

ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА
ОМЕЗ®

Регистрационный номер: ЛСР-004124/09

Торговое название препарата: ОМЕЗ®

Международное непатентованное название препарата: омепразол.

Лекарственная форма: лиофилизат для приготовления раствора для инфузий.

Состав

Каждый флакон содержит:

Действующее вещество: омепразол 40 мг.

Вспомогательные вещества: натрия гидроксид 5,28 мг, динатрия эдетат 1,00 мг.

Описание

Белый или почти белый лиофилизат в виде пористой массы или ее частей, или в виде порошка.

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

Код АТХ: А02ВС01

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Специфический ингибитор протонного насоса: тормозит активность Н⁺/К⁺-АТФ-азы в париетальных клетках желудка, блокируя заключительную стадию секреции соляной кислоты, тем самым снижает кислотопродукцию.

Снижает базальную и стимулированную секрецию независимо от природы раздражителя.

Омепразол является пролекарством и активируется в кислой среде секреторных канальцев париетальных клеток желудка.

Воздействие является дозозависимым и обеспечивает эффективное ингибирование и базальной, и стимулированной секреции кислоты, независимо от природы стимулирующего фактора.

Антисекреторный эффект после приема 20 мг наступает в течение первого часа, максимум – через 2 ч. Ингибирование 50% максимальной секреции продолжается 24 ч.

Однократный прием в сутки обеспечивает быстрое и эффективное угнетение дневной и ночной желудочной секреции, достигающее своего максимума через 4 дня лечения и исчезающее к исходу 3–4 дня после окончания приема. У больных с язвенной болезнью 12-перстной кишки прием 20 мг омепразола поддерживает внутрижелудочный рН на уровне 3 в течение 17 ч.

Во время применения препаратов, уменьшающих секрецию желез желудка, концентрация гастрина в плазме крови увеличивается.

Вследствие снижения секреции соляной кислоты повышается концентрация хромогранина А (см. раздел «Особые указания»).

Фармакокинетика

Связь с белками плазмы – 90-95% (альбумин и кислый альфа1-гликопротеин).

Период полувыведения ($T_{1/2}$) для заключительной фазы фармакокинетической кривой «концентрация-время» в плазме крови после внутривенного введения омепразола составляет около 40 минут (при печеночной недостаточности – 3 ч); общий клиренс плазмы равен от 0,3 до 0,6 л/мин. Изменения величины периода полувыведения в ходе лечения не происходит.

Практически полностью метаболизируется в печени с участием ферментной системы цитохрома P₄₅₀ (CYP) с образованием шести фармакологически неактивных метаболитов: гидроксидомепразола, сульфидных и сульфоновых производных и других.

Значительная часть метаболизма омепразола зависит от полиморфно экспрессируемой специфической изоформы CYP2C19 (S-мефенитоин гидроксилаза), отвечающей за образование гидроксидомепразола – главного плазменного метаболита. Является ингибитором изофермента CYP2C19.

Выведение почками (70–80%) и с желчью (20–30%). При хронической почечной недостаточности выведение снижается пропорционально снижению клиренса креатинина. У пожилых пациентов выведение уменьшается, биодоступность возрастает.

Показания к применению

В качестве альтернативы пероральной терапии при невозможности её проведения:

- при язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки (в том числе профилактика рецидивов);
- при гастроэзофагеальной рефлюксной болезни (ГЭРБ);
- при гиперсекреторных состояниях (синдром Золлингера-Эллисона, стрессовые язвы желудочно-кишечного тракта, полиэндокринный аденоматоз, системный мастоцитоз);
- для профилактики и лечения повреждений слизистой оболочки желудка и двенадцатиперстной кишки, обусловленных приемом нестероидных противовоспалительных препаратов (НПВП-гастропатия): диспепсия, эрозии слизистой оболочки, пептическая язва;
- для профилактики аспирации кислого содержимого желудка в дыхательные пути во время общей анестезии (синдром Мендельсона).

Противопоказания

Повышенная чувствительность к омепразолу или другим компонентам препарата.

Одновременный прием с эрлотинибом, позаконазолом, нелфинавиром и атазанавиром.

Период грудного вскармливания.

Детский возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены для данной лекарственной формы).

С осторожностью

Почечная недостаточность (коррекция дозы омепразола не требуется).

Печеночная недостаточность (см. раздел «Способ применения и режим дозирования»).

Остеопороз. Хотя причинно-следственная связь применения омепразола с переломами на фоне остеопороза не установлена, пациенты с риском развития остеопороза или переломов на его фоне должны находиться под соответствующим клиническим наблюдением.

Беременность.

Одновременное применение с клопидогрелом, итраконазолом, варфарином, цилостазолом, диазепамом, фенитоином, саквинавиром, такролимусом, кларитромицином, вориконазолом, рифампицином, препаратами зверобоя продырявленного.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Применение препарата во время беременности возможно только в том случае, если предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

При лактации следует прекратить грудное вскармливание.

Способ применения и дозы

Препарат Омез® вводится внутривенно в течение 20-30 минут. Рекомендуется вводить раствор для инфузии сразу же после его приготовления. Дозы подбираются индивидуально, иногда требуется введение более высокой дозы. Если величина суточной дозы превышает 60 мг, то доза должна быть разделена на два приема.

- *В качестве альтернативы пероральной терапии при невозможности её проведения:*
 - при язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки (в том числе профилактика рецидивов) рекомендуется назначать инфузию препарата Омез® в дозе 40 мг один раз в сутки;
 - при гастроэзофагеальной рефлюксной болезни (ГЭРБ) рекомендуется назначать инфузию препарата Омез® в дозе 40 мг один раз в сутки;
 - при гиперсекреторных состояниях (синдром Золлингера-Эллисона, стрессовые язвы желудочно-кишечного тракта, полиэндокринный аденоматоз, системный мастоцитоз) рекомендуется начальное внутривенное введение препарата Омез® в дозе 60 мг в сутки;
 - для профилактики и лечения повреждений слизистой оболочки желудка и двенадцатиперстной кишки, обусловленных приемом нестероидных противовоспалительных препаратов - НПВП-гастропатия (диспепсия, эрозии слизистой оболочки, пептическая язва) рекомендуется назначать инфузию препарата Омез® в дозе 40 мг один раз в сутки.
- *Для профилактики аспирации кислого содержимого желудка в дыхательные пути во время общей анестезии (синдром Мендельсона) препарат назначают накануне на ночь в дозе 40 мг и не менее чем за 2 часа до анестезии / операции в дозе 40 мг.*

После окончания парентеральной терапии для подавления секреции кислоты рекомендуется проведение антисекреторной терапии пероральными лекарственными формами (например, омепразол 40 мг один раз в сутки в течение 4 недель).

Применение препарата в особых случаях

Нарушение функции почек. Коррекция дозы не требуется.

Нарушение функции печени. У пациентов с нарушением функции печени биодоступность и клиренс омепразола увеличиваются. В связи с этим терапевтическая доза не должна превышать 20 мг в сутки.

Пожилой возраст. Скорость метаболизма омепразола у лиц пожилого возраста снижается, но коррекция дозы не требуется.

Инструкция по приготовлению раствора для инфузий

Раствор для инфузий готовится путем растворения лиофилизированного порошка омепразола в 100 мл 5% раствора декстрозы (глюкозы) для инфузий или в 100 мл

инфузионного физиологического раствора.

Раствор для инфузий на 5% декстрозе (глюкозе) должен быть использован в течение 6 часов. Инфузионный раствор на физиологическом растворе должен быть использован в течение 12 часов. До введения следует убедиться в отсутствии в растворе взвешенных частиц.

Приготовление раствора для инфузий во флаконах

1. Набрать шприцем 5 мл раствора для инфузий из флакона.
2. Ввести раствор для инфузий во флакон с лиофилизированным порошком омепразола, встряхнуть флакон до полного растворения препарата.
3. Набрать в шприц раствор омепразола.
4. Перенести раствор омепразола во флакон.
5. Повторить операции 1-4 для того, чтобы перенести весь препарат из флакона.

Приготовление раствора для инфузий в мягком контейнере

1. Для приготовления раствора для инфузий использовать двустороннюю иглу (-переходник). Одним концом иглы проколоть мембрану инфузионного мешка, другой конец иглы соединить с флаконом лиофилизированного омепразола.
2. Растворить порошок омепразола, прокачивая инфузионный раствор из мешка во флакон и обратно.
3. Убедиться, что порошок полностью растворился, после чего отсоединить пустой флакон и удалить иглу из инфузионного мешка.

Побочное действие

Частота развития нежелательных лекарственных реакций изложена в соответствии со следующей градацией: очень часто ($>1/10$); часто ($\geq 1/100$, $<1/10$); нечасто ($\geq 1/1000$, $<1/100$); редко ($\geq 1/10000$, $<1/1000$); очень редко ($<1/10000$); частота неизвестна (не может быть определена на основании имеющихся данных).

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: нечасто – дерматит, кожный зуд, кожная сыпь, крапивница; редко – алопеция, реакции фоточувствительности, мультиформная эритема, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз.

Нарушения со стороны скелетно-мышечной и соединительной ткани: нечасто – переломы бедра, костей запястья, позвонков; редко – артралгия, миалгия, мышечная слабость.

Нарушения со стороны нервной системы: часто – головная боль; нечасто – головокружение, парестезии, сонливость; редко – нарушение вкуса.

Нарушения психики: нечасто – бессонница; редко – повышенная возбудимость, агрессивность, нарушение сознания, депрессия, галлюцинации.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: часто – абдоминальная боль, запор, диарея, метеоризм, тошнота, рвота; редко – сухость во рту, стоматит, гастроинтестинальный кандидоз, микроскопический колит.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей: нечасто – повышение активности «печеночных» ферментов; редко – гепатит с/без желтухи, печеночная недостаточность, энцефалопатия у пациентов с предшествующими тяжелыми заболеваниями печени.

Нарушения со стороны половых органов и молочной железы: редко – гинекомастия.

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

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

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

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей: редко – интерстициальный нефрит; частота неизвестна – риск развития острого тубулоинтерстициального нефрита (с возможным прогрессированием до почечной недостаточности), эректильная дисфункция.

Нарушения со стороны органа слуха и лабиринтные нарушения: нечасто – вертиго.

Нарушения со стороны органа зрения: редко – нечеткость зрения.

Нарушения со стороны обмена веществ и питания: редко – гипонатриемия; очень редко – гипомагниемия, гипокальциемия вследствие тяжелой гипомагниемии, гипокалиемия вследствие гипомагниемии.

Общие расстройства: нечасто – недомогание; редко – повышенное потоотделение, периферические отеки.

Передозировка

По данным клинических исследований при внутривенном введении до 270 мг препарата за сутки и в дозе до 650 мг за три дня дозозависимых побочных эффектов не было выявлено.

Симптомы: спутанность сознания, нечеткость зрения, сонливость, сухость во рту, головная боль, тошнота, тахикардия, аритмия.

Лечение: симптоматическое. Гемодиализ недостаточно эффективен.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

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 кетоконазола, итраконазола, позаконазола, эрлотиниба, препаратов железа и цианокобаламина. Следует избегать их совместного приема с омепразолом.

Биодоступность дигоксина при одновременном применении с омепразолом повышается на 10% (может потребоваться коррекция режима дозирования дигоксина). Следует соблюдать осторожность при одновременном применении этих препаратов у пожилых пациентов.

При одновременном применении с омепразолом возможно повышение плазменной концентрации и увеличение периода полувыведения варфарина, диазепама, фенитоина, цилостазола, имипрамина, кломипрамина, циталопрама, гексобарбитала, дисульфирама, а также других препаратов, метаболизирующихся в печени с участием изофермента CYP2C19 (может потребоваться снижение доз этих препаратов).

Было показано, что омепразол взаимодействует с некоторыми антиретровирусными препаратами. Механизмы и клиническое значение этих взаимодействий не всегда известны. Увеличение значения рН 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. При одновременном применении с омепразолом на 75% уменьшается площадь под фармакокинетической кривой «концентрация-время» атазанавира. В связи с этим совместное применение омепразола с антиретровирусными препаратами, такими как атазанавир и нелфинавир, противопоказано.

При одновременном применении омепразола с клопидогрелем наблюдается уменьшение антиагрегантного эффекта последнего.

При совместном применении метотрексата с ингибиторами протонной помпы у некоторых пациентов наблюдалось незначительное повышение концентрации метотрексата в плазме крови. При лечении высокими дозами метотрексата следует временно прекратить прием омепразола.

При одновременном применении омепразола и такролимуса было отмечено повышение концентрации такролимуса в сыворотке крови, что может потребовать коррекции его дозы. Одновременное применение с ингибиторами изоферментов CYP2C19 и CYP3A4 (такими как кларитромицин, эритромицин, вориконазол) может привести к увеличению плазменной концентрации омепразола, что может потребовать коррекции дозы омепразола у пациентов с тяжелой печеночной недостаточностью в случае его длительного применения.

Индукторы изоферментов CYP2C19 и CYP3A4, такие как рифампицин, препараты зверобоя продырявленного (*Hypericum perforatum*), при совместном применении с омепразолом могут приводить к снижению концентрации омепразола в плазме крови за счет ускорения метаболизма омепразола.

При совместном приеме омепразола с кларитромицином или эритромицином концентрация омепразола в плазме крови повышается.

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

Не выявлено влияния омепразола на антацидные средства, теофиллин, кофеин, хинидин, лидокаин, пропранолол, этанол.

Особые указания

При подозрении на язву желудка на ранних стадиях необходимо пройти рентгеновское или эндоскопическое обследование для установки правильного диагноза и назначения адекватного лечения.

При наличии любых тревожных симптомов, таких как значительная спонтанная потеря массы тела, частая рвота, дисфагия, рвота с кровью или мелена, а также при наличии язвы желудка (или при подозрении на язву желудка) следует исключить возможность злокачественного новообразования, поскольку лечение препаратом Омез® может привести к сглаживанию симптоматики и отсрочить постановку диагноза.

Пациенты с риском развития остеопороза или переломов на его фоне должны находиться под соответствующим клиническим наблюдением, хотя причинно-следственная связь применения омепразола/эзомепразола с переломами на фоне остеопороза не установлена.

Вследствие снижения секреции соляной кислоты повышается концентрация хромогранина А (CgA). Повышение концентрации CgA в плазме крови может оказывать влияние на результаты обследований для выявления нейроэндокринных опухолей. Для предотвращения данного влияния терапию ингибиторами протонной помпы необходимо приостановить за 5 дней до проведения исследования концентрации CgA. Если за это время концентрация CgA не вернулась к нормальному значению, исследование следует повторить.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и выполнять другие виды деятельности, требующие концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций

В период лечения омепразолом может возникать головокружение, сонливость, нарушение зрения, поэтому следует соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и выполнении других потенциально опасных видов деятельности, требующих повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Лиофилизат для приготовления раствора для инфузий, 40 мг. Препарат во флаконе из бесцветного прозрачного стекла типа I (Eur Ph), закупоренный хлорбутиловой пробкой, обжатым алюминиевым колпачком с предохранительной пластиковой крышкой. Каждый флакон вместе с инструкцией по применению помещен в пачку картонную.

Условия хранения

В защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.
Хранить в недоступном для детей месте!

Срок годности

2 года.

Не использовать после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Держатель регистрационного удостоверения

Д-р Редди'с Лабораторис Лтд., Индия

Dr. Reddy's Laboratories Ltd., India

Производитель

Софаримекс - Индустрия Кимика э Фармасуэтика, С.А., Португалия

Sofarimex - Industria Quimica e Farmaceutica, S.A., Portugal

Ав. дас Индустриас - Альто де Колариде, Касем, 2735-213, Португалия.

Организация, принимающая претензии от потребителей:

Представительство фирмы «Д-р Редди'с Лабораторис Лтд.»:

115035, г. Москва, Овчинниковская наб., д. 20, стр.1

тел: +7 (495) 795-39-39

факс: +7 (495) 795-39-08