

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА	
Кратка характеристика на продукта Приложение 1	
Към Рег. №	2024 0092
Разрешение №	66939
BG/MA/MP -	30-10-2024
Одобрение №	

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Хелицид Репид 20 mg твърди капсули
омепразол
Helicid Rapid 20 mg capsules, hard
omeprazole

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всяка твърда капсула съдържа 20 mg омепазол (omeprazole).

Помощни вещества с известно действие

Всяка твърда капсула съдържа 225 mg натрий.

За пълния списък на помощните вещества вижте точка 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Капсула, твърда (капсула).

Бял до почти бял прах в капсула (прибл. 21 mm дължина) с непрозрачно бяло тяло и червена капачка без обозначение.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

Хелицид Репид е показан за лечение на симптоми на рефлукс (напр. киселини, киселинна регургитация) при възрастни.

4.2 Дозировка и начин на приложение

Дозировка

Възрастни

Препоръчителната доза е 20 mg (една капсула) веднъж дневно за 14 дни.

Може да е необходимо капсулите да се приемат 2-3 последователни дни, за да се постигне подобрене на симптомите.

Повечето пациенти постигат пълно облекчаване на киселините в рамките на 7 дни. След като настъпи пълно облекчаване на симптомите, лечението трябва да се прекрати.

Специални популации

При пациенти с бъбречна недостатъчност

Не е необходима корекция на дозата при пациенти с нарушена бъбречна функция (вж. точка 5.2).

При пациенти с чернодробна недостатъчност

Пациентите с увредена чернодробна функция трябва да се консултират с лекар, преди да приемат омепазол (вж. точка 5.2).



При пациенти в старческа възраст

Не е необходима корекция на дозата при пациенти в напреднала възраст (вж. точка 5.2).

Педиатрична популация

Хелицид Репид не се препоръчва за употреба при деца и юноши под 18-годишна възраст, поради недостатъчни данни за безопасност и ефикасност.

Начин на приложение

Хелицид Репид трябва да се приема на празен стомах, поне 30 минути преди хранене (вж. точка 5.2). Капсулата трябва да се погълне цяла с половин чаша вода и не трябва да се дъвче или отваря, за да се постигне пълният ефект на лекарствения продукт..

4.3 Противопоказания

Свръхчувствителност към активното вещество омепразол, заместени бензимидазоли, или към някое от помощните вещества, изброени в точка 6.1.

Омепразолът, подобно на други инхибитори на протонната помпа, не трябва да се използва едновременно с нелфинавир (вж. точка 4.5).

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

При наличие на някой алармиращ симптом (напр. значителна нежелана загуба на телесно тегло, рецидивиращо повръщане, дисфагия, хематемеза или мелена) и при подозирана или налична стомашна язва, трябва да се изключи злокачествено заболяване, тъй като лечението може да облекчи симптомите и да забави диагнозата.

Не се препоръчва едновременно прилагане на атазанавир с инхибитори на протонната помпа (вж. точка 4.5). Ако бъде счетено, че комбинацията от атазанавир с инхибитор на протонната помпа е неизбежна, се препоръчва строг лекарски надзор (напр. вирусно натоварване) в комбинация с повишаване на дозата на атазанавир до 400 mg със 100 mg ритонавир; дозата на омепразол от 20 mg не трябва да се превишава.

Омепразолът е инхибитор на CYP2C19. При започване или приключване на лечение с омепразол трябва да се има предвид възможността за взаимодействия с лекарствени продукти, метаболизиращи чрез CYP2C19. Наблюдава се взаимодействие между клопидогрел и омепразол (вж. точка 4.5). Клиничната значимост на това взаимодействие е неизвестна. Като предпазна мярка, едновременната употреба на омепразол и клопидогрел не трябва да се насърчава.

Съобщават се, рядко или много рядко, съответно във връзка с лечението с омепразол, случаи на тежки кожни нежелани реакции (ТКНР), включително синдром на Стивънс-Джонсън (SJS), токсична епидермална некролиза (ТЕН), лекарствена реакция с еозинофилия и системни симптоми (Drug Reaction with Eosinophilia and Systemic Symptoms, DRESS-синдром) и остра генерализирана екзантематозна пустулоза (ОГЕП), които могат да бъдат животозастрашаващи или фатални.

Субакутен кожен лупус еритематодес (СКЛЕ)

Инхибиторите на протонната помпа са свързани с много редки случаи на СКЛЕ. Ако се появят лезии, особено в участъци от кожата, изложени на слънчеви лъчи, и ако те са съпроводени с болки в ставите, пациентът трябва незабавно да потърси медицинска помощ и медицинският специалист следва да обмисли спиране на приема на Хелицид Репид. СКЛЕ, настъпил след предходно лечение



с инхибитор на протонната помпа, може да увеличи риска от СКЛЕ при употреба на други инхибитори на протонната помпа.

Лечението с инхибитори на протонната помпа може да доведе до леко повишен риск от стомашно-чревни инфекции като *Salmonella* и *Campylobacter* при хоспитализирани пациенти, вероятно също *Clostridium difficile* (вж. точка 5.1).

При пациенти с бъбречна недостатъчност

Остър тубулоинтерстициален нефрит (ТИН) е наблюдаван при пациенти, приемащи омепразол, и може да възникне по всяко време на лечението с омепразол (вж. точка 4.8). Острият тубулоинтерстициален нефрит може да прогресира до бъбречна недостатъчност.

Приемът на омепразол трябва да се преустанови в случай на съмнение за ТИН и незабавно да се започне подходящо лечение.

Повлияване на лабораторните резултати

Повишеното ниво на хромогранин А (CgA) може да попречи на изследванията за невроендокринни тумори. За да се избегне това взаимодействие, лечението с омепразол трябва да се спре най-малко 5 дни преди измерванията на CgA (вж. точка 5.1). Ако нивата на CgA и гастрин не са се възстановили в референтните си граници след началното определяне, измерването трябва да бъде повторено 14 дни след спиране на лечението с инхибитор на протонната помпа.

Пациенти с дългосрочни повтарящи се симптоми на лошо храносмилане или киселини трябва да посещават своя лекар на редовни интервали. По-специално, пациенти над 55 години, които ежедневно приемат лекарства за лошо храносмилане или киселини, които се отпускат без рецепта, трябва да информират своя фармацевт или лекар.

Пациентите трябва да бъдат инструктирани да се консултират с лекар, ако:

- са имали предишна стомашна язва или стомашно-чревна операция
- са на непрекъснато симптоматично лечение на лошо храносмилане или киселини в продължение на 4 или повече седмици
- имат жълтеница или тежко чернодробно заболяване.
- са на възраст над 55 години с нови или наскоро променени симптоми.

Пациентите не трябва да приемат омепразол като превантивно лекарство.

Натрий

Този лекарствен продукт съдържа 225 mg натрий на капсула, което се равнява на 11,2% от препоръчания от СЗО максимален дневен прием от 2 g натрий за възрастен.

4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Ефекти на омепразола върху фармакокинетиката на други активни вещества

Активни вещества със зависима от pH абсорбция

Намалената вътрестомашна киселинност по време на лечение с омепразол може да повиши или намали абсорбцията на активните вещества със стомашно pH-зависима абсорбция.

Нелфинавир, атазанавир

Плазмените нива на нелфинавир и атазанавир се понижават при едновременно приложение с омепразол.



Едновременното приложение на омепразол с нелфинавир е противопоказано (вж. точка 4.3). Едновременното приложение на омепразол (40 mg веднъж дневно) намалява средната експозиция на нелфинавир с приблизително 40% и средната експозиция на фармакологично активния метаболит М8 е намалена с приблизително 75-90%. Взаимодействието може също да включва инхибиране на CYP2C19.

Едновременното приложение на омепразол с атазанавир не се препоръчва (вж. точка 4.4). Едновременното приложение на омепразол (40 mg веднъж дневно) и атазанавир 300 mg/ритонавир 100 mg при здрави доброволци води до 75% намаление на експозицията на атазанавир. Увеличаването на дозата на атазанавир до 400 mg не компенсира влиянието на омепразола върху експозицията на атазанавир. Едновременното приложение на омепразол (20 mg веднъж дневно) с атазанавир 400 mg/ритонавир 100 mg при здрави доброволци води до намаление с приблизително 30% на експозицията на атазанавир в сравнение с атазанавир 300 mg/ритонавир 100 mg веднъж дневно.

Дигоксин

Едновременното лечение с омепразол (20 mg дневно) и дигоксин при здрави доброволци повишава бионаличността на дигоксин с 10%. Рядко се съобщава за токсичност на дигоксин. Все пак трябва да се внимава, когато се прилага омепразол във високи дози при пациенти в напреднала възраст. След това трябва да се засили терапевтичният лекарствен мониторинг на дигоксин.

Клопидогрел

Резултати от изпитвания при здрави доброволци показват фармакокинетично (PK)/фармакодинамично (PD) взаимодействие между клопидогрел (300 mg натоварваща доза/75 mg дневна поддържаща доза) и омепразол (80 mg перорална дневна доза), което води до намалена експозиция на активния метаболит на клопидогрел със средно 46% и намалено максимално инхибиране на (предизвиканата от аденозин дифосфат (АДФ)) тромбоцитна агрегация със средно 16%. Противоречиви данни за клиничните последици от PK/PD взаимодействие на омепразол по отношение на сериозни сърдечно-съдови събития са докладвани както от обсервационни, така и от клинични изпитвания. Като предпазна мярка, едновременната употреба на омепразол и клопидогрел не трябва да се насърчава (вж. точка 4.4).

Други активни вещества

Абсорбцията на позаконазол, ерлотиниб, кетоконазол и итраконазол е значително намалена и по този начин клиничната ефикасност може да бъде нарушена. Едновременната употреба на позаконазол и ерлотиниб трябва да се избягва.

Активни вещества, метаболизирани от CYP2C19

Омепразолът е умерен инхибитор на CYP2C19, основният ензим, метаболизиращ омепразол. По този начин метаболизмът на съпътстващите активни вещества, които също се метаболизират от CYP2C19, може да бъде намален и системната експозиция на тези вещества да се увеличи. Примери за такива лекарствени продукти са R-варфарин и други антагонисти на витамин К, цилостазол, диазепам и фенитоин.

Цилостазол

Омепразол, прилаган в дози от 40 mg на здрави доброволци в кръстосано проучване, повишава C_{max} и AUC за цилостазол съответно с 18% и 26% и един от неговите активни метаболити съответно с 29% и 69%.

Фенитоин



Препоръчва се проследяване на плазмената концентрация на фенитоин през първите две седмици след започване на лечението с омепразол и, ако е направена корекция на дозата на фенитоин, трябва да се извърши проследяване и допълнителна корекция на дозата след края на лечението с омепразол.

Неизвестен механизъм

Саквинавир

Едновременното приложение на омепразол със саквинавир/ритонавир води до повишаване на плазмените нива до приблизително 70% за саквинавир, свързано с добра поносимост при инфектирани с HIV пациенти.

Такролимус

Съобщава се, че едновременното приложение на омепразол повишава серумните нива на такролимус. Трябва да се извърши засилено проследяване на концентрациите на такролимус, както и на бъбречната функция (креатининов клирънс) и дозата на такролимус да се коригира, ако е необходимо.

Метотрексат

Когато се прилага заедно с инхибитори на протонната помпа, се съобщава за повишаване на нивата на метотрексат при някои пациенти. При приложение на високи дози метотрексат може да се наложи временно спиране на омепразол.

Ефекти на други активни вещества върху фармакокинетиката на омепразол

Инхибитори на CYP2C19 и/или CYP3A4

Тъй като омепразолът се метаболизира от CYP2C19 и CYP3A4, активните вещества, за които е известно, че инхибират CYP2C19 или CYP3A4 (като кларитромицин и вориконазол) могат да доведат до повишени серумни нива на омепразол чрез намаляване на скоростта на метаболизма на омепразол. Едновременното лечение с вориконазол води до повече от удвояване на експозицията на омепразол. Тъй като високите дози омепразол се понасят добре, обикновено не се налага коригиране на дозата на омепразол. Трябва обаче да се обмисли коригиране на дозата при пациенти с тежко чернодробно увреждане и ако е показано продължително лечение.

Индуктори на CYP2C19 и/или CYP3A4

Активни вещества, за които е известно, че индуцират CYP2C19 или CYP3A4, или и двете (като рифампицин и жълт кантарион), могат да доведат до понижени серумни нива на омепразол чрез повишаване на скоростта на метаболизъм на омепразол.

4.6 Фертилитет, бременност и кърмене

Бременност

Резултатите от три проспективни епидемиологични проучвания (повече от 1000 експонирани резултата) не показват нежелани ефекти на омепразол върху бременността или върху здравето на плода/новороденото дете. Омепразол може да се използва по време на бременност.

Кърмене

Омепразол се екскретира в кърмата, но е малко вероятно да повлияе на детето, когато се използват терапевтични дози.

Фертилитет



Изпитвания при животни с рацемичната смес омепразол, прилагана перорално, не показват ефекти по отношение на фертилитета.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Не се очаква омепразолът да засегне способността Ви да шофирате или да работите с машини. Може да настъпят нежелани лекарствени реакции като замаяване и зрителни нарушения (вж. точка 4.8). Ако са засегнати, пациентите не трябва да шофират или работят с машини.

4.8. Нежелани лекарствени реакции

Резюме на профила на безопасност

Най-честите нежелани реакции (1-10% от пациентите) са главоболие, коремна болка, запек, диария, газове и гадене/повръщане.

Съобщават се тежки кожни нежелани реакции, включително синдром на Стивънс-Джонсън, токсична епидермална некролиза лекарствена реакция с еозинофилия и системни симптоми и остра генерализирана екзантематозна пустулоза във връзка с лечението с омепразол (вж. точка 4.4).

Табличен списък на нежеланите лекарствени реакции

Следните нежелани лекарствени реакции са идентифицирани или подозирани в програмата за клинични изпитвания за омепразол и постмаркетинговия период. Не е установено някоя от тях да е свързана с дозирането. Изброените по-долу нежелани реакции са класифицирани по честота и системо-органи класове (SOC). Категориите по честота се определят съгласно следната конвенция: много чести ($\geq 1/10$), чести ($\geq 1/100$ до $< 1/10$), нечести ($\geq 1/1\,000$ до $< 1/100$), редки ($\geq 1/10\,000$ до $< 1/1\,000$), много редки ($< 1/10\,000$), с неизвестна честота (не може да бъде направена оценка от наличните данни).

SOC/честота	Нежелана реакция
Нарушения на кръвта и лимфната система	
Редки	Левкопения, тромбоцитопения
Много редки	Агранулоцитоза, панцитопения
Нарушения на имунната система	
Редки	Реакции на свръхчувствителност, напр. треска, ангиоедем и анафилактична реакция/шок
Нарушения на метаболизма и храненето	
Редки	Хипонатриемия
С неизвестна честота	Хипомагнезиемия, тежка хипомагнезиемия може да доведе до хипокалциемия. Хипомагнезиемията може също да бъде свързана с хипокалиемия.
Психични нарушения	
Нечести	Безсъние
Редки	Неспокойствие, объркване, депресия
Много редки	Агресивност, халюцинации



Нарушения на нервната система	
Чести	Главоболие
Нечести	Замаяност, парестезия, сънливост
Редки	Вкусови нарушения
Зрителни нарушения	
Редки	Замъглено виждане
Нарушения на ухото и лабиринта	
Нечести	Вертиго
Респираторни, гръдни и медиастинални нарушения	
Редки	Бронхоспазъм
Стомашно-чревни нарушения	
Чести	Коремна болка, запек, диария, газове, гадене/повръщане, полипи на фундалната жлеза (доброкачествени)
Редки	Сухота в устата, стоматит, стомашно-чревна кандидоза
С неизвестна честота:	Микроскопичен колит
Хепатобиларни нарушения	
Нечести	Повишени чернодробни ензими
Редки	Хепатит със или без жълтеница
Много редки	Чернодробна недостатъчност, енцефалопатия при пациенти с предшестващо чернодробно заболяване
Нарушения на кожата и подкожната тъкан	
Нечести	Дерматит, пруритус, обрив, уртикария
Редки	Алоpecia, фоточувствителност, остра генерализирана екзантематозна пустулоза, лекарствена реакция с еозинофилия и системни симптоми
Много редки	Еритема мултиформе, синдром на Стивънс-Джонсън, токсична епидермална некролиза
С неизвестна честота	Субакутен кожен лупус еритематодес (вж. точка 4.4).
Нарушения на мускулно-скелетната система и съединителната тъкан	
Редки	Артралгия, миалгия
Много редки:	Мускулна слабост
Нарушения на бъбреците и пикочните пътища	
Редки	Тубулоинтерстициален нефрит (с възможна прогресия до бъбречна недостатъчност)
Нарушения на възпроизводителната система и гърдите	



Много редки	Гинекомастия
Общи нарушения и ефекти на мястото на приложение	
Нечести	Неразположение, периферен оток
Редки	Повишено изпотяване

Съобщаване на подозирани нежелани реакции

Съобщаването на подозирани нежелани реакции след разрешаване за употреба на лекарствения продукт е важно. Това позволява да продължи наблюдението на съотношението полза/риск за лекарствения продукт. От медицинските специалисти се изисква да съобщават всяка подозирана нежелана реакция на:

Изпълнителна агенция по лекарствата

ул. „Дамян Груев“ № 8

1303 София

Тел.: +359 2 8903417

уебсайт: www.bda.bg

4.9 Предозиране

Наличната информация за ефектите от предозиране на омепразол при хора е ограничена. В литературата са описани дози до 560 mg и са получавани спорадични съобщения, когато единични перорални дози са достигнали до 2400 mg омепразол (120 пъти над обичайната препоръчителна клинична доза). Съобщава се за гадене, повръщане, замаяност, коремна болка, диария и главоболие. Освен това в единични случаи са описани апатия, депресия и объркване.

Симптомите, описани във връзка с предозиране с омепразол, са преходни и не се съобщава за сериозен резултат. Скоростта на елиминиране е непроменена (кинетика от първи ред) с повишени дози. Лечението, ако е необходимо, е симптоматично.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: Лекарства за киселинни нарушения, инхибитори на протонната помпа;

АТС код: A02BC01.

Механизъм на действие

Омепразол, рацемична смес от 2 енантиомера, намалява секрецията на стомашна киселина чрез силно насочен механизъм на действие. Той е специфичен инхибитор на киселинната помпа в париеталните клетки. Той действа бързо и осигурява контрол чрез обратимо инхибиране на секрецията на стомашна киселина при дозиране веднъж дневно.

Омепразол е слаба основа и се концентрира и превръща в активна форма в силно киселинната среда на вътреклетъчните каналикули в париеталните клетки, където инхибира ензима H^+/K^+ -АТФаза – киселинната помпа. Този ефект върху последния етап от процеса на образуване на стомашна киселина е зависим от дозата и осигурява високоефективно инхибиране както на базалната киселинна секреция, така и на стимулираната киселинна секреция, независимо от стимула.



Фармакодинамични ефекти

Всички наблюдавани фармакодинамични ефекти могат да се обяснят с ефекта на омепразола върху киселинната секреция.

Ефект върху секрецията на стомашна киселина

Пероралното приложение на омепразол веднъж дневно осигурява бързо и продължително инхибиране на дневната и нощната секреция на стомашна киселина, като максимален ефект се постига в рамките на 4 дни от лечението. С омепразол 20 mg се поддържа средно понижение от най-малко 80% в 24-часовата вътрестомашна киселинност при пациенти с дуоденална язва, като средното намаление на пиковата киселинна продукция след стимулация с пентагастрин е около 70% 24 часа след приемането на дозата.

Пероралното дозиране на омепразол 20 mg поддържа вътрестомашно $\text{pH} \geq 3$ за средно време от 17 часа от 24-часовия период при пациенти с дуоденална язва.

Като следствие от намалената киселинна секреция и вътрестомашна киселинност, омепразолът, в зависимост от дозата, намалява/нормализира експозицията на киселина в хранопровода при пациенти с гастро-езофагеална рефлуксна болест. Инхибирането на киселинната секреция е свързано с площта под кривата за плазмена концентрация/време (AUC) на омепразола, а не с действителната плазмена концентрация в дадения момент.

Не е наблюдавана тахифилаксия по време на лечение с омепразол.

Други ефекти, свързани с киселинното инхибиране

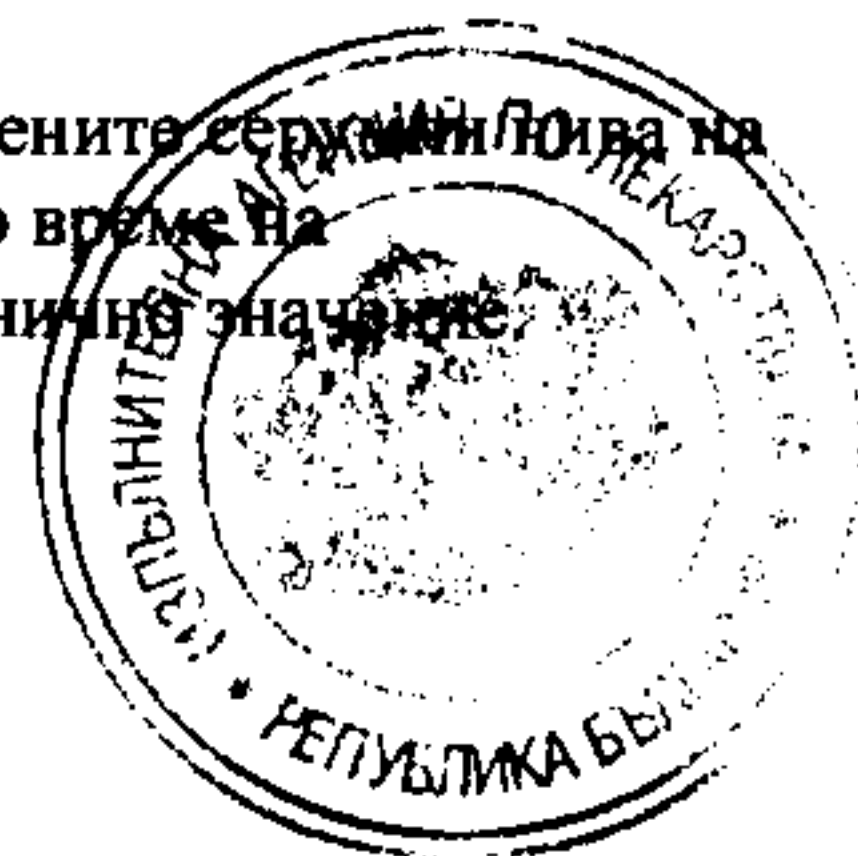
По време на продължително лечение се съобщава за повишена честота на стомашни жлезисти кисти. Тези промени са физиологична последица от изразено инхибиране на киселинната секреция, доброкачествени са и изглеждат обратими.

Намалената стомашна киселинност, дължаща се на каквито и да било причини, включително инхибитори на протонната помпа, увеличава броя на стомашните бактерии, които обикновено присъстват в стомашно-чревния тракт. Лечението с лекарствени продукти, намаляващи киселинността, може да доведе до леко повишен риск от стомашно-чревни инфекции, като *Salmonella* и *Campylobacter*, а при хоспитализирани пациенти, вероятно и *Clostridium difficile*.

Омепразол, както всички лекарства, блокиращи киселинността, може да намали абсорбцията на витамин B12 (цианокобаламин) поради хипо- или ахлорхидрия. Това трябва да се има предвид при пациенти с намалени телесни запаси или рискови фактори за намалена абсорбция на витамин B12 при продължителна терапия.

По време на лечение с антисекреторни лекарствени продукти, гастринът в серума се повишава в отговор на понижената киселинна секреция. В резултат на намалената стомашна киселинност се повишава и нивото на CgA. Повишеното ниво на CgA може да повлияе на изследванията за невроендокринни тумори. Наличните публикувани данни показват, че прилагането на инхибитори на протонната помпа трябва да се преустанови между 5 дни и 2 седмици преди измерване на CgA. Това се прави с цел нивата на CgA, които могат да са лъжливо повишени след лечение с ИПП, да се възстановят до референтните си граници.

Увеличен брой ентерохромафинни клетки (ЕХК), вероятно свързан с повишените серумни нива на гастрин, е наблюдаван при някои пациенти (както деца, така и възрастни) по време на продължително лечение с омепразол. Счита се, че констатациите нямат клинично значение.



5.2 Фармакокинетични свойства

Резорбция

Хелицид Репид е формулировка с незабавно освобождаване на омепразол в необвита форма. Омепразол е киселинно лабилен и следователно формулировката на Хелицид Репид съдържа натриев хидроген карбонат, който неутрализира киселинното рН в стомаха и по този начин предпазва омепразола от киселинно разграждане, улеснявайки абсорбцията. Абсорбцията на омепразол е бърза, като пиковите плазмени нива се постигат приблизително 30 минути след дозата от Хелицид Репид. Абсорбцията на омепразол се извършва в тънките черва и обикновено завършва в рамките на 3-6 часа.

В проучване за бионаличност, приемането с храна намалява степента на абсорбция с приблизително 50%. Поради това Хелицид Репид не трябва да се приема с храна. Системната наличност (бионаличност) от единична перорална доза омепразол е приблизително 40%. След многократно приложение веднъж дневно, бионаличността се увеличава до около 60%.

Разпределение

Привидният обем на разпределение при здрави доброволци е приблизително 0,3 l/kg телесно тегло. Омепразолът се свързва в 97% с плазмените протеини.

Биотрансформация

Омепразолът се метаболизира напълно от системата на цитохром Р450 (СYP). Основната част от метаболизма му зависи от полиморфно експресирания СYP2C19, отговорен за образуването на хидроксиомепразол, основният метаболит в плазмата. Останалата част зависи от друга специфична изоформа, СYP3A4, отговорна за образуването на омепразол сулфон. Като следствие от високия афинитет на омепразол към СYP2C19, има потенциал за конкурентно инхибиране и метаболитни взаимодействия лекарство-лекарство с други субстрати за СYP2C19. Въпреки това, поради ниския афинитет към СYP3A4, омепразол няма потенциал да инхибира метаболизма на други субстрати на СYP3A4. Освен това на омепразола му липсва инхибиторен ефект върху главните СYP ензими.

Приблизително 3% от населението от европейската раса и 15–20% от населението от азиатската раса нямат функционален ензим СYP2C19 и се наричат слаби метаболизатори. При такива индивиди метаболизмът на омепразол вероятно се катализира главно от СYP3A4. След многократно приложение веднъж дневно на 20 mg омепразол, средната AUC е 5–10 пъти по-висока при бавни метаболизатори, отколкото при лица с функциониращ ензим СYP2C19 (бързи метаболизатори). Средните пикови плазмени концентрации също са били по-високи, с 3–5 пъти. Тези констатации нямат значение за дозировката на омепразол.

Елиминиране

Плазменият елиминационен полуживот на омепразола обикновено е по-кратък от 1 час както след еднократно, така и след многократно перорално приложение веднъж дневно. Омепразолът се елиминира напълно от плазмата между дозите без тенденция за натрупване по време на приложение веднъж дневно. Почти 80% от пероралната доза омепразол се екскретира под формата на метаболити в урината, а останалата част във фекалиите, основно с произход от жлъчната секреция.

Линейност/нелинейност

AUC на омепразола се повишава при многократно приложение. Това увеличение зависи от дозата и води до нелинейна връзка доза/AUC след многократно приложение. Тази зависимост от времето и дозата се дължи на намаляване на метаболизма при първо преминаване и системния клирънс.



вероятно причинени от инхибиране на ензима CYP2C19 от омепразол и/или неговите метаболити (напр. сулфон).

Не е установен метаболит, който да има ефект върху секрецията на стомашна киселина.

Специални популации

При пациенти с чернодробна недостатъчност

Метаболизмът на омепразол при пациенти с чернодробна дисфункция е нарушен, което води до повишена AUC. Омепразолът не показва тенденция към натрупване при дозиране веднъж дневно.

При пациенти с бъбречна недостатъчност

Фармакокинетиката на омепразола, включително системната бионаличност и скоростта на елиминиране, не се променя при пациенти с намалена бъбречна функция.

При пациенти в старческа възраст

Скоростта на метаболизма на омепразола е до известна степен намалена при пациенти в напреднала възраст (75-79 години).

5.3 Предклинични данни за безопасност

Стомашна ентерохромафинно-клетъчна хиперплазия и карциноиди са наблюдавани в изпитвания през целия живот при плъхове, лекувани с омепразол. Тези промени са резултат от продължителна хипергастринемия вследствие на киселинното инхибиране. Подобни открития са направени след лечение с H₂-рецепторни антагонисти, инхибитори на протонната помпа и след частична фундектомия. По този начин тези промени не се дължат на пряк ефект от отделно активно вещество.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Капсулно съдържимо

Натриев хидроген карбонат (E500ii)

Натриев нишестен гликолат (тип А)

Натриев стеарил фумарат (E485)

Състав на капсулата

Желатин (E441)

Железен оксид, червен (E172)

Титанов диоксид (E171)

6.2 Несъвместимости

Неприложимо.

6.3 Срок на годност

2 години

6.4 Специални условия на съхранение



Да се съхранява при температура под 25°C. Да се съхранява в оригиналната опаковка, за да се предпази от влага.

6.5 Вид и съдържание на опаковката

Капсулите са опаковани в алуминиеви блистери от PVC/PVDC.

Размер на опаковките: 7 и 14 твърда капсули

Не всички видове опаковки могат да бъдат пуснати в продажба.

6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне

Неизползваният лекарствен продукт или отпадъчните материали от него трябва да се изхвърлят в съответствие с местните изисквания.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Zentiva k.s.
U kabelovny 130,
Dolní Měcholupy
102 37, Prague 10
Чешка република

8. НОМЕР(А) НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Per. №: 20240092

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

Дата на първо разрешаване: 15.04.2024 г.

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

09.09.2024 г.

