Омепразол



Код АТХ:

- A02BC01

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Омепразол

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Капсулы желатиновые, с белым корпусом и желтой крышкой; 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.

Фармакотерапевтическая группа:

- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Омепразол - противоязвенный препарат, ингибитор фермента H^+/K^+-аденозинтрифосфат (АТФ)-фазы. Тормозит активность H^+/K^+ - аденозинтрифосфат (АТФ-фазы (H^+/K^+-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 H^+/K^+- 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 pH=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. TC_{max} - 0.5-3.5 часа.

Обладая высокой липофильностью, легко проникает в париетальные клетки желудка. Связь с белками плазмы - 90-95% (альбумин и кислый альфа$_1$-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 к применению:

— 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.

Относится к болезням:

- Гастрит
- Мастит
- Рефлюкс-эзофагит
- Эзофагит
- Язвенная болезнь
- Язвенная болезнь желудка

Противопоказания:

— детский возраст;

— беременность;

— период лактации;

— гиперчувствительность.

С *осторожностью*: почечная и/или печеночная недостаточность.

Способ применения и дозы:

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, панцитопепия.

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 гландулярных кист во время длительного лечения (следствие ингибирования секреции соляной кислоты, носит доброкачественный, обратимый характер).

Передозировка:

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

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

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан во время беременности и в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

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

Являясь ингибиторов цитохрома P450, может повышать концентрацию и снижать выведение диазепама, антикоагулянтов непрямого действия, фенитоина (лекарственные средства, которые метаболизируются в печени посредством цитохрома CYP2C19), 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.

Особые указания и меры предосторожности:

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.

При нарушениях функции почек

С осторожностью: почечная недостаточность. При **нарушении функции почек** коррекции режима дозирования не требуется.

При нарушениях функции печени

С осторожностью: печеночная недостаточность. При **печеночной недостаточности** назначают по 10-20 мг 1 раз в сутки (при тяжелой печеночной недостаточности суточная доза не должна превышать 20 мг);

Применение в пожилом возрасте

у **пожилых пациентов** коррекции режима дозирования не требуется.

Применение в детском возрасте

Противопоказан детям.

Условия хранения:

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 в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Omeprazol