

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА ULCOPROL

1. ТЪРГОВСКО ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ ULCOPROL

2. КОЛИЧЕСТВЕН И КАЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Лекарствено вещество в 1 капсула: Omeprazole 20 mg

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Стомашно-устойчиви капсули

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1. ПОКАЗАНИЯ

- Язвена болест на дванадесетопръстника и стомаха;
- Дуоденална и стомашна язва, свързани с приложение на нестероидни противовъзпалителни средства;
- Гастроезофагеална рефлуксна болест;
- Продължително лечение на състояния, свързани с патологична хиперсекреция (синдром на Zollinger – Ellison, мултиплена ендокринна аденоматоза, системна мастоцитоза);
- Профилактика на рецидиви от дуоденална и стомашна язва, свързани с приложение на НСПВС;
- В комплексната терапия за ерадикация на *Helicobacter pylori*;
- При пациенти, изложени на риск от аспириране на стомашно съдържимо при обща анестезия.

4.2. ДОЗИРОВКА И НАЧИН НА ПРИЛОЖЕНИЕ

Продуктът се прилага по лекарско предписание!

- За лечение на язвена болест на стомаха и дванадесетопръстника - възрастни - 20-40 mg веднъж дневно в продължение на 4-8 седмици;
- За лечение на гастроезофагеална рефлуксна болест - 20-40 mg един път дневно в продължение на 4-8 седмици;
- За лечение на синдром на Zollinger – Ellison - 60 mg еднократно дневно. При нужда дозата може да бъде увеличена до 120 mg дневно, разделена на два приема.
- За ерадикация на *Helicobacter pylori* - 20-40 mg дневно в един или два приема в продължение на 7 или 14 дни в зависимост от прилаганата лекарствена комбинация.
- При пациенти, изложени на риск от аспириране на стомашно съдържимо при обща анестезия – 40 mg вечерта преди операцията, последвани от 40 mg сутринта в деня на операцията.

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО	
Приложение към разрешение за употреба № 11-9442/03.08.07	
660/13.07.07	<i>Мендел</i>



Ulcorgol стомашно устойчиви капсули, се приемат през устата сутрин на гладно, цели, без да се дъвчат.

Пациенти в напреднала възраст - не се налага корекция на дозите.

Деца над 7 годишна възраст или телесно тегло над 20 kg – 20 mg дневно. При необходимост дозата може да се увеличи на 40 mg дневно.

Бъбречни увреждания – при пациенти с хронични увреждания на бъбреците с креатининов клирънс между 10 и 62 ml/min/1.73 m², отделянето на продукта е както при здрави доброволци и не се налага корекция на дозата.

Чернодробни увреждания – бионаличността и времето на полуелиминиране на продукта са удължени и дневната доза не трябва да надвишава 20 mg.

4.3. ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

Свръхчувствителност към активното или някое от помощните вещества.

4.4. СПЕЦИАЛНИ ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ И СПЕЦИАЛНИ ПРЕДУПРЕЖДЕНИЯ ЗА УПОТРЕБА

Преди прилагането на продукта е необходимо да се изключи злокачествено заболяване на стомаха и хранопровода.

Продуктът се прилага с внимание при хронични чернодробни заболявания. В тези случаи се налага намаляване на дозата на Ulcorgol, поради увеличаване му полуживот. В хода на лечението трябва да се следят стойностите на алкалната фосфатаза, серумната аланин аминотрансфераза (ALAT/SGOT) и серумната аспартат аминотрансфераза (ASAT/SGOT), които могат да се увеличат под влияние на Ulcorgol.

Диализата при пациенти с бъбречна недостатъчност няма ефект върху фармакокинетичните свойства на продукта.

Серумният гастрин също може да се увеличи на първата или втората седмица от лечението, което се дължи на намалената киселинна секреция, след което се възстановява.

Лекарственият продукт съдържа като помощно вещество захароза, която е неподходяща при хора с вродена непоносимост към фруктозата, глюкозен/галактозен синдром на малабсорбция или захарозно/изомалтазен дефицит.

4.5. ЛЕКАРСТВЕНИ И ДРУГИ ВЗАИМОДЕЙСТВИЯ

Ulcorgol инхибира чернодробната цитохром P-450 ензимна система, във връзка с което се намесва в метаболизма на други лекарствени средства. От друга страна той повишава стомашното рН и има възможност да промени бионаличността на всички лекарства, чиято резорбция е рН зависима. Ulcorgol може да предотврати разграждането на киселинно лабилните лекарства и намалява резорбцията на лекарствените продукти, изискващи ниско рН за резорбцията си.



При едновременно лечение с кларитромицин плазмените концентрации на продукта се увеличават.

Има данни, че продуктът забавя резорбцията на ампицилинови естери, железни соли, кетоконазол и итраконазол.

Във връзка с ефектите върху чернодробния метаболизъм, той забавя елиминирането, удължава биологичния полуживот и увеличава плазмената и тъканна концентрация на аминопирин, фенитоин, диазепам и антикоагулантите. При приемане на антикоагуланти се препоръчва редовен контрол на протромбиновото време поради опасност от кървене!

При едновременно прилагане с костномозъчни инхибитори, може да се усили левкопеничното действие и/или тромбоцитопеничният ефект на двата продукта.

Приемането на антиацидни средства и метоклопрамид не променя резорбцията на Ulcorgol.

Бионаличността на амоксицилин не се повлиява от предизвикания от Ulcorgol хипоацидитет.

Продуктът не взаимодейства с пропранолол, теофилин, метопролол, лидокаин и хинидин.

При едновременно приемане активността на преднизолон и циклоспорин може да бъде намалена.

Храната забавя резорбцията на продукта, затова той трябва да се приема на гладно.

4.6. БРЕМЕННОСТ И КЪРМЕНЕ

Не се препоръчва приемането му по време на бременност и кърмене.

4.7. ЕФЕКТИ ВЪРХУ СПОСОБНОСТТА ЗА ШОФИРАНЕ И РАБОТА С МАШИНИ

Ulcorgol има незначително влияние върху способността за шофиране и работа с машини.

4.8. НЕЖЕЛАНИ ЛЕКАРСТВЕНИ РЕАКЦИИ

Обикновено Ulcorgol се понася добре.

Могат да се наблюдават следните нежелани реакции:

Над 1%:

- Общи - абдоминална болка, астения;
- Гастроинтестинални - констипация; диария, флатуленция, гадене, повръщане, регургитация;
- ЦНС - главоболие.

Под 1%:

- Общи - треска, болка, умора, подуване на корема;
- Кардиоваскуларни - гръдна болка или ангина, брадикардия, палпитации, периферни отоци;



- Гастроинтестинални – панкреатит, анорексия, солон иритабиле,
- Чернодробни - повишаване на ALAT, ASAT; γ GTP, алкална фосфатаза, билирубин; хепатит, чернодробна некроза, чернодробна недостатъчност и чернодробна енцефалопатия;
- Метаболитни – наддаване на тегло, хипогликемия, хипонатриемия;
- Мускуло-скелетна система - мускулни крампи, миалгия, слабост, ставни болки;
- Психични нарушения - депресия, халюцинации, обърканост, нарушения на съня, апатия, тремор, вертиго, парестезии, агресивност, тревожност;
 - Дихателни – епистаксис, фалрингеална болка;
 - Кожни – обрив; много рядко – генерализирани кожни реакции, вкл токсична епидермална некролиза, синдром на Stevens – Johnson, еритема мултиформе, пурпура, алопеция, пруритус;
 - Уро-генитални - интерстициален нефрит, покачване на серумния креатинин, протеинурия, хематурия, глюкозурия, гинекомастия.
 - Алергични кожни обриви и повишена температура (втрисания); рядко анафилактичен шок;
 - Обратими хематологични реакции - панцитопения, агранулоцитоза, тромбоцитопения, неутропения, анемия, левкоцитоза, хемолитична анемия.

4.9. ПРЕДОЗИРАНЕ

При предозирание с Ulcorgol могат да се наблюдават следните симптоми: замъглено виждане, обърканост, диафореза, сънливост, сухота в устата, главоболие, обща отпадналост, гадене, тахикардия.

При прояви на предозирание е необходимо незабавното спиране приема на продукта. Поради липсата на специфичен антидот лечението е симптоматично и поддържащо.

Хемодиализата не е ефективна.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ ДАННИ

5.1. ФАРМАКОДИНАМИЧНИ СВОЙСТВА

АТС код A02B C 01

Omeprazole инхибира ензима H⁺/K⁺-АТФ-аза, локализиран в апикалната мембрана на секреторните каналчета на париеталните клетки. По този начин блокира завършващата фаза на базалната и стимулираната от храна, хистамин, пентагастрин и ацетилхолин секреция на солна киселина. Omeprazole е фармакологично неактивен (предлекарство). Освободената в киселата среда на жлезния канал на париеталната клетка активна молекула на сулфенамид взаимодейства пряко с протонната помпа, която се намира в апикално разположената клетъчна мембрана. Чрез образуване



дисулфидни мостове между сулфенамида и ензима се инактивира функцията на протонната помпа.

5.2. ФАРМАКОКИНЕТИЧНИ СВОЙСТВА

След разтваряне на стомашно-устойчивите капсули в тънкото черво, резорбцията се осъществява за 3 до 6 часа. Тъй като Omeprazole има продължително действие /24 часа/, забавеното достигане на равновесието при първото приемане не играе никаква роля. Резорбцията на Omeprazole не се повлиява при едновременно приемане с храна или антиацидни средства. Разпределя се във всички тъкани и специално в париеталните клетки на стомаха. Максималната концентрация T_{max} се достига за $1/2$ до $3 1/2$ часа. Времето за настъпване на пиковия ефект е два /2/ часа. Продуктът има високо протеинно свързване, приблизително 95% с албумина и алфа₁ - киселинния гликопротеин. Биологичният полуживот при нормална чернодробна функция е от 30 min до 1 час, а при хронично чернодробно заболяване - 1 час. Продължителността на действието е 72 часа. 96 часа са необходими за пълното възобновяване на киселинната продукция. Елиминирането става през бъбреците в 72-80%, с изпражненията от 18-23%. Не се диализира напълно поради високото свързване с албумина. Omeprazole се метаболизира изцяло в организма, главно в черния дроб, с помощта на P450-оксидазната система. Времето на полуживот възлиза на 40 минути. Образуваните метаболити не притежават ограничаващи киселинната секреция свойства. Открити са три главни метаболита - хидроксиомепразол, омепразолсулфид и омепразолсулфон. Времето на полуживот на метаболитите е различно.

5.3. ПРЕДКЛИНИЧНИ ДАННИ ЗА БЕЗОПАСНОСТ

5.3.1. Остра токсичност

Острата токсичност на Omeprazole е изпитана при мъжки и женски животни в доза 2 ml/20 g телесно тегло за мишки и 2 ml/200 g за плъхове, под формата на маслена суспензия. След храненето със сонда се наблюдава лека летаргия, която преминава бързо. Както при мишките, така и при плъховете не се наблюдават други явления до 15 ден в дози до 5000 mg/kg телесно тегло.

5.3.2. Подостра и хронична токсичност

При изпитване на субакутна и хронична токсичност при кучета в дози 3, 16, 80 и 400 $\mu\text{mol/kg/ден}$ орално за 3 месеца и в доза от 2 до 80 $\mu\text{mol/ден}$ за 12 месеца Omeprazole не предизвиква смъртност. Някои от животните повръщат, имат тремор на главата и слабо намаление на T_3 в плазмата. От високите дози хистопатологично се наблюдава реверзибилна атрофия на стомашните епителни мукозни клетки и слаба, но значима хиперплазия на аргирофилните ендокринни клетки /ECL/. Опитите за субакутна и хронична токсичност у плъхове в доза 400-1200 μmol дневно орално и интравенозно за 3, 6 и 24 месеца показват, че не се предизвиква смъртност.



третиран с най-високата доза се наблюдава намаление на концентрацията на глюкозата в кръвта, слабо намаление на теллото, слабо намаление на броя на червените кръвни клетки и хемоглобиновата концентрация и увеличение на теллото на бъбреците и черния дроб. В стомаха, само при най-високите дози, се намира хипертрофия на стомашната мукоза с увеличение на гънките, увеличение на жлезите и мукозната секреция. При токсичните дози поведенчески се наблюдава седация, птоза, конвулсии, намалена двигателна активност, повишена телесна температура, повишена дихателна честота, задълбочаване на дишането.

5.3.3. Тератогенност и мутагенност

Omeprazole, прилаган перорално в дози от 40-400 μmol у плъхове и зайци, не предизвиква тератогенност. Няма данни за специфична токсичност върху процесите на репродукция. Проучване, проведено при плъхове и мишки за канцерогенност, показва стимулиране на развитието на стомашни аргирофилни/карциноидни тумори, ентерохромафинно-подобна клетъчна хиперплазия/ендокринни клетки у плъхове. Хиперплазията на тези клетки се счита, че е свързана с намалената стомашна киселинна секреция и увеличен гастрин, като у плъховете тези клетки нормално са с по-голяма гъстота в сравнение с други животински видове.

У кучета след едногодишно третиране с висока доза Omeprazole се наблюдава слабо увеличение на ECL клетки. По теста на Ames, микронуклеарния тест у мишки и миши лимфомен тест, Omeprazole не проявява потенциална възможност за мутагенност.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1. СПИСЪК НА ПОМОЩНИТЕ ВЕЩЕСТВА

Състав на пелети:

Light magnesium carbonate

Hydroxypropyl cellulose

Disodium hydrogen phosphate

Maize Starch

Talc

Sugar Pharma grade (Pulverised)

Non pareil seeds

Methacrylic acid copolymer

Titanium dioxide

Polysorbate 80

Polyethylene glycol 6000

Silica Coloidal anhydrous

Hydroxypropylmethyl Cellulose

Състав на твърдата желатинова капсула

Gelatin

Titanium dioxide



Red Iron Oxide
Yellow Iron Oxide

6.2. ФИЗИКО-ХИМИЧНИ НЕСЪВМЕСТИМОСТИ

Не са известни.

6.3. СРОК НА ГОДНОСТ

3 (три) години от датата на производство.

6.4. СПЕЦИАЛНИ УСЛОВИЯ ЗА СЪХРАНЕНИЕ

При температура под 25°C.

Да се съхранява на място, недостъпно за деца!

6.5. ДАННИ ЗА ОПАКОВКАТА

Капсули по 10 броя в блистер от PVC/PVDC/AL фолио; по 3 блистера в картонена кутия

Капсули по 7 броя в блистер от Alu/Alu фолио, по 2 и по 4 блистера в картонена кутия

6.6. ПРЕПОРЪКИ ПРИ УПОТРЕБА

Продуктът се приема на гладно без да се нарушава целостта му.

Да не се употребява след изтичане срока на годност, указан на опаковката.

7. ИМЕ И АДРЕС НА ПРИТЕЖАТЕЛЯ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

“Актавис” АД

бул. “Княгиня Мария Луиза” № 2

София, България

8. РЕГИСТРАЦИОНЕН НОМЕР В РЕГИСТЪРА

№9900202/13.07.1999

9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ ЗА УПОТРЕБА НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

12.07.1999

10. ДАТА НА ЧАСТИЧНА АКТУАЛИЗАЦИЯ НА ТЕКСТА

ЮНИ 2004 г.

