

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

SOPRAL 20 mg gastro-resistant capsules, hard

СОПРАЛ 20 mg стомашно-устойчиви капсули, твърди

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА	
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1	
Към РУ	П-4950, 21.05.2009
Одобрено:	35/14.04.09

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всяка капсула съдържа лекарствено вещество омепразол (*omeprazole*) 20 mg.

Помощно вещество: захароза.

За пълния списък на помощните вещества, вж. точка 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Стомашно-устойчива капсула, твърда.

Твърда желатинова капсула № 2; тяло – светлосиньо прозрачно; капаче – синьо непрозрачно.

Капсулно съдържимо: сферични, еднакви и без видими дефекти гранули с диаметър от 1,25 mm до 1,60 mm.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

- Лечение на гастро-езофагеална рефлуксна болест (вкл. ерозивен езофагит, рефлукс езофагити);
- Лечение на дуоденална и доброкачествена стомашна язва, включително язви, предизвикани от нестероидни противовъзпалителни средства (НСПВС);
- Ерадикация на *Helicobacter pylori* (в комбинация с антибиотици и химиотерапевтици);
- Синдром на Zollinger-Ellison;
- Профилактика на киселинна аспирация по време на обща анестезия;
- Облекчаване на диспептични симптоми от рефлуксен и/или язвен тип поради висока киселинност;
- Лечение и профилактика на свързаните с употребата на НСПВС доброкачествени стомашни и дуоденални язви и гастродуоденални ерозии при пациенти с предшестващи гастродуоденални лезии и необходимост от продължително лечение с НСПВС.

4.2 Дозировка и начин на приложение

Възрастни

Лечение на гастро-езофагеална рефлуксна болест (вкл. ерозивен езофагит, рефлукс езофагити)

Препоръчаната доза е 20 mg еднократно дневно сутрин на гладно. Болшинството пациенти се повлияват след 4-седмичен курс. За пациенти, които не са напълно излекувани след началния курс, се препоръчва повторен курс на лечение от 4-8-седмици.

При пациенти с *рефлукс-езофагит*, резистентни на обичайното лечение, омепразол се прилага в доза 40 mg еднократно дневно сутрин на гладно. Лечението обикновено е 8 седмици.

За профилактика на рецидив на *ерозивен езофагит* се прилага по 20 mg еднократно дневно преди хранене.

Лечение на дуоденална и доброкачествена стомашна язва, включително язви, предизвикани от нестероидни противовъзпалителни средства (НСПВС)

Обичайната доза е 20 mg еднократно дневно. Симптомите се повлияват бързо и повечето пациенти с дуоденална язва се излекуват след 4 седмици. Болшинството пациенти с доброкачествена стомашна язва се излекуват след 8 седмици. При по-тежки случаи или рецидив, дневната доза може да се повиши до 40 mg дневно.

При пациенти с анамнеза за рецидивираща дуоденална язва се препоръчва продължителна терапия с доза от 20 mg дневно.

Пациенти с *Helicobacter pylori* инфекция, по-млади пациенти (под 60 години), пациенти, чиито симптоми персистират повече от една година и пушачи са изложени на риск от рецидив на язвата. Тези пациенти се нуждаят от първоначална продължителна терапия с 20 mg еднократно дневно.

Ерадикация на *Helicobacter pylori* (в комбинация с антибиотици и химиотерапевтици)

Омепразол се препоръчва в доза по 40 mg веднъж дневно или по 20 mg 2 пъти дневно, комбиниран по следните схеми:

Схеми на тройно комбинирана терапия при дуоденална язва:

Омепразол се препоръчва в доза по 40 mg веднъж дневно или по 20 mg 2 пъти дневно, комбиниран с:
Амоксицилин 500 mg + метронидазол 400 mg 3 пъти дневно в продължение на 7 дни;

Кларитромицин 250 mg + метронидазол 400 mg (или тинидазол 500 mg) 2 пъти дневно в продължение на 7 дни;

Амоксицилин 1 g + кларитромицин 500 mg 2 пъти дневно в продължение на 7 дни.

Схеми на двойно комбинирана терапия при дуоденална язва:

Омепразол се препоръчва в доза по 40 mg веднъж дневно или по 20 mg 2 пъти дневно, комбиниран с:
Амоксицилин 750 mg – 1 g 2 пъти дневно в продължение на 2 седмици.

Кларитромицин 500 mg 3 пъти дневно в продължение на 2 седмици.

Схеми на двойно комбинирана терапия при стомашна язва:

Омепразол се препоръчва в доза по 40 mg веднъж дневно или по 20 mg 2 пъти дневно, комбиниран с:
Амоксицилин 750 mg – 1 g 2 пъти дневно в продължение на 2 седмици.

При всяка схема, ако симптомите се възобновят и пациентът е все още *HP*-позитивен, независимо от лечението, то може да се повтори или да се използва някоя от алтернативните схеми.

Профилактика на киселинна аспирация по време на обща анестезия

За пациенти, изложени на риск от аспирация на стомашно съдържимо по време на обща анестезия, препоръчваната доза е 40 mg вечерта преди операцията и на следващия ден 40 mg 2-6 часа преди операцията.

Синдром на Zollinger-Ellison

Препоръчителната начална доза е 60 mg веднъж дневно. Дозата трябва да се определя индивидуално и лечението да продължи толкова, колкото е клинично показано. При 90% от пациентите с тежко заболяване, които не са се повлияли от други видове лечение се наблюдава добър ефект в дози от 20-120 mg дневно. При необходимост от лечение с дози над 80 mg дневно, дозата трябва да се раздели на 2 приема дневно.

Облекчаване на диспептични симптоми от рефлуксен и/или язвен тип поради висока киселинност

Обичайната доза е 20 mg веднъж дневно за период от 2-4 седмици в зависимост от тежестта и продължителността на симптомите.

При отсъствие на ефект след 4-седмично лечение се препоръчва допълнително изследване и преоценка на лечението.

Лечение и профилактика на свързаните с употребата на НСПВС доброкачествени стомашни и дуоденални язви и гастродуоденални ерозии при пациенти с предшестващи гастродуоденални лезии и необходимост от продължително лечение с НСПВС

Препоръчителната доза е 20 mg еднократно дневно.

Пациенти над 65-годишна възраст

Не се изисква коригиране на дозата при пациенти в напреднала възраст.

Деца с тежък гастроезофагиален рефлукс

При деца с тегло над 20 kg омепразол се препоръчва в доза 20 mg дневно.

При необходимост дозата може да се увеличи до 40 mg в продължение на 4-12 седмици.

Лечението трябва да се започне от педиатър.

Пациенти с нарушена бъбречна функция

При пациенти с нарушена бъбречна функция не се изисква коригиране на дозата.

Пациенти с нарушена чернодробна функция

Тъй като бионаличността и времето на полуелиминиране може да се повишат при пациенти с нарушена чернодробна функция, е необходимо коригиране на максимална дневна доза до 20 mg.

За пациенти, които не могат да преглъщат Сопрал капсули

Капсулите могат да се отварят и съдържанието им може да се гълта директно с половин чаша вода или да се разбърква в 10 мл негазирана вода, плодов сок с рН под 5, напр. ябълков, портокалов,

ананасов сок или кисело мляко и да се поглъща след леко разбъркване. Дисперсията трябва да се приема веднага или в рамките на 30 минути. Да се разбърква непосредствено преди изпиване и да се изплаква с половин чаша вода и да се изпива. Важно е да се отбележи, че съдържанието на капсулите не трябва да се стрива или дъвче.

4.3 Противопоказания

- Свръхчувствителност към активното или някое от помощните вещества.
- Малигнена стомашна язва.
- Омепразол, подобно на останалите инхибитори на протонната помпа не трябва да се назначава едновременно с атазанавир (виж т.4.5).

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

- Понижената киселинност на стомашния сок, дължаща се на прилагането на различни средства, включително инхибитори на протонната помпа, повишава броя на бактериите, обичайно присъстващи в стомашно-чревния тракт. Лечението с намаляващи киселините средства може слабо да повиши риска от стомашно-чревни инфекции като *Salmonella* и *Campylobacter*.
- При съмнения за стомашна язва трябва да се изключи вероятността за малигнизация, преди започване на лечение с омепразол, тъй като лечението може да маскира симптомите и да забави диагностицирането.
- Лекарственият продукт съдържа като помощно вещество захароза. Пациенти с редки наследствени проблеми на непоносимост към фруктоза, глюкозо-галактозна малабсорбция, или захарозо-изомалтозен дефицит не трябва да приемат лекарството.

4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

- Както и при лечение с други инхибитори на киселинната секреция поради намалена стомашна киселинност, резорбцията на кетоназол или итраконазол може да се понижи при едновременно приложение с омепразол.
- Тъй като омепразол се метаболизира в черния дроб посредством цитохром Р 450, това може да увеличи времето на полуелиминиране на диазепам, фенитоин и варфарин. Препоръчва се наблюдение на пациентите, приемащи варфарин или фенитоин, като може да се наложи и редуциране на дозата на варфарин или фенитоин. Въпреки това едновременното лечение с омепразол 20 mg дневно не променя концентрацията на фенитоин в кръвта при пациенти на продължително лечение с фенитоин. По подобен начин, едновременното лечение с омепразол 20 mg дневно не променя коагулационния статус при пациенти на продължително лечение с варфарин.
- Няма данни за взаимодействие на омепразол с фенацетин, теофилин, кофеин, пропранолол, метопролол, циклоспорин, лидокаин, хинидин, пироксикам, диклофенак, напроксен, естрадиол или антиациди при едновременното им приложение.
- Плазмените концентрации на омепразол и кларитромицин се повишават при едновременно им прилагане. Това се приема за полезно взаимодействие при ерадикация на *Helicobacter pylori*.
- Няма данни за взаимодействие на омепразол с метронидазол или амоксицилин. Тези антибиотици се използват едновременно с омепразол за ерадикация на *Helicobacter pylori*.
- Едновременното приложение на омепразол и дигоксин при здрави лица води до 10% повишение на бионаличността на дигоксин.
- Едновременното приложение на омепразол (40 mg веднъж дневно) с атазанавир 300 mg/ритонавир 100 mg при здрави доброволци води до съществени промени във фармакокинетиката на атазанавир (приблизително 75% намаление на AUC, C_{max} и C_{min}), които не се компенсират от повишаване на дозата на атазанавир до 400 mg. Инхибитори на протонната помпа включително и омепразол не трябва да се назначават едновременно с атазанавир (виж т.4.3).
- Едновременното приложение на омепразол и такролимус може да повиши серумните нива на такролимус.
- Резорбцията на омепразол не се повлиява от приема на алкохол или храна.

4.6 Бременност и кърмене

Анализът на резултатите от епидемиологични проучвания показва, че липсват данни за неблагоприятни ефекти на омепразол върху протичането на бременността или върху здравето на плода. Омепразол се излъчва в кърмата, но е малко вероятно да повлияе върху кърмачето при използване в терапевтични дози.

Независимо от това, омепразол може да бъде прилаган по време на бременност и кърмене само ако ползата от употребата превишава потенциалния риск.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Сопрал не повлиява способността за шофиране и работа с машини.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Нежеланите лекарствени реакции са описани по-долу, класифицирани по органи и системи и по честота. Нежеланите реакции се класифицират по честота по следния начин: много чести ($\geq 1/10$), чести ($\geq 1/100$ и $<1/10$), нечести ($\geq 1/1\,000$ и $<1/100$), редки ($\geq 1/10\,000$ и $<1/1\,000$) и много редки ($<1/10\,000$), включително единични съобщения.

Омепразол се понася добре и нежеланите реакции обикновено са леки и преходни.

Възможните нежелани реакции при приложение на омепразол са следните:

Изследвания: редки - хипонатриемия.

Нарушения на кръвта и лимфната система: редки - левкопения, тромбоцитопения, агранулоцитоза и панцитопения.

Нарушения на нервната система: чести – главоболие; нечести - замаяност, световъртеж, слабост, парестезия, сънливост, безсъние.

Нарушения на очите: нечести – нарушения в зрението.

Нарушения на ухото и лабиринта: нечести – шум в ушите.

Стомашно-чревни нарушения: чести - диария, запек, болки в корема, гадене, повръщане и метеоризъм; редки - сухота в устата, стоматит и стомашно-чревна кандидоза.

Нарушения на бъбреците и пикочните пътища: много редки – интерстициален нефрит.

Нарушения на кожата и подкожната тъкан: нечести – обрив, сърбеж, уртикария; редки - фоточувствителност, булозен обрив, еритема мултиформе, синдром на Stevens-Johnson, токсична епидермална некролиза (ТЕН), алопеция.

Нарушения на мускулно-скелетната система и съединителната тъкан: редки - мускулна слабост, артралгия, миалгия.

Общи нарушения с ефекти на мястото на приложение: нечести – неразположение; редки - засилено потоотделяне, периферни отоци, вкусови нарушения, оцветяване на езика в кафяво и черно при едновременно прилагане с кларитромицин, което отзвучава при спиране на лечението.

Нарушения на имунната система: редки - реакции на свръхчувствителност, напр. треска, бронхоспазм, ангиоедем, анафилактичен шок.

Хепато-билиарни нарушения: нечести – повишаване на чернодробните ензими; редки - енцефалопатия при пациенти с предшестващо тежко чернодробно заболяване, хепатит с или без жълтеница, чернодробна недостатъчност.

Нарушения на възпроизводителната система и гърдата: редки - гинекомастия, импотентност.

Психични нарушения: редки - обратими състояния на обърканост, безпокойство, разстройства, възбуда, агресия, депресия и халюцинации, предимно при тежко болни пациенти.

4.9 Предозиране

Предозирането с омепразол е рядко. В литературата са описани случаи на прием в дози до 560 mg и има единични съобщения за еднократни перорални дози до 2400 mg омепразол (120 пъти над обичайно препоръчителните клинични дози). Съобщава се за гадене, повръщане, замаяност, болки в корема, диария и главоболие при предозиране с омепразол. Описват се и единични случаи с апатия, депресия и обърканост.

Симптомите, описани във връзка с предозиране с омепразол са преходни и не се съобщава за тежки последици, дължащи се на омепразол. 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 превръща в активна форма в киселата среда на интрацелуларните каналчета на париеталната клетка, където инхибира ензима Н/К АТФ-аза. По този начин се потиска действието на протонната помпа, отговорна за секрецията на солна киселина – базална и стимулирана. Омепразол не оказва влияние върху ацетилхолинови, гастринови и хистаминови рецептори. Не са наблюдавани клинично-значими фармакодинамични ефекти, освен този, дължащ се на инхибирането на киселинната секреция.

При инфекция с *Helicobacter pylori* се появява възпаление в стомашната и дуоденалната лигавица и заедно с повишената солнокисела секреция се създават условия за образуване на ерозии и язви. Комбинираната терапия на омепразол с антибактериални продукти води до ерадикация на *Helicobacter pylori* в 80-90%, потискане на секрецията на солна киселина и повишаване устойчивостта на лигавицата.

5.2 Фармакокинетични свойства

Резорбция

Омепразол е неустойчив в кисела среда и се прилага в капсули, под формата на устойчиви на стомашния сок гранули. Резорбира се бързо в тънките черва. Максимални плазмени концентрации се достигат след 3-6 часа. Бионаличността на омепразол след еднократна доза е около 35%. След многократно приложение веднъж дневно, бионаличността се увеличава до около 60%. Едновременното приемане на храна не оказва влияние върху бионаличността му.

Разпределение

Омепразол се свързва с плазмените протеини до 97%. Обемът на разпределение при здрави доброволци е приблизително 0,3 l/kg. Подобни стойности се наблюдават и при пациенти с бъбречна недостатъчност. При пациенти в напреднала възраст и при пациенти с чернодробни увреждания, обемът на разпределение е малко по-нисък.

При пациенти с увредена чернодробна функция площта под кривата (AUC) се увеличава, но не се установява тенденция към кумулиране на омепразол.

Метаболизъм

Метаболизира се изцяло от системата на цитохром Р 450, основно в черния дроб. Метаболитите, идентифицирани в плазмата, са сулфон, сулфид и хидрокси-омепразол, като тези метаболити не оказват значим ефект върху киселинната секреция.

Екскреция

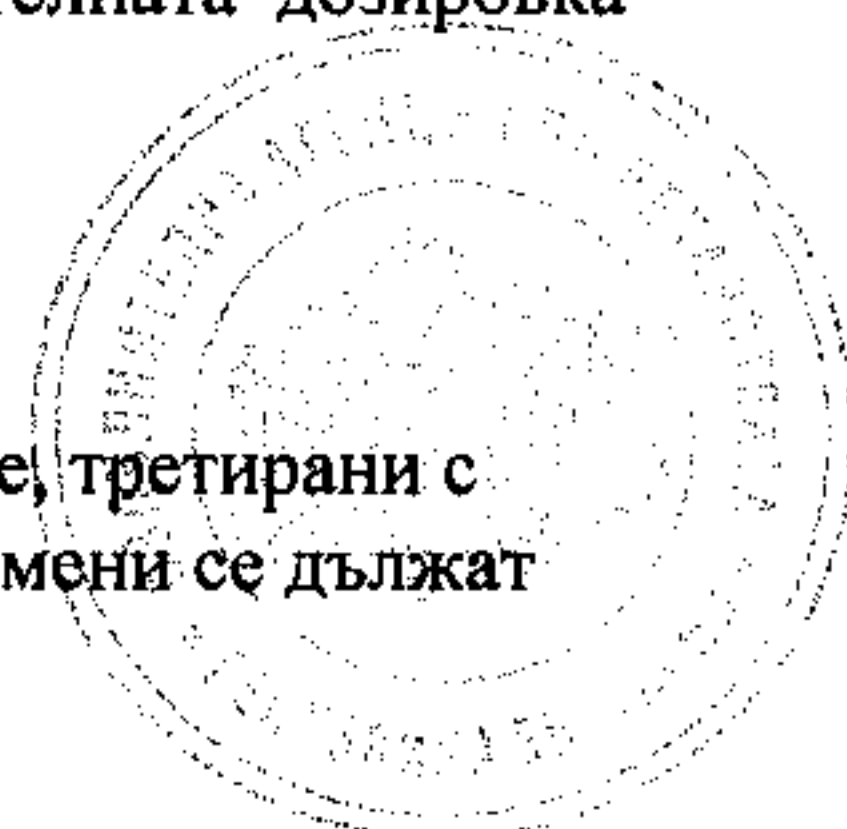
Омепразол се екскретира под формата на метаболити, като 80% от метаболитите се екскретират с урината, а останалите - с фекалиите. Двата главни метаболита в урината са хидрокси-омепразол и съответстващата карбоксилна киселина. Времето на полуживот при здрави доброволци е 0,5-1 час. Времето на полуживот е удължено при пациенти с нарушена чернодробна функция, но омепразол не показва тенденция към кумулиране при еднократен прием дневно.

Фармакокинетика при деца

Ограничените данни за деца на възраст 0-16 години показват, че в препоръчителната дозировка фармакокинетиката е подобна на тази при възрастни.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Наблюдавани са хиперплазия на стомашните ECL-клетки и карциноиди при плъхове, третирани с омепразол през целия им живот или подложени на частична фундектомия. Тези промени се дължат



на продължителната хипергастринемия, вследствие инхибирането на киселинността, а не вследствие прякото въздействие на дадено индивидуално лекарство.

Изследвания с омепразол при плъхове в дози от 35 до 345 пъти по-високи от тези при хора показват липса на вреден и токсичен ефект върху репродуктивността на животните.

Изследвания при бременни плъхове показват, че омепразол не притежава тератогенна активност в дози 345 пъти по-високи от тези при хора.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Капсулно съдържимо: неутрални пелети (захароза, царевично нишесте, пречистена вода), натриев лаурилсулфат, динатриев фосфат, безводен; манитол, хидроксипропилметил целулоза, макрогол 6000, талк, полисорбат 80, титанов диоксид, еудражит® L30-D55.

Капсулна обвивка: E 132, E171, желатин.

6.2 Несъвместимости

Не са установени.

6.3 Срок на годност

3 години

6.4 Специални условия на съхранение

В оригиналната опаковка, за да се предпази от светлина и влага.

Да се съхранява под 25°C.

Да се съхранява на място, недостъпно за деца!

6.5 Данни за опаковката

7 стомашно-устойчиви капсули, твърди в блистер от твърдо, бяло, непрозрачно PVC/алуминиево фолио; по 2 или 4 блистера в картонена кутия, заедно с листовка.

6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне и работа

Няма специални изисквания.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

СОФАРМА АД

ул. Илиенско шосе 16

1220 София, България

8. НОМЕР НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Рег. № 9700217/26.08.2003

9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ/ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

26.08.2003



10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

Април 2009

