. *H.pilory* в съчетание със стомашната киселина представляват основен фактор за развитие на пептична язвена болест. *H.pilory* има каузален ефект в развитието на рак на стомаха.

Елиминирането на *Helicobacter pylori* с противомикробни лекарствени продукти и омепразол е свързано с бързо облекчение на симптомите, високи нива на възстановяване на мукозните лезии и дълготрайна ремисия на пептичната язва, в резултат на което са редуцирани усложнения като стомашно-чревни хеморагии и нуждата от продължителна антисекреторна терапия.

Други ефекти, които се дължат на киселинна инхибиция

Има данни за изолирани случаи на развитие на glandуларни кисти при продължително лечение, като резултат от силното потискане на киселинната секреция. Те са доброкачествени и обратими.

В резултат на редукция на стомашна киселина, което може да се дължи на различни причини, включително прием на инхибитори на протонната помпа, броят на бактериите, които нормално присъстват в стомашно-чревния тракт може да нарастне. Лечението с лекарствени продукти, потискащи секрецията на стомашна киселина може да доведе до незначително повишение на риска от стомашно-чревни инфекции като салмонела и кампилобактер.

5.2. Фармакокинетични свойства

Абсорбция и разпределение

Омепразол е киселинно неустойчив и се предписва в капсули, под формата на устойчиви на стомашния сок гранули. Абсорбира се в тънките черва за период от 3-6 часа. Бионаличността е приблизително 35% след единична доза. Тя нараства до 60% след повтарящо се, единично дневно дозиране.

Обемът на разпределение при здрави хора е приблизително 0.3 l/kg. Подобна стойност се наблюдава и при пациенти с бъбречна недостатъчност. При пациенти в напреднала възраст и пациенти с чернодробна недостатъчност, обемът на разпределение е малко по-нисък. Свързването на омепразол с плазмените протеини е около 95% и средния елиминационен полуживот е по-малко от час, като не са наблюдавани промени след продължителна употреба.

Потискането на киселинната секреция е свързано с областта под кривата на зависимостта на плазмените концентрации на омепразол от времето (AUC), а не с фактическите плазмени концентрации в даден момент.





Кратка характеристика на продукта

Метаболизъм и отделяне

Омепразол се метаболизира изцяло от системата на цитохром P450(CYP), главно в черния дроб. Основната част на метаболизма му зависи от полиморфно изразената специфична изоформа CYP2C19 (S-мефенитоин хидроксилаза), отговорна за образуването на хидроксиметопразол, основният метаболит в плазмата. Нито един от метаболитите не влияе върху отделянето на стомашна киселина (сулфон-, сулфид- и хидроксиметопразол). Почти 80% от пероралната доза се отделя като метаболити в урината, а останалата част се намира в изпражненията, като произхожда предимно от жлъчната секреция. Двата основни метаболита в урината са хидроксиметопразол и съответната карбонова киселина.

Елиминирането на омепразол не се променя при пациенти с нарушена бъбречна функция. Средният елиминационен полуживот е повишен при пациенти с нарушена чернодробна функция, но омепразол не показва тенденции към кумулиране при перорално приемане веднъж на ден.

Деца:

Фармакокинетичният профил при деца (над 1 година) е идентичен с този, наблюдаван при възрастните в препоръчани дози.

5.3 Предклинични данни за безопасност

При карциногенни проучвания при плъхове, третирани с омепразол, са наблюдавани хиперплазия и карциноми при стомашната ECL-клетка. Тези резултати са предизвикани от ясно изразена хипергастронемия за продължително време в резултат от потискането на киселинната секреция.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества:

hypromellose, talc, titanium dioxide (E-171), methacryl acid ethyl acrylate copolymer, triethylcitrate, sugar spheres (sucrose, maize starch)

Капсулна обвивка:

titanium dioxide (E-171), gelatine, shellac, propylene glycol, ammonia solution, potassium hydroxide, black iron oxide (E172)

6.2 Несъвместимости

Няма известни.

6.3 Срок на годност

2 години

6.4 Специални условия на съхранение

Да се съхранява под 25°C!

Полиетиленовите опаковки трябва винаги да бъдат плътно затворени





Кратка характеристика на продукта

6.5 Данни за опаковката

Полиетиленова (HDPE) опаковка, с капачка на винт, съдържаща сушител, със 7, 14, 28 твърди стомашно-устойчиви капсули.

6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне и работа

Няма специални изисквания.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Genericon Pharma GmbH
Hafnerstraße 211, 8054 Graz
Austria

8. РЕГИСТРАЦИОНЕН № В РЕГИСТЪРА ПО ЧЛ. 28 ОТ ЗЛХМ

9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ ЗА УПОТРЕБА

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

Декември, 2005 г.

