

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1 - Търговско наименование на лекарствения продукт : LANSOPROL® 15 / ЛАНСОПРОЛ® 15

2 - Количествен и качествен състав:

наименование на съставките	количество лекарствено вещество в дозова единица
АКТИВНО ВЕЩЕСТВО	
Lansoprazole	15,000 mg

3 - Лекарствена форма: стомашно - устойчива капсула

4 - Клинични данни:

4.1. Терапевтични показания:

Показан при:

- Краткотрайна терапия и поддържащо лечение на вече излекувана язва на дванадесетопръстника
- Намаление на риска от възникване на язва на стомаха, свързана с употреба на нестероидни противовъзпалителни медикаменти
- Краткотрайно лечение на симптоматичен гастро-езофагеален рефлукс
- Поддържащо лечение при ерозивен езофагит

4.2. Дозировка и начин на употреба:

Язва на дванадесетопръстника

Краткотрайно лечение: Препоръчителната доза през устата за възрастни е 15 mg един път дневно за не повече от 4 седмици.

Поддържащо лечение на вече излекувана язва на дванадесетопръстника:

Препоръчителната доза през устата за възрастни е 15 mg един път дневно. Контролните проучвания не надхвърлят 12 месеца.

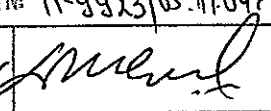
Намаление на риска от възникване на язва на стомаха, свързана с употреба на нестероидни противовъзпалителни медикаменти:

Препоръчителната доза през устата за възрастни е 15 mg един път дневно. Контролните проучвания не надхвърлят 12 седмици.

Краткотрайно лечение на симптоматичен гастро-езофагеален рефлукс:

Препоръчителната доза през устата за възрастни е 15 mg един път дневно. Контролните проучвания не надхвърлят 8 седмици.

Поддържащо лечение при ерозивен езофагит:

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО	
Приложение към разрешение за употреба № 11-9923/05.11.04г	
661/21-09-04	

ЧАСТ I / LANSOPROL®



Препоръчителната доза през устата е 15 mg един път дневно за 8 седмици. При пациенти, които не се повлияват за 8 седмици, допълнителното лечение още 8 месеца може да се окаже от полза. Контролните проучвания не надхвърлят 12 месеца.

Не е необходима промяна на дозата при пациенти с бъбречна недостатъчност или хора в напреднала възраст. Промяна на дозата се налага при пациенти с тежка чернодробна недостатъчност.

4.3. Противопоказания:

Lansoprol® 15 е противопоказан при пациенти с известна алергия към някои от съставките на продукта.

4.4 Специални противопоказания и специални предупреждения за употреба:

При започване на лечение с Lansoprazole, трябва да се изключи наличие на злокачествено заболяване.

Lansoprol® 15 се взема преди ядене.

Лекарствения препарат, съдържа захароза и не е подходящ при хора с вродена непоносимост към фруктозата, глюкозен/галактозен синдром на малабсорбция или захарозно/изомалтазен дефицит.

Приложение в педиатрията:

Безопасността и ефективността при пациенти под 18 г. не е проучена.

Приложение в гериатрията:

Степента на излекуване на язвата при пациенти в напреднала възраст не се различава от тази в младата група. Процентът на нежелани реакции и отклоненията в лабораторните тестове са същите като тези, които се наблюдават при по-младите болни. При пациентите в напреднала възраст дозата и приложението на Lansoprazole не се променят при съответна индикация.

4.5. Лекарствени и други взаимодействия:

Lansoprol® 15 се метаболизира чрез системата на цитохром P 450, по-специално чрез CYP3A и CYP2C19 изозимите. Проучванията показват, че Lansoprazole не влиза в клинично значимо взаимодействие с други лекарства, които се метаболизират чрез цитохром P 450 системата, като walfare, antipyrine, indomethacin, ibuprofen, phenitoin, propranolol, prednisone, diazepam, clarithrimycin или terfenadine при здрави индивиди. Тези съединения се метаболизират чрез различни изозими на цитохром P 450 включващи CYP1A2, CYP2C9, CYP2C19, CYP2D6 и CYP3A. Наблюдава слабо увеличаване на теофилиновия клирънс (10%) при съвместен прием на Lansoprazole с theophylline (CYP1A2, CYP3A). Поради малката степен и посока на действие на теофилиновия клирънс, това взаимодействие няма клинично значение. Въпреки всичко, някои пациенти се нуждаят от допълнителна преоценка на теофилиновата доза в началото или края на лечението с Lansoprazole за осъществяване на ефективни нива в кръвта.

Доказано е също, че Lansoprazole няма клинично значимо взаимодействие с amoxicillin. Lansoprazole причинява силно и дълготрайно подтискане на стомашно киселинната секреция; поради това теоретично е възможно, Lansoprazole да

ЧАСТ I / LANSOPROLOL



абсорбцията на медикаменти, при които стомашното рН е важна детерминанта на бионаличността (например ketoconazole, естери на ampicillin, железни соли, digoxin)

4.6. Бременност и кърмене:

Категорията му при бременност е Категория В. Приложението при бременност е противопоказано и би могло да се приложи само в много редки случаи когато се прецени, че ползата за майката е по голяма от риска за плода.

Установено е, че Lansoprazole или неговите метаболити се отделят в млякото. Тъй като много медикаменти се екскретират в човешкото мляко, поради потенциалния риск от сериозни нежелани реакции у кърмачетата, трябва да се вземе решение: или да се преустанови кърменето или да се спре медикамента, като се преценява значението на медикацията за майката.

4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини: Няма данни Lansoprazol[®] 15 да повлиява способността за шофиране и работа с машини.

4.8. Нежелани лекарствени реакции

Лечението с Lansoprazol[®] 15 се понася добре при кратки и дълготрайни проучвания.

Често наблюдавани, най-вероятно свързани с лечението нежелани реакции са: коремна болка, диария и гадене. Най-често срещания вероятно свързан с терапията страничен ефект е диарията.

Главоболието също се наблюдава при повече от 1% от случаите, но е по-често при плацебо.

Други нежелани реакции, които се срещат в по-малко от 1% от пациентите при домашни условия са дадени по-долу:

Общи: астения, кандидиоза, гръдна болка, оток, температура, грипоподобен синдром, лош дъх, инфекция, неразположение

Сърдечно-съдова система: стенокардия, мозъчно съдов инцидент, хипертония / хипотония, миокарден инфаркт, palpitations, шок / циркулаторна недостатъчност / вазодилатация

Храносмилателна система: безапетитие, кардиоспазъм, холелитиоза, запек, сухота в устата / жажда, диспепсия, дисфагия, уригване, езофагеална стеноза, езофагеална язва, езофагит, обезцветяване на фекалиите, flatulencia, стомашни тумори / полипи от фундусните стомашни жлези, гастроентерит, гастроинтестинално кръвотечение, хематемеза, повишен апетит, увеличено слюноотделяне, подуване на корема, ректално кръвотечение, стоматит, тенезми, улцериращ колит.

Ендокринна система: захарен диабет, гуша, хипергликемия / хипогликемия

Кръвна и лимфна система: анемия, хемолитиза

Метаболитни нарушения и нарушения на храненето: подагра, наддаване на тегло / отслабване

Двигателна система: артрит / артралгия, скелетно мускулна болка, миалгия

Нервна система: тревожност, амнезия, възбуда, апатия, обърканост, депресия, замаяване / синкоп, халюцинации, хемиплегия, враждебност, намаление на либидото, нервност, парестезия, нарушение на мисловния процес

Дихателна система: астма, бронхит, увеличение на кашлицата, диспнея, епистаксис, кръвохрак, хълцане, пневмония, инфекция / възпаление на горните дихателни пътища

Кожа и придатъци: акне, alopecia, сърбеж, обрив, уртикария

Сетива: замъглено виждане, глухота, болки в очите, отитис медиа, промяна във вкуса, бучене в ушите, нарушение в зрителното поле



Пикочо-полова система: нарушения в менструацията, албуминурия, увеличаване на бюста / гинекомастия, чувство на напрегнатост в гърдите, глюкозурия, хематурия, импотенция и камъни в бъбреците

Наблюдавани са други нежелателни явления откакто Lansoprazole е на пазара и тези ефекти са описани по-долу :

Общи: анафилактично подобни реакции

Храносмилателна система: хепатотоксичност, повръщане

Кръвна и лимфна система: агранулоцитоза, апластична анемия, хемолитична анемия, левкопения, неутропения, панцитопения, тромбоцитопения, тромботична-тромбоцитопенична пурпура

Сетива: нарушения в говора

Пикочо-полова система: ретенция на урината

Лабораторни промени:

Като странични явления на Lansoprazole са наблюдавани следните промени в лабораторните изследвания:

Нарушения във функционалните чернодробни показатели, увеличена СГОТ (ASAT), увеличена СГПТ (ALAT), увеличен креатинин, увеличена алкална фосфатаза, увеличени глобулини, увеличена гамаглутамил трансептидаза (GGTP), увеличена / намалена / бяла кръвна картина, промяна в съотношението албумин / глобулин, нарушения в червения кръвен ред, билирубинемия, еозинофилия, хиперлипемия, увеличени / намалени електролити, увеличен / намален холестерол, увеличени глюкокортикоиди, увеличена лактатдеhidрогеназа, увеличени / намалени / тромбоцити и увеличени нива на гастрин. Докладвани се и други незначителни лабораторни отклонения.

В плацебо контролирани изследвания при оценка на СГОТ (ASAT) и СГПТ (ALAT), 0.4% (1/250) плацебо пациенти и 0.3% (2/795) Lansoprazole пациенти са показали покачване на ензимите повече от 3 пъти горна граница на нормата при последното посещение. При никой от тези пациенти не се е появила жълтеница по време на изследването

4.9. Предозиране:

Lansoprazole няма антидот. Не се очиства с диализа. В случай на предозиране се започва симптоматично и поддържащо лечение.

Лекарството може да се елиминира чрез ранно предизвикано повръщане, тъй като е стомашно устойчиво. Освен това, на пациента може да се приложи активен въглен с назо-гастрална сонда, за да се осъществи почистването докато медикамента е разтворен, но все още не е в циркулацията.

Lansoprazole не се елиминира от циркулацията чрез хемодиализа. При един наблюдаван случай на предозиране, пациентът е приел 600 mg Lansoprazole без появата на странични реакции.

5 - Фармакологични данни:

5.1. Фармакодинамика:

Фармакодинамични данни:

Lansoprazole спада към клас антисекреторни съединения, заместители на бензимидазолите, които не притежават антихолинергично или хистамин H₂ рецепторно антагонистично действие, но подтискат стомашната киселинна секреция чрез специфично инхибиране на (H⁺, K⁺) – АТФ-аза ензимна система, разположена на

ЧАСТ I / LANSOPRAZOL



Lansoprazole спада към клас антисекреторни съединения, заместители на бензимидазолите, които не притежават антихолинергично или хистамин H-2 рецепторно антагонистично действие, но подтискат стомашната киселинна секреция чрез специфично инхибиране на (H⁺, K⁺) – АТФ-аза ензимна система, разположена на секреторната повърхност на стомашните париетални клетки. Тъй като тази ензимна система се счита за киселинна /протонна/ помпа на париеталната клетка, Lansoprazole се определя като инхибитор на стомашната киселинна помпа, и като такава тя блокира крайната стъпка в киселинната продукция. Този ефект е дозозависим и води до подтискане както на базалната така и на стимулираната стомашна киселинна секреция независимо от стимула. Серумните нива на гастрин са увеличени по време на терапия с Lansoprazole, но те се възвръщат до нормалните си граници 1 или 2 седмици след спиране на лечението. Lansoprazole няма антихолинергичен или H-2 рецепторен антагонистичен ефект.

След орален прием Lansoprazole предизвиква значително понижаване на базалната киселинна секреция и сигнификантно увеличава средното стомашно рН, през част от времето стомашното рН е > 3 и > 4. Също така, Lansoprazole значително намалява стимулираната с храна стомашна киселинна секреция и обем, както и пентагастрин-стимулираната киселинна секреция. При пациенти с хиперсекреция на киселина, Lansoprazole сигнификантно редуцира базалната и пентагастрин-стимулирана стомашна киселинна секреция. Lansoprazole подтиска нормалното увеличение на секретирания обем, киселинност и киселинна секреция, индуцирани от инсулин.

Подтискането на киселинността може да увеличи ефекта на антимикуробните агенти при унищожаването на *Helicobacter pylori*. Lansoprazole не повлиява значимо кръвния поток в лигавицата на стомашния фундус. Наблюдава се незначително намаление на кръвния поток в атриума, пилора и дуоденалната луковица, което се дължи на нормалната физиологична инхибиция на стомашната киселинна секреция.

Иn vitro и при клинични инфекции Lansoprazole е активен спрямо повечето щамове *Helicobacter pylori*.

5.2. Фармакокинетични данни:

Абсорбцията на Lansoprazole започва едва след като гранулите напуснат стомаха. Абсорбцията е бърза, със среден пик на плазмените нива на Lansoprazole след около 1.7 часа. Максималните плазмени концентрации на Lansoprazole (C_{max}) и площта под кривата (AUC) на плазмената концентрация са приблизително пропорционални при дози от 15 mg до 60 mg след еднократно приложение през устата. Lansoprazole не кумулира и фармакокинетиката му не се променя при многократни дози.

Lansoprazole се абсорбира бързо и сравнително напълно в стомашно чревния тракт. Абсолютната бионаличност е повече от 80%. Върхова плазмена концентрация се постига около 1.7 часа след приема през устата. При здрави индивиди времето на полуживот е 1.5 часа. И двете: максималната плазмена концентрация и площта под кривата се намаляват с около 50%, ако медикамента се приема 30 минути след нахранване, вместо преди това. Храненето не повлиява на кинетиката, ако медикамента се дава преди него.

Lansoprazole в 97% е свързан с плазмените белтъци. Свързването с протеините на плазмата е стабилно в концентрационни граници от 0.05 до 5.0 µg/ml.

Lansoprazole се метаболизира предимно в черния дроб. Идентифицирани са 2 метаболита в измерими количества в плазмата (хидроксилиран сулфинилов и сулфонов дериват на Lansoprazole). Тези метаболити нямат или имат съвсем слаба антисекреторна активност. Счита се, че Lansoprazole се трансформира в 2 активни разновидности, които инхибират киселинната секреция на (H⁺, K⁺) – АТФ-азата в каналчетата на париеталните клетки, но не са налични в системната циркулация.

ЧАСТ I / LANSOPRAZOLE стр. 5



След еднократен прием през устата на Lansoprazole фактически няма непроменен Lansoprazole, който се екскретира чрез урината. При едно проучване, след еднократна доза от 14 С Lansoprazole през устата, около една трета от приетото количество се екскретира в урината и две трети се възстановяват в изпражненията. Това предполага значителна билиарна екскреция на метаболитите на Lansoprazole .

Клирънсът на Lansoprazole е занижен при хора в напреднала възраст, където времето на полуживот е увеличено приблизително 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 акумулация на Lansoprazole. Върховите плазмени концентрации не се увеличават при хората в напреднала възраст.

Lansoprol е биоеквивалентен по отношение на AUC, но не е по отношение на C_{max}

Бъбречна недостатъчност

При пациенти с тежка бъбречна недостатъчност свързането с плазмените белтъци се намалява с 1.0% - 1.5%.

Чернодробна недостатъчност:

При пациенти с различна степен хронично чернодробно увреждане , средният плазмен полуживот на медикамента се удължава от 1.5 часа на 3.2-7.2 часа. Наблюдавано е увеличение на AUC (средна площ под кривата) до 500% в състояние на равновесие при чернодробно увредени пациенти в сравнение със здрави индивиди.

5.3. Предклинични данни за безопасност:

Предклиничните данни за безопасност не показват съществени рискове от употреба на Lansoprazole при хора.

6 - Фармацевтични данни:

6.1. Списък на помощните вещества:

Неутрални микрогранули, Маннитол, Експлолаб, Магнезиев карбонат, PVP K30, Захар, Полоксамер 407, Фармакоат, Еудрагит L30 D55, Talk, Цитрофлекс, Симетоконова емолсия, Етилов алкохол.

Оцветители: Титаниев диоксид, патентовано синьо V, червен железен оксид и жълт железен оксид

6.2 Физико – химична несъвместимост: няма

6.3 Срок на годност:

2 години

6.4 Специални условия за съхранение:

няма

6.5 Данни за опаковката:

AI / AI блистери

6.6. Препоръки за употреба:

Lansoprazole не трябва да се използва без лекарско предписание. Капсулите се поглъщат с малко течност без да се дъвчат.

ЧАСТ I / LANSOPROL 15 mg



Lansoprazole не трябва да се използва без лекарско предписание. Капсулите се поглъщат с малко течност без да се дъвчат.

7. Име и адрес на притежателя на разрешението за употреба:

NOBEL ILAC SANAYII ve TICARET A.S.

Barbaros Bulvan 76-78

34353 Besiktas, ISTANBUL, Turkey

Tel: +90 212 259 74 90 (10 линии)

Fax: +90 212 258 86 41

8. Номер на разрешение на употреба :

9. Дата на първата регистрация

10. Дата на последна редакция

