

ОМЕПРАЗОЛ (OMEPRAZOL)

OMEPRAZOLE

*зарегистрировано и произведено СИНТЕЗ ОАО (Россия)***ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА, СОСТАВ И УПАКОВКА**

Капсулы желатиновые, с белым корпусом и желтой крышечкой; содержимое капсул – микрогранулы шарообразной формы, покрытые оболочкой, белого или белого с кремовым оттенком цвета.

1 капс.

омепразол.....20 мг

10 шт. – упаковки ячейковые контурные (3) – пачки картонные.

Номер и дата регистрации: P N001520/01 от 14.08.08**Код АТХ:** A02BC01**Клинико-фармакологическая группа:**Ингибитор Н⁺-К⁺-АТФ-азы. Противоязвенный препарат**ФАРМАКОЛОГИЧЕСКОЕ ДЕЙСТВИЕ**

Омепразол – противоязвенный препарат, ингибитор фермента Н⁺/К⁺-аденозинтрифосфат (АТФ)-фазы. Тормозит активность Н⁺/К⁺ – аденозинтрифосфат (АТФ)-фазы (Н⁺/К⁺-аденозинтрифосфат (АТФ)-фазы, она же – "протонный насос" или "протоновый насос") в париетальных клетках желудка, тем самым блокирует перенос ионов водорода и заключительную стадию синтеза соляной кислоты в желудке. Омепразол является пролекарством. В кислой среде канальцев париетальных клеток омепразол превращается в активный метаболит сульфенамид, который ингибирует мембранную Н⁺/К⁺- аденозинтрифосфат (АТФ)-фазу, соединяясь с ней за счет дисульфидного мостика. Этим объясняется высокая избирательность действия омепразола именно на париетальные клетки, где имеется среда для образования сульфенамида. Биотрансформация омепразола в сульфенамид происходит быстро (через 2-4 мин). Сульфенамид является катионом и не подвергается абсорбции.

Омепразол подавляет базальную и стимулированную любым раздражителем секрецию соляной кислоты на заключительной стадии. Снижает общий объем желудочной секреции и угнетает выделение пепсина. У омепразола обнаружена гастропротекторная активность, механизм которой не ясен. Не влияет на продукцию внутреннего фактора Касла и на скорость перехода пищевой массы из желудка в двенадцатиперстную кишку. Омепразол не действует на ацетилхолиновые и гистаминовые рецепторы.

Капсулы Омепразола содержат микрогранулы, покрытые оболочкой, постепенное высвобождение и начало действия омепразола начинается через 1 час после приема, достигает максимума через 2 часа, сохраняется в течение 24 часов и более. Ингибирование 50% максимальной секреции после однократного приема 20 мг препарата продолжается 24 часа.

Однократный прием в сутки обеспечивает быстрое и эффективное угнетение дневной и ночной желудочной секреции, достигающее своего максимума через 4 дня лечения. У больных с язвенной болезнью двенадцатиперстной кишки прием 20 мг омепразола поддерживает рН=3 внутри желудка в течение 17 часов. После прекращения приема препарата секреторная активность полностью восстанавливается через 3-5 сут.

ФАРМАКОКИНЕТИКА

Абсорбция – высокая. Биодоступность 30-40% (при печеночной недостаточности возрастает практически до 100%), увеличивается у людей пожилого возраста и у больных с нарушениями функций печени, недостаточность почечной функции влияния не оказывает. Т_{Сmax} – 0.5-3.5 часа.

Обладая высокой липофильностью, легко проникает в париетальные клетки желудка. Связь с белками плазмы – 90-95% (альбумин и кислый альфа₁-гликопротеин).

T_{1/2} – 0.5-1 ч (при печеночной недостаточности – 3 ч), клиренс – 500-600 мл/мин. Практически полностью метаболизируется в печени с участием ферментной системы CYP2C19, с образованием 6 фармакологически неактивных метаболитов (гидроксиомепразол, сульфидные и сульфоновые производные и др.). Является ингибитором изофермента CYP2C19. Выведение почками (70-80%) и с желчью (20-30%) в виде метаболитов.

При хронической почечной недостаточности выведение снижается пропорционально снижению клиренса креатина. У пожилых пациентов выведение уменьшается.

ПОКАЗАНИЯ

- язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки (в фазе обострения и противорецидивное лечение), в т.ч. ассоциированные с *Helicobacter pylori* (в составе комбинированной терапии);
- рефлюкс-эзофагит (в т.ч. эрозивный);
- гиперсекреторные состояния (синдром Золлингера – Эллисона, стрессовые язвы желудочно-кишечного тракта, полиэндокринный аденоматоз, системный мастоцитоз);
- гастропатия, вызванная приемом нестероидных противовоспалительных препаратов.

РЕЖИМ ДОЗИРОВАНИЯ

Внутрь, капсулы обычно принимают утром, не разжевывая, запивая небольшим количеством воды (непосредственно перед едой).

При обострении язвенной болезни, рефлюкс-эзофагите и гастропатии, вызванной приемом НПВС – 20 мг 1 раз в сутки. Пациентам с тяжелым течением рефлюкс-эзофагита дозу увеличивают до 40 мг 1 раз в сутки. Курс лечения при язвенной болезни двенадцатиперстной кишки – 2-4 недели, при необходимости – 4-5 недель; при язвенной болезни желудка, при рефлюкс-эзофагите, при эрозивно-язвенных поражениях ЖКТ, вызванных приемом НПВС – в течение 4-8 недель.

Уменьшение симптомов заболевания и рубцевание язвы в большинстве случаев происходит в пределах 2 недель. Пациентам, у которых не произошло полного рубцевания язвы после двухнедельного курса, лечение следует продолжить еще 2 недели.

Больным, резистентным к лечению другими противоязвенными лекарственными средствами, назначают по 40 мг в сутки. Курс лечения при язвенной болезни двенадцатиперстной кишки – 4 недели, при язвенной болезни желудка и рефлюкс-эзофагите – 8 недель.

При синдроме Золлингера – Элиссона – обычно по 60 мг 1 раз в сутки; при необходимости дозу увеличивают до 80-120 мг/сутки (дозу делят на 2 приема).

Для профилактики рецидивов язвенной болезни – 10 мг 1 раз в сутки.

Для эрадикации *Helicobacter pylori* используют «тройную» терапию (в течение 1 недели: омепразол 20 мг, амоксициллин 1 г, кларитромицин 500 мг – по 2 раза в сутки; либо омепразол 20 мг, кларитромицин 250 мг, метронидазол 400 мг – по 2 раза в сутки; либо омепразол 40 мг 1 раз в сутки, амоксициллин 500 мг и метронидазол 400 мг – по 3 раза в сутки)

или «двойную» терапию (в течение 2 недель: омепразол 20-40 мг и амоксициллин 750 мг – по 2 раза в сутки либо омепразол 40 мг – 1 раз в сутки и кларитромицин 500 мг – 3 раза в сутки или амоксициллин 0.75-1.5 г-2 раза в сутки).

При печеночной недостаточности назначают по 10-20 мг 1 раз в сутки (при тяжелой печеночной недостаточности суточная доза не должна превышать 20 мг); при нарушении функции почек и у пожилых пациентов коррекции режима дозирования не требуется.

ПОБОЧНОЕ ДЕЙСТВИЕ

Со стороны органов пищеварения: диарея или запоры, боль в животе, тошнота, рвота, метеоризм; в редких случаях – повышение активности печеночных ферментов, нарушения вкуса, в отдельных случаях – сухость во рту, стоматит, у больных с предшествующим тяжелым заболеванием печени – гепатит (в т.ч. с желтухой), нарушение функции печени.

Со стороны нервной системы: у больных с тяжелыми сопутствующими соматическими заболеваниями – головная боль, головокружение, возбуждение, депрессия, у больных с предшествующим тяжелым заболеванием печени – энцефалопатия.

Со стороны опорно-двигательного аппарата: в отдельных случаях – артралгия, миастения, миалгия.

Со стороны системы кроветворения: в отдельных случаях – лейкопения, тромбоцитопения, агранулоцитоз, панцитопения.

Со стороны кожных покровов: редко – кожная сыпь и/или зуд, в отдельных случаях фотосенсибилизация, мультиформная экссудативная эритема, алопеция.

Аллергические реакции: крапивница, ангионевротический отек, лихорадка, бронхоспазм, интерстициальный нефрит и анафилактический шок.

Прочие: редко – нарушения зрения, недомогание, периферические отеки, усиление потоотделения, гинекомастия, образование желудочных glandулярных кист во время длительного лечения (следствие ингибирования секреции соляной кислоты, носит доброкачественный, обратимый характер).

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

- детский возраст;
- беременность;
- период лактации;
- гиперчувствительность.

С осторожностью: почечная и/или печеночная недостаточность.

БЕРЕМЕННОСТЬ И ЛАКТАЦИЯ

Противопоказан во время беременности и в период лактации.

ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ

Перед началом терапии необходимо исключить наличие злокачественного процесса (особенно при язве желудка), так как лечение, маскируя симптоматику, может отсрочить постановку правильного диагноза.

Прием одновременно с пищей не влияет на его эффективность.

ПЕРЕДОЗИРОВКА

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

Лечение: симптоматическое. Гемодиализ недостаточно эффективен. Специфического антидота не существует.

ЛЕКАРСТВЕННОЕ ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ

Может снижать абсорбцию эфиров ампициллина, солей железа, итраконазола и кетоконазола (омепразол повышает pH желудка).

Являясь ингибиторов цитохрома Р450, может повышать концентрацию и снижать выведение диазепама, антикоагулянтов непрямого действия, фенитоина (лекарственные средства, которые метаболизируются в печени посредством цитохрома СYP2C19), что в некоторых случаях может потребовать уменьшения доз этих лекарственных средств. Может повышать концентрацию кларитромицина в плазме крови.

В тоже время длительное применение омепразола в дозе 20 мг 1 раз в сутки в комбинации с кофеином, теофиллином, пироксикамом, диклофенаком, напроксеном, метопрололом, пропранололом, этанолом, циклоспорином, лидокаином, хинидином и эстрадиолом не приводило к изменению их концентрации в плазме.

Усиливает ингибирующее действие на систему кроветворения и других лекарственных средств.

Не отмечено взаимодействия с одновременно принимаемыми антацидами.

УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ И СРОКИ ГОДНОСТИ

Список Б. В сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25°C. Хранить в местах, недоступных для детей. Срок годности – 3 года.

УСЛОВИЯ ОТПУСКА ИЗ АПТЕК

По рецепту.