

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

ULCOPROL УЛКОПРОЛ

1. ТЪРГОВСКО ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ ULCOPROL

2. КОЛИЧЕСТВЕН И КАЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Лекарствено вещество в един флакон:

Omeprazole 40 mg (еквивалентен на omeprazole sodium 42.6 mg)

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Прах за инфузионен разтвор.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1. Показания

- Язва на дванадесетопръстника;
- Язва на стомаха;
- Симптоматичен рефлукс гастро-езофагит;
- Синдром на Zollinger-Ellison.

4.2. Дозировка и начин на употреба

Строго интравенозно, само по лекарско предписание!

Язва на стомаха и дванадесетопръстника или рефлукс езофагит:

Прилага се при пациенти, при които пероралното лечение е неподходящо или невъзможно, в доза 40 mg еднократно дневно. Продължителността на венозното приложение е 2-3 дни, след което се преминава на перорална терапия.

При пациенти със синдром на Zollinger-Ellison:

Препоръчителна начална доза – 60 mg еднократно дневно, като венозна инфузия. Възможно е да са необходими по-високи дози, като те се определят индивидуално. Когато необходимата дозата е по-голяма от 60 mg дневно, тя трябва да бъде разделена под формата на две венозни инфузии.

Бъбречна дисфункция:

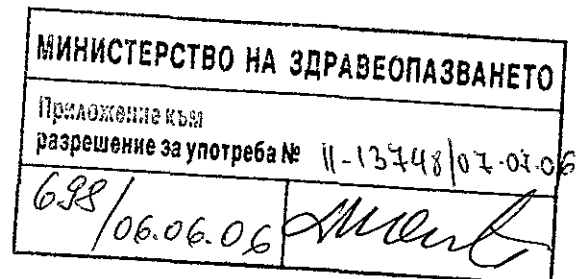
Не се налага корекция на дозата при пациенти с нарушена бъбречна функция.

Чернодробна дисфункция:

Тъй като чернодробният клирънс при такива пациенти е силно понижен, а плазменият полуживот на лекарственото вещество е увеличен се налага корекция на дозата, като обикновено дневна доза от 10 mg -20 mg е достатъчна.

Пациенти в напреднала възраст:

Не се налага корекция на дозата.



Деца:

Този продукт не се препоръчва за деца. При тях безопасността и ефективността не е доказана.

Начин на приложение:

Ulcorgol за инфузионно приложение трябва да се прилага бавно интравенозно (за период от 20-30 минути). Съдържанието на един флакон трябва да се разтвори със 100 ml физиологичен разтвор за инфузии или с 5%-ен глюкозен разтвор. Разтворът трябва да се използва в рамките на 6 часа.

4.3. Противопоказания

Свръхчувствителност към омепразол или към някое от помощните вещества на продукта.

4.4. Специални противопоказания и специални предупреждения за употреба

За да се избегне неподходящо лечение е необходимо съмненията за язвена болест да бъдат уточнени в ранен стадий, посредством рентгеново или ендоскопско изследване.

При наличие на стомашна язва или съмнение за такава, особено при наблюдаване на някои от следните симптоми – значителна загуба на тегло, периодично повръщане, дисфагия, хематемеза или мелена, трябва да се изключи злокачественост, тъй като терапията може да повлияе симптомите и да забави диагностицирането.

Поради понижаването на стомашната киселинност е възможно покачване на броя на нормално населяващата стомаха бактериална флора.

4.5. Лекарствени и други взаимодействия

Влияние на омепразол върху фармакокинетиката на други лекарствени продукти:

Поради намалената стомашна киселинност може да се промени абсорбцията на някои лекарствени продукти. Абсорбцията на кетоназол намалява при лечение с омепразол. Това води до неефективна плазмена концентрация на кетоназол. При едновременно приложение на омепразол и итраконазол плазмената концентрация и AUC на итраконазол се понижават с приблизително 65%, вероятно в резултат на намалена абсорбция, която зависи от стомашната киселинност.

Тъй като омепразол се метаболизира в черния дроб посредством цитохром P450 (CYP 2C19), той може да удължи елиминирането на диазепам, варфарин и фенитоин. Това изисква внимателно проследяване на пациентите лекувани с тези медикаменти и при нужда намаляване на дозите им.

При едновременно приложение на кларитромицин или еритромицин и омепразол, плазмените концентрации на омепразол се повишават. Те не се повлияват при съпътстващо лечение с амоксицилин или метронидазол.

Едновременното приложение на омепразол и дигоксин при здрави хора води до 10% увеличаване на бионаличността на дигоксин, резултат на повишеното стомашно рН.

Влияние на други лекарствени продукти върху фармакокинетиката на омепразол:

Лекарствени продукти, инхибитори на ензима СУРЗА (протеазни инхибитори, кетоконазол, итраконазол) могат да предизвикат увеличаване на плазмената концентрация на омепразол.

Не са установени взаимодействия между омепразол и антиациди, теофилин, кофеин, хинидин, лидокаин, пропранолол, метопролол или етанол.

4.6. Бременност и кърмене

Бременност:

Данните от предклинични и епидемиологични проучвания не са установили опасност при прилагане на омепразол по време на бременност и няма данни за токсичен или тератогенен ефект върху плода. Въпреки това този продукт трябва да се прилага по време на бременност само при необходимост и след внимателна преценка на съотношението полза/риск.

Кърмене:

Омепразол се отделя в кърмата. Въпреки, че не са установени нежелани ефекти върху новороденото при прилагане на терапевтични дози, не се препоръчва употребата на омепразол по време на кърмене или ако това е наложително, кърменето трябва да се преустанови.

4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Няма данни за повлияване на способността за шофиране и работа с машини.

4.8. Нежелани лекарствени реакции

Обикновено лечението с омепразол се понася добре.

Наблюдавани са следните нежелани реакции:

Чести (>1/100, <1/10):

- Гастроинтестинални - диария, гадене, повръщане, констипация; абноминални болки, флатуленция.
- ЦНС - главоболие.

Не чести (>1/1000, <1/100):

- Общи – умора.
- Чернодробни - повишаване на ALAT, ASAT, γ GTP, алкална фосфатаза, билирубин.
- Кожни – обрив, пруритус, уртикария.
- ЦНС – парестезии, вертиго, сънливост или нарушения на съня.

Редки (>1/10000, <1/1000):

- Общи – повишено потене, периферни отоци.
- Алергични кожни обриви, повишена температура (втрисания), анафилактичен шок.
- Гастроинтестинални – сухота в устата, промяна във вкуса, стоматит, кандидоза, панкреатит, хепатит, чернодробна недостатъчност и чернодробна енцефалопатия.
- Респираторни – бронхоспазъм.

- Метаболитни – хипонатриемия.
- Кардиоваскуларни – гръдна болка или ангина, тахикардия, брадикардия, палпитации, периферни отоци.
- Двигателна система - мускулни крампи, миалгия, слабост, ставни болки.
- Кожни – косопад, фоточувствителност, много рядко – генерализирани кожни реакции, вкл токсична епидермална некролиза, синдром на Stevens – Johnson, еритема мултиформе.
- Уро-генитални - интерстициален нефрит.
- Обратими хематологични реакции – левкопения, тромбоцитопения, агранулоцитоза, панцитопения.
- Психични нарушения - обърканост, депресия, халюцинации, апатия, агресивност, тревожност.
- Ендокринни – гинекомастия.
- Сетивни – неясно виждане.

4.9. Предозиране

При предозиране могат да се наблюдават следните симптоми: замъглено виждане, обърканост, сънливост, сухота в устата, главоболие, обща отпадналост, гадене, повръщане, диария, тахикардия.

При прояви на предозиране е необходимо незабавното спиране приложението на продукта. Поради липсата на специфичен антидот лечението е симптоматично и поддържащо.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ ДАННИ

5.1. Фармакодинамични свойства

АТС Код - A02B C 01

Omeprazole има бърз ефект, като предизвиква обратимо понижаване на киселинната секреция при еднократно дневно приложение. Omeprazole инхибира ензима H^+/K^+ -АТФ-аза, локализиран в апикалната мембрана на секреторните каналчета на париеталните клетки. По този начин блокира крайната фаза на базалната и стимулираната от храна, хистамин, пентагастрин и ацетилхолин секреция на солна киселина. Освободената в киселата среда на жлезния канал на париеталната клетка активна молекула на сулфенамид взаимодейства пряко с протонната помпа, която се намира в апикално разположената клетъчна мембрана. Чрез образуване на дисулфидни мостове между сулфенамида и ензима се инактивира функцията на протонната помпа.

Венозно приложението omeprazole осигурява дозозависимо потискане на стомашната киселинна секреция, като води до бързо намаляване на последната със средно понижаване от около 90% за 24 часа при пациенти с дуоденална язва. За незабавно постигане на подобно намаляване на стомашната киселинност, както при 20 mg многократно перорално приложение се препоръчва първа венозна доза от 40 mg.

5.2. Фармакокинетични свойства

Разпределение:

Обемът на разпределение на omeprazole при здрави хора е приблизително 0.3 L/kg, като подобни стойности са установени и при пациенти с бъбречна

недостатъчност. При пациенти в напреднала възраст и при такива с чернодробна недостатъчност обемът на разпределение е малко по-нисък. Свързването на omeprazole с плазмените протеини е около 95%.

Метаболизъм и екскреция:

Средният полуживот на крайната фаза на кривата плазмена концентрация/време след венозно приложение на omeprazole е приблизително 40 min, а общият плазмен клирънс е 0.3 до 0.6 L/min. Не се наблюдава промяна в полуживота по време на лечението.

Omeprazole се метаболизира напълно от системата цитохром P450 (CYP), главно в черния дроб. Главната част на метаболизма му зависи от полиморфния специфичен изоензим CYP 2C19 (S-mephenytoin hydroxylase), отговорен за образуването на hydroxymeprazole, основният метаболит в плазмата. Нито един от метаболитите не повлиява върху стомашната киселинна секреция.

Почти 80% от венозно приложеният omeprazole се екскретира като метаболити в урината, а останалата част се открива в изпражненията, като произхожда основно от жлъчната секреция.

Елиминирането на omeprazole не се променя при пациенти с увредена бъбречна функция. Елиминационният полуживот е удължен при пациенти с нарушена чернодробна функция, но omeprazole не показва тенденция за кумулиране при орално еднократно дневно дозиране.

5.3. Предклинични данни за безопасност

5.3.1. Остра токсичност

LD₅₀ при венозно приложение: мишки 0.08 g/kg; плъхове >0.05 g/kg.

LD₅₀ при орално приложение: мишки >4.0 g/kg; плъхове >4.0 g/kg.

5.3.2. Подостра и хронична токсичност

При изпитване на подостра и хронична токсичност при кучета хистопатологично се наблюдава реверзибилна атрофия на стомашните епителни мукозни клетки и слаба, но значима хиперплазия на аргирофилните ендокринни клетки /ECL/.

Опитите за подостра и хронична токсичност у плъхове при перорално и интравенозно приложение за 3, 6 и 24 месеца показват, че не се предизвиква смъртност. При животните, третирани с най-високата доза се наблюдава намаление на концентрацията на глюкозата в кръвта, слабо намаление на теглото, слабо намаление на броя на червените кръвни клетки и хемоглобиновата концентрация и увеличение на теглото на бъбреците и черния дроб. В стомаха, само при най-високите дози, се намира хипертрофия на стомашната мукоза с увеличение на гънките, увеличение на жлезите и мукозната секреция. При токсичните дози се наблюдават поведенчески промени, като седация, птоза, конвулсии, намалена двигателна активност, повишена телесна температура, повишена дихателна честота, задълбочаване на дишането.

5.3.3. Канцерогенност, тератогенност, мутагенност и нарушение във фертилитета

При проучвания за канцерогенност при плъхове, omeprazole в дневни дози от 1.7; 3.4; 13.8; 44.0 и 140.8 mg/kg/дневно (около 0.5 до 28.5 пъти над човешката доза от 40 mg/дневно, на база телесна повърхност) предизвиква дозозависима поява на стомашни ECL клетъчни карциноми, както при плъховете от мъжки пол, така и при тези от женски пол. Тези промени са резултат на продължителната хипергастринемия, вторично появила се в резултат на киселинната инхибиция, а не от директното действие на лекарствения продукт. У кучета след едногодишно третиране с висока доза omeprazole се наблюдава слабо увеличение на ECL клетки. По теста на Ames, микронуклеарния тест у мишки и миши лимфобен тест, omeprazole няма мутагенен потенциал. Omeprazole, прилаган перорално в дози до 138.0 mg/kg/дневно (около 28 пъти надвишаващи човешката доза от 40 mg/дневно, на база телесна повърхност) не показва никакво въздействие върху фертилитета и репродуктивността.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1. Списък на помощните вещества

Disodium edetate
Sodium hydroxide

6.2. Физико-химични несъвместимости

Не са известни.

6.3. Срок на годност

2 (две) години от датата на производство.

Да не се използва след изтичане срока на годност, указан на опаковката.

6.4. Специални условия на съхранение

Флаконите Ulcorol 40 mg прах за инфузионен разтвор, трябва да се съхраняват на защитено от светлина място (в картонена кутия), при температура под 30°C. Готовият разтвор трябва да се използва в рамките на 6 часа.

Да се съхранява на място, недостъпно за деца!

6.5. Данни за опаковката

15 ml флакони от безцветно силикатно стъкло с хлорбутилова запушалка и капачка от две части - алуминиева обкатка и пластмасово капаче.

По 5 флакона в картонена кутия.

6.6. Препоръки при употреба

Ulcorol прах за инфузионен разтвор се прилага като венозна инфузия (за период от 20-30 минути или повече). Съдържанието на един флакон трябва да се разтвори със 100 ml физиологичен разтвор за инфузии или с 5%-ен глюкозен разтвор. Препоръчително е приложението на така приготвеният разтвор да започне веднага, като той трябва да бъде използван в рамките на 6 часа.

За приготвянето на разтвора е необходимо първо да бъде добавено към съдържанието на флакона достатъчно количество физиологичен разтвор или

5% глюкоза за да се разтвори напълно сухото вещество, след което така приготвеният разтвор трябва да се прехвърли в инфузионната система.

7. ИМЕ И АДРЕС НА ПРИТЕЖАТЕЛЯ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

"Актавис" ЕАД
бул. "Княгиня Мария Луиза" № 2
София, България

8. РЕГИСТРАЦИОНЕН НОМЕР В РЕГИСТЪРА ПО ЧЛ. 28 ОТ ЗЛАХМ

9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ ЗА УПОТРЕБА НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗАЦИЯ НА ТЕКСТА
Май 2006 г.

