



## Кратка характеристика на продукта

### 1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Omeprazol "Genericon" 10 mg gastro-resistant capsules, hard

Омепразол "Генерикон" 10 mg твърди стомашно-устойчиви капсули

### 2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всяка твърда стомашно-устойчива капсула съдържа 10 mg омепразол (omeprazol) във вид на стомашно-устойчиви обвити гранули.

За пълния списък на помощните вещества, виж т. 6.9.

### 3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Gastro-resistant capsule, hard

Твърда стомашно-устойчива капсула

### 4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

#### 4.1 Терапевтични показания

Omeprazol "Genericon" 10 mg е показан при:

- Краткотрайно лечение на диспепсия, свързана с повишена киселинност
- Продължителна поддържаща терапия за превенция на рекурентен рефлукс езофагит
- Продължително лечение за превенция на рекурентна дуоденална и стомашна язва.

Опитът по отношение на безопасността е ефективността на омепразол при деца е малък.

Омепразол "Генерикон" се препоръчва при деца над 2-годишна възраст с улцерозен езофагит.

#### 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 отгмита с малко количество течност (приблизително до половината от чашата) и след това да бъде изпита. Капсулите не се дъвчат и не се стриват.

#### Възрастни:

##### Продължително лечение за превенция на дуоденална и стомашна язва

Обичайната доза е 1 стомашно-устойчива капсула от 10 mg еднократно дневно.

##### Диспепсия, свързана с повишена киселинност

Обичайната доза е 10 mg до 20 mg дневно, 2 до 4 седмици. Ако проблемите не изчезнат до 4 седмици или ако рецидивират малко след отзвучаването им, диагнозата на пациента трябва да се преразгледа.

##### Продължително поддържащо лечение за профилактика на рецидив на гастро-езофагеална рефлуксна болест

За профилактика на симптоматичен или ендоскопски негативна гастро-езофагеална рефлуксна болест препоръчителната дневна доза е 1 стомашно-устойчива капсула от 10 mg преди закуска. Ако симптомите се появят отново, дозата трябва да се повиши. За профилактика на рецидив на ерозивен езофагит препоръчваната дневна доза е 1 стомашно-устойчива капсула от 20 mg преди закуска.

Безопасността и ефективността на поддържащото лечение са доказани в пролонгирано на 12 месеца.

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА	
Приложение към разрешение за употреба	
№/Дата на КЛП	11-0481/20.08.07 Подпис:
1/15.06.07	





## Кратка характеристика на продукта

### Деца:

Тежък гастро-езофагеален рефлукс при деца над 2 годишна възраст:

Препоръчителните дози са, както следва:

Тегло	Доза
10-20 kg	10 mg дневно
>20 kg	20 mg дневно

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 средния елиминационен полуживот се повишават при пациенти с чернодробно увреждане, максималната дневна доза следва да се ограничи до 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 антиациди.

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 орално приложение на 20 mg Omeprazol "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.

При съвместно лечение на Omeprazol "Genericon" с кларитромицин се повишават плазмените концентрации.

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, фенацитин, 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





## Кратка характеристика на продукта

Резултатите от три проспективни, епидемиологични проучвания показват, че след приемане на омепразол не са наблюдават 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 вероятност 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, обратима тромбоцитопения, левкопения или панцитопения и агранулоцитоза.

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, умесеност, 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:





## Кратка характеристика на продукта

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 орални 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 киселинна 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 високоефективно инхибиране на стимулираната и базалната киселинна секреция, независимо от стимула. Омепразол няма ефект върху рецепторите на ацетилхолин, гастрин и хистамин. Не са наблюдавани клинично значими фармакодинамични ефекти, освен този, дължащ се на инхибирането на киселинна секреция.

При пероралното 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 гастро-дуодеална 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 40 mg i.v. за незабавно намаляване на стомашната киселинност, подобно на повтаряща се перорална доза от 20 mg. 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. pylori* в съчетание със стомашната киселина представляват основен фактор за развитие на пептична язвена болест. *H. pylori* има каузален ефект в развитието на рак на стомаха.

Елиминирането на *H. pylori* с противомикробни лекарствени продукти и омепразол е свързано с бързо облекчение на симптомите, високи нива на възстановяване





## Кратка характеристика на продукта

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 glandularни 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.

### 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 оралната 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 хидроксиомепразол 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.





## Кратка характеристика на продукта

### 6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

#### 6.1 Списък на помощните вещества:

hypromellose, talc, titanium dioxide (E-171), methacrylic 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.

#### 6.5 Данни за опаковката

Полиетиленова (HDPE) опаковка, с капачка на винт, съдържаща сушител, с 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.

