

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Лансопрол 15 mg стомашно-устойчиви твърди капсули
Lansoprol 15 mg gastro-resistant capsules, hard

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА	
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1	
Към Рег. №	2004-0512
Разрешение №	36378 / 03-02-2007
Содержание №	

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всяка капсула съдържа 15 mg лансопразол (*lansoprazole*).

Помощно вещество с известно действие: захароза.

За пълния списък на помощните вещества вижте т.6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Стомашно-устойчива твърда капсула.

Непрозрачни капсули със светло оранжево тяло и капаче. Всяка капсула съдържа бели до почти бели стомашно - устойчиви микропелети.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

- Лечение на доброкачествени дуоденална и стомашна язви
- Лечение на рефлукс езофагит
- Профилактика на рефлукс езофагит
- Ерадикация на *Helicobacter pylori* (*H. pylori*) в комбинация със съответна антибиотична терапия за лечение на *Helicobacter pylori* – асоциирана язва.
- Лечение на свързани с прием на нестероидни противовъзпалителни средства (НСПВС) доброкачествени стомашни и дуоденални язви, изискващи задължително лечение с НСПВС.
- Профилактика на развитие на свързани с прием на НСПВС стомашни и дуоденални язви при рискови пациенти, изискващи продължително лечение (виж точка 4.2)
- Симптоматична гастроезофагеална рефлуксна болест
- Краткотрайно лечение на ерозивен езофагит
- Патологични хиперсекреторни състояния, включително Синдром на Zollinger-Ellison

4.2 Дозировка и начин на приложение

За постигане на оптимален ефект, Лансопрол трябва да се приема веднъж дневно – сутрин, освен когато се използва за ерадикация на *H. pylori* – тогава Лансопрол се приема два пъти дневно, сутрин и вечер.

Лансопрол трябва да се приема 30 минути преди хранене (вж. точка 5.2).

Капсулите се приемат цели с малко течност.

За пациенти, които имат затруднения при преглъщане, изследванията и клиничната практика показват, че капсулите могат да се отворят и микропелетите да се разбъркат с малко вода, ябълков/доматен сок или да се добавят към малко количество мека храна (напр. кисело мляко, ябълково пюре), за да се облекчи приемането.



След приготвяне, разтвора или сместта трябва да се приемат незабавно.
Капсулите могат да се отворят и микропелетите да се разбъркат с 40 ml ябълков сок при прилагане на Лансопрол чрез назогастрална сонда (вж. точка 5.2).
След приготвяне, разтвора или сместта, трябва да се приемат незабавно.

Лечение на доброкачествена дуоденална язва

Препоръчителната доза е 30 mg лансопразол веднъж дневно в продължение на 2 седмици. Ако пациента не е оздравял напълно за 2 седмици, лечението може да продължи при същата доза за още 2 седмици.

Лечение на доброкачествена стомашна язва

Препоръчителната доза е 30 mg лансопразол веднъж дневно в продължение на 4 седмици. Язвата обикновено се лекува в рамките на 4 седмици, но за пациенти, които не са напълно излекувани за това време, лечението може да продължи при същата доза за още 4 седмици.

Лечение на рефлукс езофагит

Препоръчителната доза е 30 mg лансопразол веднъж дневно в продължение на 4 седмици. Ако пациента не е напълно оздравял за този период, лечението може да продължи при същата доза още 4 седмици.

Профилактика на рефлукс езофагит

Препоръчителната доза е 15 mg лансопразол дневно. Дозата може да бъде увеличена до 30 mg, ако е необходимо.

Ерадикация на *Helicobacter pylori*

При избора на подходяща комбинирана терапия трябва да се имат предвид официалните местни ръководства по отношение на бактериална резистентност, продължителност на лечението (най-често 7 дни, но понякога до 14 дни) и правилната употреба на антибактериални агенти.

Препоръчителната доза е 30 mg Лансопрол два пъти на ден за 7 дни в една от изброените комбинации:

Кларитромицин 250 -500 mg два пъти дневно + 1 g амоксицилин два пъти на ден

Кларитромицин 250 mg два пъти дневно + 400 – 500 mg метронидазол два пъти на ден

Ерадикация на *H. Pylori* до 90% се постига когато кларитромицин е комбиниран с лансопразол и амоксицилин или метронидазол.

Шест месеца след успешна ерадикация, рискът от ре-инфекция е нисък и рецидиви са малко вероятни.

Използването на режим на лечение включващ 30 mg лансопразол два пъти дневно, амоксицилин 1 g два пъти дневно и метронидазол 400-500 mg два пъти дневно, също е проучван. При тази комбинация са били наблюдавани по-ниски нива на успеваемост за унищожаване на *H. Pylori*, отколкото при терапия по схема с кларитромицин. Тази комбинация е подходяща, когато пациентът не може да приема кларитромицин и местните нива на резистентност към метронидазол са ниски.

Лечение на свързани с прием на нестероидни противовъзпалителни средства (НСПВС) доброкачествени стомашни и дуоденални язви при пациенти, изискващи продължително лечение с НСПВС.

Препоръчителната доза е 30 mg лансопразол веднъж дневно в продължение на 4 седмици. При пациенти, които не са напълно излекувани за този период, лечението може да бъде продължено за още 4 седмици.



Профилактика на развитие на свързани с прием на НСПВС доброкачествени стомашни и дуоденални язви при рискови пациенти (възраст над 65 години или с история на стомашна или дуоденална язва) изискващи продължително лечение с НСПВС

Препоръчителната доза е 15 mg лансопразол веднъж дневно. Ако лечението е неуспешно може да се приложи доза от 30 mg веднъж дневно.

Симптоми на гастроезофагеална рефлуксна болест

Препоръчителната доза е 15mg или 30 mg лансопразол дневно, по преценка на лекуващия лекар, индивидуално за всеки пациент. Облекчаването на симптомите се постига бързо. Ако въпреки това симптомите не са овладяни за 4 седмици при доза от 30 mg лансопразол дневно, е препоръчително извършването на допълнителни прегледи и изследвания.

Краткотрайно лечение на ерозивен езофагит

Препоръчителната доза през устата за възрастни е 30 mg лансопразол веднъж дневно за не повече от 8 седмици. При пациенти, които не се повлияват с Лансопрол за 8 седмици /5-10%/ допълнителното лечение още 8 седмици може да се окаже от полза.

Синдром на Zollinger-Ellison

Препоръчителната начална доза е 60 mg лансопразол веднъж дневно. Дозата трябва да се съобрази с индивидуалните нужди на пациента, а продължителността се определя в зависимост от клиничните прояви. Дневни дози до 180 mg лансопразол могат да бъдат използвани. Ако необходимата дневна доза е по-голяма от 120 mg лансопразол, то приема трябва да се извършва в две разделени дози.

Пациенти с нарушена чернодробна или бъбречна функции

Не е необходима промяна на дозата при пациенти с нарушена бъбречна функция.

Пациенти с умерено или тежко чернодробно заболяване трябва да бъдат под редовно наблюдение като се препоръчва намаление на дневната дозат с 50% (вж. точка 4.4 и 5.2).

Пациенти в напреднала възраст

Поради намален клирънс на лансопразол при пациенти в напреднала възраст, може да е необходимо корекция на дозата в зависимост от индивидуалния отговор. Дневната доза от 30 mg лансопразол не трябва да бъде превишавана, освен ако не съществуват убедителни клинични показания.

Деца

Лечението с Лансопрол на деца на възраст под 1 година трябва да се избягва, тъй като наличната информация не е показала положителен ефект върху лечението на гастроезофагиална рефлуксна болест.

4.3 Противопоказания

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

Лансопразол не трябва да се приема с атазанавир (вж. точка 4.5).

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Общото с останалите лекарствени продукти, които се използват за лечение на язви е, че преди да се пристъпи към лечение с лансопразол е необходимо да се изключи наличието на злокачествено заболяване на хранопровода или стомаха, тъй като терапията с лансопразол



може да маскира симптомите, свързани със злокачественото заболяване, и да забави неговото диагностициране.

Лансопразол трябва да се използва с повишено внимание при пациенти с умерена или тежка чернодробна дисфункция (вж. точка 4.2 и 5.2).

Намаляването на стомашната киселинност при приема на лансопразол може да доведе до увеличаване броят на бактериите, които обикновено присъстват в гастроинтестиналния тракт. Лечението с лансопразол може да доведе до леко повишаване на риска от гастроинтестинални инфекции като *Salmonella* и *Campylobacter*.

При пациенти страдащи от стомашни и дуоденални язви, вероятността от инфекция с *H. Pylori* следва да се разглежда като етиологичен фактор.

Ако лансопразол се използва в комбинация с антибиотици за ерадикация на *H. Pylori*, тогава инструкциите за употреба на тези антибиотици също трябва да се съблюдават.

Поради ограничените данни за безопасност при пациентите на поддържащо лечение с лансопразол за период по-дълъг от 1 година, трябва редовно да се извършва оценка на лечението и на съотношението риск/полза за тези пациенти.

Изключително рядко са съобщавани случаи на колит при пациенти приемащи лансопразол. Следователно, в случай на тежка и/или персистираща диария, следва да се обмисли преустановяване на лечението.

Лечението на пептична язва при пациенти, нуждаещи се от продължително лечение с НСПВС, трябва да бъде ограничено до пациенти с висок риск (например стомашно-чревно кървене, перфорация или язва, старческа възраст, едновременно използване на лекарства, увеличаващи вероятността от нежелани лекарствени реакции от страна на горната част на гастроинтестиналния тракт (например кортикостероиди или антикоагуланти), наличие на сериозна коморбидност или продължителна употреба на НСПВС в максимални дози).

При пациенти лекувани с инхибитори на протонната помпа (ИПП) като лансопразол, не по-малко от три месеца, а в повечето случаи и на 1 година, има съобщения за тежка хипомагнезиемия. Сериозни прояви на хипомагнезиемия като гадене, тетания, делириум, конвулсии, замаяност и камерна аритмия могат да се появят, но те могат да започнат и незабелязано и да бъдат пренебрегнати. В повечето случаи хипомагнезиемията изчезва след прием на добавки съдържащи магнезий и прекратяване на лечението с ИПП.

При пациенти, за които се очаква, че ще бъдат на продължителна терапия с ИПП с дигоксин или лекарства, които могат да причинят хипомагнезиемия (напр. диуретици), медицинските специалисти трябва да извършат лабораторни тестове за определяне на нивата на магнезий преди да започне лечението с ИПП, както и периодично по време на терапията.

Инхибиторите на протонната помпа, особено ако се използват във високи дози продължително време (над 1 година) могат рязко да повишат риска от фрактура на бедрото, китката или гръбначния стълб, предимно при пациенти в напреднала възраст или при наличие на други рискови фактори. Подобни изследвания показват, че инхибиторите на протонната помпа, могат да повишат общия риск от фрактури с 10-40%. Част от това повишаване може да се дължи на други рискови фактори. Пациентите, рискови за остеопороза, трябва да получат, според съвременните клинични насоки, адекватен прием на витамин D и калций.

В много редки случаи инхибитори на протонната помпа са свързани със SCLE. Ако възникнат лезии, особено в откритите за слънце участъци от кожата, и ако са придружени от болки в ставите, пациентът трябва да потърси медицинска помощ незабавно и медицинският специалист трябва да обмисли спирането на Лансопрол. SCLE след предишно лечение с инхибитор на протонната помпа, може да увеличи риска от SCLE с други инхибитори на протонната помпа.



Повлияване на лабораторните резултати

Повишеното ниво на хромогранин А (CgA) може да повлияе на изследванията за невроендокринни тумори. За да се избегне това взаимодействие, лечението с Лансопрол трябва да се спре временно най-малко за 5 дни преди определянето 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.

Лансопрол съдържа захароза. Пациенти с редки наследствени проблеми на непоносимост към фруктоза, глюкозо-галактозна малабсорбция или сукраза-изомалтазна недостатъчност не трябва да приемат това лекарство.

4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Ефекти на лансопразол върху други лекарства

Лекарствени продукти с рН зависима абсорбция

Лансопразол може да влияе върху абсорбцията на лекарства, при които стомашното рН е важна детерминанта на бионаличността.

Атазанавир

Проучване е доказало, че едновременното приложение на лансопразол (60 mg дневно) с атазанавир 400 mg при здрави доброволци, води до съществено намаляване на експозицията на атазанавир (приблизително 90% намаление в AUC и C_{max}). Лансопразол не трябва да се прилага едновременно с атазанавир (вж. точка 4.3).

Кетоконазол и итраконазол

Абсорбцията на кетоконазол и итраконазол в гастроинтестиналния тракт се увеличава от киселинността в стомаха. Приложението на лансопразол може да доведе до намаляване терапевтичните концентрации на кетоконазол и итраконазол и тази комбинация трябва да се избягва.

Дигоксин

Едновременното приложение на лансопразол и дигоксин може да доведе до повишаване плазмените нива на дигоксин. Следователно плазмените нива на дигоксин трябва да се мониторира и ако е необходимо дозата на дигоксин трябва да се коригира при започване и приключване на лечението с лансопразол.

Лекарствени продукти метаболизирани чрез системата на цитохром Р 450

Лансопразол може да повиши плазмените концентрации на лекарства, които се метаболизират от CYP3A4. Препоръчва се повишено внимание при комбинирането на лансопразол с лекарства, които се метаболизират от този ензим и имат тесен терапевтичен прозорец.

Теофилин

Лансопразол редуцира плазмената концентрация на теофилин, при което може да се очаква намаляване на клиничният ефект на дозата. Едновременното приложение на лансопразол и теофилин може по изключение да доведе в известна степен до по-бърза (с 10%) екскреция на теофилина, но този ефект обикновено няма клинично значение.

Тъй като взаимодействието с теофилин, фенитоин или варфарин може да бъде значително при отделни пациенти, препоръчва се повишено внимание при рисковите пациенти.



Такролимус

Едновременното приложение с лансопразол може да доведе до повишаване плазмените нива на такролимус (на CYP3A и P-gp субстрат). Експозиция с лансопразол увеличава средната експозиция на такролимус с до 81%.

Следователно плазмените нива трябва да се мониторират при започване и приключване на комбинирано лечение с лансопразол.

Лекарствени продукти, транспортирани от Р-гликопротеини

При употребата на лансопразол е наблюдавано инхибиране на транспортния протеин Р-гликопротеин (P-gp) *in vitro*. Клиничната значимост на този факт е неизвестна.

Ефекти на други лекарства върху лансопразол

Лекарства, които са инхибитори на CYP2C19

Флувоксамин

Когато лансопразол се комбинира с CYP2C19 инхибитора флувоксамин може да се наложи редуциране на дозата. Плазмените концентрации на лансопразол се увеличават до 4-кратно.

Лекарства, които индуцират CYP2C19 и CYP3A4

Ензимните индуктори засягащи CYP2C19 и CYP3A4, като рифампицин и жълт кантарион (*Hypericum perforatum*) могат чувствително да намалят плазмените концентрации на лансопразол.

Други

Сукралфат/Антиацидни препарати

Сукралфат и антиацидни препарати могат да намалят бионаличността на лансопразол. Въпреки, че взаимодействието обикновено няма клинична значимост, предпочително е пациентите да приемат сукралфат или антиацидни препарати най-малко 1 час след лансопразол.

НСПВС

Не са наблюдавани клинично значими взаимодействия на лансопразол с НСПВС, въпреки че не са провеждани официални проучвания за взаимодействия.

4.6 Фертилитет, бременност и кърмене

Бременност

Според класификацията на FDA лансопразол се класифицира в категория В.

За лансопразол няма клинични данни за експозиция по време на бременност.

Проучванията при животни не винаги показват директно или индиректно вредно въздействие върху ембрионалното/феталното развитие, раждането или постнаталното развитие.

Ето защо, употребата на лансопразол по време на бременност не се препоръчва.

Кърмене

Не е известно дали лансопразол или неговите метаболити се отделят в кърмата. Проучванията при животни са показали екскреция на лансопразол в млякото.

Поради потенциалния риск от сериозни нежелани реакции при кърмачетата, трябва да се вземе решение: да се преустанови кърменето или да се спре лекарството, като се преценява значението му за лечението на майката.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Няма съобщения лансопразол да повлиява способността за шофиране и работа с машини.

Някои нежелани лекарствени е възможно по изключение да отслабят способността за концентрация.



4.8 Нежелани лекарствени реакции

Честотата на нежеланите лекарствени реакции се определя като: чести ($>1/100$, $<1/10$); нечести ($>1/1000$, $<1/100$); редки ($>1/10\ 000$ $<1/1000$); много редки ($<1/10\ 000$).

	Чести	Нечести	Редки	Много редки	С неизвестна честота
Нарушения на кръвта и лимфната система		Тромбоцитопения Еозинофилия Левкопения	Анемия	Агранулоцитоза Панцитопения	
Нарушения на метаболизма и храненето					Хипомагнезиемия (виж точка 4.4)
Психични нарушения		Депресия	Безсъние Халюцинации Объркване		
Нарушения на нервната система	Главоболие Замайване		Безпокойство Световъртеж Перестезии Сънливост Тремор		
Нарушения на очите			Зрителни нарушения		
Стомашно-чревни нарушения	Гадене, Диария Болка в стомаха Запек Повръщане Флатуленция Сухота в устата или гърлото		Глосит Кандидоза на езофагуса Панкреатит Вкусови нарушения	Колит Стоматит	
Хепато-билиарни нарушения	Повишаване стойностите на Чернодробните ензими		Хепатит		
Нарушения на кожата и подкожната тъкан	Уртикария Сърбеж		Петехии Пурпура Загуба на коса Еритема мултиформе Фоточувствителност	Синдром на Stevens-Johnson Токсична епидермална некролиза	
Нарушения на мускулно-скелетната система и съединителната тъкан		Артралгия Миалгия			
Нарушения на бъбреците и			Интерстициален нефрит		



пикочните пътница					
Нарушения на възпроизводителн ата система и гърдата			Гинекомастия		
Общи нарушения и ефекти на мястото на приложение	Умора	Оток	Треска Хиперхидроза Ангиедем Анорексия Импотентност	Анафилактичен шок	
Изследвания				Повишаване стойностите на холестерол и триглицериди Хипонатримия	

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. Нежеланите реакции може да бъдат съобщени директно на Изпълнителна агенция по лекарствата (ИАЛ):

БЪЛГАРИЯ, София 1303, ул. Дамян Груев 8

Тел. +359 2 8903555

ел. поща: bda@bda.bg

уебсайт: www.bda.bg

4.9 Предозиране

Ефекти на предозиране на лансопразол при хора не са известни и следователно инструкции за лечение на предозиране не могат да бъдат дадени. Все пак, дневни дози до 180 mg лансопразол перорално и до 90 mg лансопразол интравенозно са прилагани без значителни нежелани лекарствени реакции.

Вижте точка 4.8 за възможните симптоми на предозиране на лансопразол.

Лансопразол няма антидот. В случай на съмнения за предозиране, пациентът трябва да бъде поставен под наблюдение. Лансопразол не се елиминира от кръвообръщението чрез хемодиализа. В случай на предозиране се започва симптоматично и поддържащо лечение. Ако е необходимо, препоръчва се предизвикано изпразване на стомаха (предизвикано повръщане), тъй като лекарството е стомашно устойчиво.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: Инхибитор на протонната помпа

АТС код: A02BC03

Лансопразол спада към клас антисекреторни съединения, заместени бензимидазоли, които не притежават антихолинергично или хистамин H₂ рецепторно антагонистично действие, но подтискат стомашната киселинна секреция чрез специфично инхибиране на (H⁺, K⁺)-АТФ-азата, която е част от ензимната система, разположена на секреторната повърхност на стомашните париетални клетки. Тъй като тази ензимна система се счита за киселинна (протонна) помпа на париеталната клетка, лансопразол се определя като инхибитор на стомашната киселинна помпа и като такъв блокира крайната стъпка в киселинната продукция. Лансопразол намалява киселинността на



стомашния сок и увеличава времето, през което стойностите на рН са >3 и/или >4 . Този ефект е дозозависим и води до подтискане, както на базалната така и на стимулираната стомашна киселинна секреция, независимо от стимула.

Ефект върху киселинната секреция

Лансопразол е специфичен инхибитор на париеталната стомашна протонна помпа.

Единична доза на лансопразол приета перорално инхибира пентагастрин-стимулираната киселинна секреция с около 80%. След приложение на лансопразол за седем дни се постига около 90% инхибиране на секрецията на стомашна киселина.

При единична дневна доза от 30 mg лансопразол приемана перорално, редуцирането на стомашната секреция е с около 70% и симптомите на пациентите са овладяни още от първата доза. При многократен прием след 9 дни редуцирането на стомашната секреция е с около 85 %. Бързо облекчаване на симптомите се получава от 30 mg лансопразол дневно и повечето пациенти с дуоденална язва се възстановят в рамките 2 седмици, а пациентите с язва на стомаха и рефлукс езофагит в рамките на 4 седмици.

Подтискането на стомашната киселинност може да увеличи ефекта на антибиотиците при унищожаването на *Helicobacter pylori*.

По време на лечение с антисекреторни лекарствени продукти гастрин 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.

5.2 Фармакокинетични свойства

Лансопразол представлява рацемична смес от два активни енантиомера, които се биотрансформират в активна форма в киселата среда на париеталните клетки. Тъй като лансопразол се инактивира от стомашната киселина, той се прилага перорално в стомашно-устойчива форма за системна абсорбция.

Абсорбция и разпределение

Абсорбцията на лансопразол е сравнително пълна, с абсолютна бионаличност 80-90% след единична доза.

Абсорбцията на лансопразол е бърза, със среден пик на плазмените нива на лансопразол след около 1,5 до 2,0 часа.

Приема на храна понижава скоростта на абсорбция и абсолютната бионаличност с около 50%. Свързването с плазмените протеини е 97% .

Проучвания са показали, че с приемането на микрогранули от отворени капсули се достигат същите нива на плазмени концентрации и AUC, както при приема на цяла капсулата, ако микропелетите се суспендират в малко количество портокалов сок, ябълков сок или се смесят с една супена лъжица пюре от ябълки или круши или поръсени върху една супена лъжица кисело мляко, пудинг или извара. Еквивалентно AUC се постига, ако гранулите се суспендират в ябълков сок и се прилагат чрез назогастрална сонда.

Биотрансформация и елиминиране

Лансопразол се метаболизира предимно в черния дроб. Метаболизма на лансопразол се катализира основно от ензима CYP2C19. Ензима CYP3A4 също участва в метаболизма на лансопразол. Плазменият елиминационен полуживот е в границите от 1 до 2 часа при единичен



или многократен прием при здрави пациенти. Няма доказателства за натрупване, след многократно приложение на дози при здрави индивиди. Сулфони, сулфиди и 5-хидроксил деривати на лансопразол са идентифицирани в плазмата. Тези метаболити нямат или имат съвсем слаба антисекреторна активност. При едно проучване, след еднократна доза с ^{14}C маркиран лансопразол, около една трета от приетото количество се екскретира в урината и две трети се откриват в изпражненията.

Фармакокинетика при пациенти в старческа възраст

Клирънсът на лансопразол е понижен при хора в напреднала възраст, където елиминационния полуживот е увеличен приблизително с 50% до 100%. Тъй като средният полуживот при възрастните остава между 1,9 до 2,9 часа, повтарящата се еднократна дневна доза не води до натрупване на лансопразол. Върховите плазмени концентрации не се увеличават при хората в напреднала възраст.

Фармакокинетика при педиатрични пациенти

Оценката на фармакокинетиката на лансопразол при деца на възраст от 1 до 17 години показва сходна експозиция в сравнение с възрастни при дози 15 mg веднъж дневно за тегло ≤ 30 kg и 30 mg лансопразол веднъж дневно с тегло > 30 kg. Проучването на доза от 17 mg/m² телесна повърхност или 1 mg/kg телесно тегло също е показало сравнима експозиция за лансопразол при деца на възраст от 2-3 месеца до 1 година и възрастни.

Висока експозиция на лансопразол в сравнение с възрастни е наблюдавана при новородени на възраст под 2-3 месеца при дози от 1,0 mg/kg и 0,5 mg/kg телесно тегло еднократно дневно.

Фармакокинетика при чернодробна недостатъчност

При пациенти с различна степен на хронично чернодробно увреждане, средният плазмен полуживот на лекарството се удължава от 1,5 часа на 3,2 - 7,2 часа. Наблюдавано е увеличение на средната AUC до 500% в състояние на равновесие при чернодробно увредени пациенти в сравнение със здрави доброволци. Необходимо е намаляване на дозата при пациенти с тежко чернодробно увреждане.

Фармакокинетика при бъбречна недостатъчност

При пациенти с тежка бъбречна недостатъчност свързването с плазмените белтъци се намалява с 1,0% - 1,5%.

CYP2C19 слаби метаболизатори

CYP2C19 е предмет на генетичен полиморфизъм и 2-6% от населението, наречени слаби метаболизатори (PMs), са хомозиготни за мутантния CYP2C19 алел и следователно липсва функционален CYP2C19 ензим. Експозицията на лансопразол е няколко пъти по-висока при PMs от тази при силните метаболизатори (EMs).

5.3 Предклинични данни за безопасност

Предклиничните данни не показват особен риск за хората на база на конвенционалните проучвания за безопасност, хронична токсичност, репродуктивна токсичност или генотоксичност.

В две проучвания за карценогенност на плъхове, лансопразол притежава дозо-зависима стомашна ECL клетъчна хиперплазия и ECL клетъчни карциноиди, свързани с хипергастринемия, в резултат на инхибирането на киселинната секреция. Чревна мегаплазия също се наблюдава, както и хиперплазия на Лайдиговите клетки и доброкачествени тумори на



Лайдиговите клетки. Наблюдавана е атрофия на ретината след 18 месеца лечение. Това не е наблюдавано при маймуни, кучета и мишки.

При проучвания за канцерогенност при мишки се наблюдава дозо-зависима стомашна ECL хиперплазия както и чернодробни тумори и аденом на тестисите.

Клиничната значимост на тези данни не е известна.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Капсулно съдържимо

захарни гранули, съдържащи захароза и царевично нишесте
манитол
натриев нишестен гликолат
магнезиев карбонат
повидон
захароза
полоксамер
хипромелоза
съполимер на метакрилова киселина-етилакрилат (1:1), 30 процентна дисперсия
талк
триетилов цитрат
симетикон

Състав на капсулата

Тяло

червен железен оксид (E 172)
титанов диоксид (E 171)
жълт железен оксид (E 172)
желатин

Капаче

патент синьо V (E 131)
титанов диоксид (E 171)
жълт железен оксид (E 172)
желатин

6.2 Несъвместимости

Неприложимо

6.3 Срок на годност

3 години

6.4 Специални условия на съхранение

Да се съхранява на място, недостъпно за деца.
Да се съхранява в оригиналната опаковка.
Да се съхранява под 30°C.
Да се пази от светлина и влага.

6.5 Данни за опаковката



PVC/TE/PVDC/Al блистери.

Един блистер съдържа 14 броя стомашно-устойчиви капсули.

Размери на опаковките: 14 или 28 броя стомашно-устойчиви капсули.

6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне

Няма специални изисквания.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

НОБЕЛ ФАРМА ЕООД

Околовръстен път 36

София 1415, България

8. НОМЕР НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

20040513

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

Дата на първо разрешаване: 05.11.2004

Дата на последно подновяване: 23.11.2010

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

11/2016

