Омез ДСР



Код АТХ:

- A02BX

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Домперидон
- Омепразол

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Капсулы с модифицированным высвобождением, 30 мг + 20 мг.

По 10 капс. в блистере из ПВХ/алюминиевой/полиамидной фольги/алюминиевой фольги. По 1, 3, 8, 10 бл. в пачке картонной.

Состав:

Капсулы с модифицированным высвобождением	1 капс.
активные вещества:	
домперидон	30 мг
(в составе гранул с пролонгированным высвобождением 100 мг)*	
омепразол	20 мг
(в составе гранул с кишечнорастворимым покрытием 267 мг)**	
вспомогательные вещества: тальк — 2 мг	
капсула желатиновая твердая №1: желатин — 85,42%; вода — 14,5%; натрия лаурилсульфат — 0,08%	
чернила черные для нанесения надписи на крышечке капсулы: этанол — 29–33%; изопропанол — 9–12%;	

бутанол — 4–7%; шеллак — 24–28%; краситель железа оксид черный (E172) — 24–28%; аммиак водный — 1–3%; пропиленгликоль — 0,5–2%	
чернила красные для нанесения надписи на корпусе капсулы: этанол — 21–25%; изопропанол — 12–16%; бутанол — 7–10%; шеллак — 22–27%; краситель пунцовый (Понсо 4R) (E124) — 18–24%; титана диоксид (E171) — 5–9%; аммиак водный — 1–3%; полисорбат 80 — 0,5–2%; пропиленгликоль — 0,5–2%	
*Гранулы домперидона с прогонгированным высвобождением	100 мг
активное вещество:	
домперидон	30 мг
вспомогательные вещества: сахарная крупка нонпарель — 58,98 мг; кремния диоксид коллоидный — 0,48 мг; тальк — 4,51 мг; гипромеллоза 5 cps — 0,57 мг	
покрытие: гипромеллоза 5 cps — 2,34 мг; тальк — 0,71 мг; краситель железа оксид желтый — 0,12 мг; краситель железа оксид красный — 0,04 мг; титана диоксид — 0,47 мг	
покрытие пролонгированного высвобождения: гипромеллоза 5 cps — 0,40 мг; этилцеллюлоза 10 cps — 1,18 мг; триацетин — 0,12 мг; тальк — 0,086 мг	
**Гранулы омепразола с кишечнорастворимым покрытием	267 мг
активное вещество:	
омепразол	20 мг
вспомогательные вещества: маннитол — 137,86 мг; лактозы моногидрат — 9,66 мг; натрия лаурилсульфат — 0,52 мг; натрия гидрофосфат — 0,89 мг; сахароза (25/30) — 24,35 мг; сахароза — 8,54 мг; гипромеллоза 6 cps — 0,14 мг	
покрытие: гипромеллоза 6 cps — 13 мг	
покрытие кишечнорастворимое: метакриловой кислоты и этилакрилата сополимер (1:1) (метакриловой кислоты сополимер (тип C) — 40,47 мг; натрия гидроксид — 0,54 мг; макрогол 6000 — 4,85 мг; тальк — 4,05 мг; титана диоксид — 2,13 мг	

Описание:

Твердые желатиновые прозрачные бесцветные капсулы №1 с маркировкой черного цвета G на крышечке капсулы и маркировкой красного цвета «OMEZ-DSR» на корпусе капсулы.

Содержимое капсул — гранулы от белого до серовато-белого и от коричневого до желтовато-коричневого цвета.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Комбинация двух действующих веществ (домперидон и омепразол) оказывает комплексное действие на основные звенья патогенеза ГЭРБ, диспепсические нарушения различного генеза. Домперидон усиливает и синхронизирует физиологические перистальтические волны, омепразол снижает базальную и стимулированную секрецию соляной кислоты.

Домперидон

Антагонист дофамина, сочетает периферическое (гастрокинетическое) действие и антагонизм к рецепторам дофамина в триггерной зоне головного мозга (центральное действие), благодаря чему обладает противорвотным действием, стимулирует выделение пролактина из гипофиза и устраняет ингибирующее влияние дофамина на моторную функцию ЖКТ, усиливает и синхронизирует перистальтические волны, тем самым ускоряет естественное опорожнение желудка и повышает давление сфинктера нижнего отдела пищевода.

Омепразол

Механизм действия. Омепразол концентрируется в кислой среде секреторных канальцев париетальных клеток слизистой оболочки желудка, активируется и ингибирует протонный насос — фермент H^+/K^+-АТФ-азу, что обеспечивает дозозависимое высокоэффективное ингибирование базальной и стимулированной секреции соляной кислоты независимо от стимулирующего фактора.

Влияние на кислотность желудка. Максимальный эффект достигается в течение 4 дней лечения. У пациентов с язвой двенадцатиперстной кишки омепразол в дозе 20 мг вызывает устойчивое снижение 24-часовой желудочной кислотности не менее чем на 80%. При этом достигается снижение средней C_{max} соляной кислоты после стимуляции пентагастрином на 70% в течение 24 ч. У пациентов с язвой двенадцатиперстной кишки омепразол в дозе 20 мг при ежедневном пероральном применении поддерживает во внутрижелудочной среде значение кислотности на уровне pH≥3 в среднем в течение 17 ч/сут. Ингибирование секреции соляной кислоты зависит от AUC омепразола, а не от концентрации препарата в плазме в данный момент времени.

Действие на Helicobacter pylori. Эрадикация *Helicobacter pylori* при применении омепразола совместно с антибактериальными средствами сопровождается быстрым устранением симптомов, высокой степенью заживления дефектов слизистой оболочки ЖКТ и длительной ремиссией язвенной болезни, что снижает вероятность таких осложнений как кровотечения так же эффективно, как и постоянная поддерживающая терапия.

Другие эффекты. Снижение секреции соляной кислоты в желудке приводит к незначительному увеличению риска развития кишечных инфекций, вызванных *Salmonella spp., Campylobacter spp.* и *Clostridium difficile*. Во время лечения препаратами, понижающими секрецию желез желудка, концентрация гастрина в сыворотке крови повышается. Вследствие снижения секреции соляной кислоты повышается концентрация хромогранина А (CgA) (см. «Особые указания»).

Фармакокинетика

Омепразол

Абсорбция омепразола высокая, время достижения C_{max} в плазме крови составляет 0.5-1 ч. Биодоступность - 30-40%, после постоянного применения 1 раз/сут возрастает до 60%. Связывание с белками плазмы - 90-95%. V_d - 0.3 л/кг. Часть омепразола подвергается пресистемному печеночному метаболизму с участием в большей степени CYP2C19, чем CYP3A4 с образованием неактивных метаболитов. Омепразол, не включенный париетальными клетками в процесс образования активных метаболитов, полностью метаболизируется в печени. Общий плазменный клиренс составляет 0.3-0.6 л/мин. $T_{1/2}$ омепразола составляет около 40 мин. Выводится почками (70-80%) и с желчью (20-30%).

При нарушении функции печени увеличивается биодоступность и уменьшается плазменный клиренс омепразола. При нарушении функции почек или у пожилых пациентов не отмечено изменений биодоступности омепразола.

Домперидон

Абсорбция натощак быстрая. Время достижения C_{max} - 30-60 мин. Низкая биодоступность (15%) связана с эффектом "первого прохождения" в кишечной стенке и печени. Связывание с белками плазмы - 90%. Проникает в различные ткани, плохо проходит через ГЭБ. Метаболизируется в печени (в т.ч. за счет эффекта "первого прохождения") и в стенке кишечника (путем гидроксилирования и N-дезалкилирования) с участием изоферментов CYP3A4, CYP1A2 и CYP2E1. Выводится через кишечник - 66% (в неизмененном виде - 10%), почками - 33% (в неизмененном виде 1%) в виде глюкуронидов.

При выраженной хронической почечной недостаточности $T_{1/2}$ удлиняется.

Показания к применению:

Диспепсия, сопровождающаяся замедленным опорожнением желудка, желудочно-пищеводным рефлюксом, эзофагитом (чувство переполнения в эпигастрии, ощущение вздутия живота, боль в верхней части живота; отрыжка, метеоризм; тошнота, рвота; изжога с забросом или без заброса желудочного содержимого в полость рта); гастроэзофагеальная рефлюксная болезнь; тошнота, рвота, изжога, связанные с гастроэзофагеальной рефлюксной болезнью, гастритом, язвенной болезнью желудка и двенадцатиперстной кишки, в т.ч. после проведения эрадикационной терапии.

Относится к болезням:

- Вздутие живота
- Гастрит
- Изжога
- Метеоризм
- Отрыжка
- Рвота
- Тошнота
- Эзофагит
- Язвенная болезнь

Противопоказания:

Желудочно-кишечное кровотечение, механическая непроходимость или перфорация, т.е. когда стимуляция моторики ЖКТ может быть опасной; печеночная недостаточность средней и тяжелой степени тяжести; пролактинсекретирующая опухоль гипофиза (пролактинома); одновременный прием эрлотиниба, позаконазола, нелфинавира, атазанавира, пероральных форм кетоконазола, эритромицина или других ингибиторов CYP3A4, вызывающих удлинение интервала QT, таких как флуконазол, вориконазол, кларитромицин, амиодарон и телитромицин; беременность, период лактации; возраст до 18 лет; непереносимость лактозы, дефицит лактазы, глюкозо-галактозная мальабсорбция; дефицит сахаразы/изомальтазы, непереносимость фруктозы; повышенная чувствительность к компонентам препарата и бензимидазолам.

С осторожностью: наличие язвы желудка (или подозрение на язву желудка), предшествующее хирургическое вмешательство на органах ЖКТ; наличие "тревожных" симптомов (значительное спонтанное снижение массы тела, повторная рвота, рвота с примесью крови, изменение цвета кала (мелена), нарушение глотания); появление новых симптомов или изменении уже имеющихся симптомов со стороны ЖКТ; наличие выраженных электролитных нарушений или заболеваний сердца, таких как сердечная недостаточность; остеопороз; почечная недостаточность.

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь, натощак, за 20-30 мин до еды, запивая небольшим количеством воды.

Рекомендуемая доза - по 1 капс. 1 раз/сут. Максимальная суточная доза - 1 капс., что соответствует 20 мг омепразола и 30 мг домперидона.

При **легких нарушениях функции печени** коррекции режима дозирования не требуется.

При **нарушениях функции почек** коррекция разовой дозы не требуется.

Коррекция режима дозирования у **пациентов пожилого возраста** не требуется.

Побочное действие:

Частота возникновения побочных эффектов определяется следующим образом: очень часто (≥1/10); часто (≥1/100, <1/10); нечасто (≥1/1000, <1/100); редко (≥1/10 000, <1/1000); очень редко (<1/10 000, в т.ч. единичные случаи и частота неизвестна).

Омепразол

Со стороны системы кроветворения: редко - лейкопения, тромбоцитопения; очень редко - агранулоцитоз, панцитопения, эозинофилия.

Аллергические реакции: нечасто - крапивница; редко - реакции гиперчувствительности (лихорадка, ангионевротический отек, анафилактическая реакция/анафилактический шок.

Со стороны обмена веществ: редко - гипонатриемия; частота неизвестна - гипомагниемия, которая в тяжелых случаях может привести к гипокальциемии, гипокалиемии.

Нарушения психики: нечасто - бессонница; редко - повышенная возбудимость, депрессия, обратимая спутанность сознания; очень редко - агрессия, галлюцинации.

Со стороны нервной системы: часто - головная боль; нечасто - головокружение, парестезии, сонливость; редко - нарушение вкуса.

Со стороны органа зрения: нечасто - зрительные нарушения, в т.ч. уменьшение полей зрения, снижение остроты и четкости зрительного восприятия (обычно проходят после прекращения терапии).

Со стороны органа слуха и равновесия: нечасто - нарушения слухового восприятия, в т.ч. звон в ушах (обычно проходят после прекращения терапии), вертиго.

Со стороны дыхательной системы: редко - бронхоспазм.

Со стороны пищеварительной системы: часто - абдоминальная боль, запор, диарея, метеоризм, тошнота, рвота; нечасто - повышение активности печеночных ферментов и ЩФ (обратимого характера); редко - сухость во рту, стоматит, гастроинтестинальный кандидоз, микроскопический колит, изменение цвета языка до коричнево-черного и появление доброкачественных кист слюнных желез при одновременном использовании с кларитромицином (явления носят обратимый характер после прекращения терапии), гепатит (с желтухой или без), печеночная недостаточность, энцефалопатия у пациентов с предшествующими тяжелыми заболеваниями печени; единичные случаи - образование желудочных гландулярных кист во время длительного лечения при одновременном использовании с кларитромицином (следствие ингибирования секреции соляной кислоты, носит доброкачественный, обратимый характер).

Со стороны кожи и подкожной клетчатки: нечасто - дерматит, кожный зуд, кожная сыпь; редко - алопеция, реакции фоточувствительности в виде покраснения кожи после УФО, многоформная экссудативная эритема, токсический эпидермальный некролиз, синдром Стивенса-Джонсона (тяжелая эритема, характеризующаяся появлением пятен и пузырей на коже и слизистых оболочках на фоне высокой температуры и боли в суставах).

Со стороны костно-мышечной системы: нечасто - переломы позвонков, костей запястья, головки бедренной кости, связанные с остеопорозом; редко - артралгия, миалгия, мышечная слабость.

Со стороны мочевыделительной системы: редко - интерстициальный нефрит.

Со стороны половых органов и молочной железы: редко - гинекомастия.

Прочие: нечасто - недомогание; редко - повышенное потоотделение, периферические отеки.

Домперидон

Аллергические реакции: очень редко - анафилактическая реакция/анафилактический шок, ангионевротический отек, отек Квинке, крапивница.

Нарушения психики: очень редко - ажитация, нервозность, повышенная возбудимость и раздражительность.

Со стороны нервной системы: очень редко - экстрапирамидные явления, судороги, сонливость, головная боль.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: очень редко - удлинение интервала QT, желудочковая тахикардия по типу "пируэт", внезапная коронарная смерть (более вероятно для пациентов старше 60 лет, принимающих более 30 мг/сут).

Со стороны мочевыделительной системы: очень редко - задержка мочи.

Со стороны лабораторных и инструментальных данных: очень редко - изменения показателей функциональных проб печени, повышение уровня пролактина крови.

Передозировка:

Симптомы: головокружение, спутанность сознания, апатия, сонливость, головная боль, нарушение зрения, дилатация сосудов, тахикардия, тошнота, рвота, метеоризм, диарея, повышение потоотделения, сухость во рту. При увеличении дозы скорость элиминации препарата не изменялась.

Лечение: назначение активированного угля внутрь, промывание желудка; при необходимости — симптоматическая терапия и тщательное наблюдение. Антихолинергические средства, препараты, применяемые для лечения паркинсонизма, или антигистаминные препараты могут быть эффективными при возникновении экстрапирамидных реакций. Гемодиализ недостаточно эффективен.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение препарата при беременности и в период грудного вскармливания противопоказано.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Омепразол

Подобно другим препаратам, снижающим кислотность желудочного сока, лечение омепразолом может привести к снижению всасывания *кетоконазола, итраконазола, позаконазола, эрлотиниба, препаратов железа и цианокобаламина*. Следует избегать их совместного приема с комбинированным препаратом.

Биодоступность *дигоксина* при одновременном применении с омепразолом повышается на 10%. Следует соблюдать осторожность при одновременном применении дигоксина и комбинированного препарата у пожилых пациентов.

По результатам исследований отмечено взаимодействие между *клопидогрелом* (нагрузочная доза 300 мг, поддерживающая доза 75 мг/сут) и омепразолом (80 мг/сут, внутрь), которое снижает экспозицию активного метаболита клопидогрела и уменьшает ингибирование агрегации тромбоцитов. Поэтому следует избегать одновременного применения клопидогрела и омепразола в дозе 80 мг/сут.

Увеличение значения pH на фоне терапии омепразолом может влиять на всасывание *антиретровирусных препаратов*. Также возможно взаимодействие на уровне изофермента CYP2C19. В связи с этим совместное применение препарата с антиретровирусными препаратами, такими как *атазанавир и нелфинавир*, противопоказано. При одновременном применении с омепразолом отмечается повышение плазменной концентрации *саквинавира/ритонавира* до 70%, при этом переносимость лечения пациентами с ВИЧ-инфекцией не ухудшается.

При одновременном применении омепразола и *такролимуса* было отмечено повышение концентрации такролимуса в сыворотке крови. Необходимо контролировать КК и концентрацию такролимуса в плазме крови при его совместном применении с комбинированным препаратом.

Ингибиторы протоновой помпы могут незначительно повышать концентрацию *метотрексата* в плазме крови. При лечении высокими дозами метотрексата следует временно прекратить прием комбинированного препарата.

При одновременном применении с омепразолом возможно повышение плазменной концентрации и увеличение $T_{1/2}$ *варфарина (R-варфарина), диазепама, фенитоина, цилостазола, имипрамина, кломипрамина, циталопрама, гексобарбитала, дисульфирама,* а также других препаратов, метаболизирующихся в печени с участием изофермента CYP2C19 (может потребоваться снижение доз этих препаратов). Однако прием омепразола в дозе 20 мг/сут не влияет на концентрацию фенитоина в плазме крови у пациентов, длительно принимающих фенитоин. При применении омепразола пациентами, получающими варфарин или другие антагонисты витамина K, необходим мониторинг МНО. В то же время сопутствующее лечение омепразолом в суточной дозе 20 мг не приводит к изменению времени коагуляции у пациентов, длительно принимающих варфарин.

Одновременное применение с *ингибиторами CYP2C19 и/или CYP3A4* замедляет метаболизм омепразола. При совместном приеме омепразола с *кларитромицином или эритромицином* концентрация омепразола в плазме крови повышается. Совместное применение *вориконазола* и омепразола приводит к увеличению площади под фармакокинетической кривой омепразола.

Индукторы CYP2C19 и CYP3A4, такие как рифампицин, препараты зверобоя продырявленного (Hypericum perforatum), при совместном применении с омепразолом могут приводить к снижению концентрации омепразола в плазме крови за счет ускорения метаболизма омепразола.

Совместный прием омепразола с *амоксициллином или метронидазолом* не влияет на концентрацию омепразола в плазме крови.

Не установлено клинически значимого взаимодействия омепразола с *метопрололом, фенацетином, эстрадиолом, будесонидом, диклофенаком, напроксеном, пироксикамом, S-варфарином*.

Не выявлено влияния омепразола на *антацидные средства, теофиллин, кофеин, хинидин, лидокаин, пропранолол, этанол*.

Домперидон

Циметидин и бикарбонат натрия снижают пероральную доступность домперидона.

Совместный прием домперидона и *дигоксина* не изменяет концентрацию последнего.

Подавляющее влияние *ингибиторов протеазы ВИЧ* на изофермент CYP3A4 может вызывать повышение концентрации домперидона при их совместном назначении с комбинированным препаратом.

При совместном приеме домперидона с *кларитромицином или эритромицином* концентрация домперидона в плазме крови повышается.

Флуконазол, итраконазол, кетоконазол и вориконазол повышают концентрацию домперидона в плазме.

Клинический опыт и исследования in vitro показывают, что возможно повышение концентрации домперидона в плазме при совместном применении таких *сильных ингибиторов CYP3A4, как антагонисты кальция (дилтиазем и верапамил), нефадозон и амиодарон*. Кроме того, при приеме *амиодарона*, либо при совместном приеме домперидона с *кетоконазолом, эритромицином* может удлиняться интервал QT.

Антихолинергические препараты могут нейтрализовать действие домперидона.

Применение домперидона на фоне приема *парацетамола или дигоксина* не влияло на уровень этих препаратов в крови.

Домперидон совместим с приемом *антипсихотических лекарственных средств (нейролептиков), агонистами допаминергических рецепторов (бромокриптин, L-допа),* т.к. угнетает их нежелательные периферические эффекты

(тошнота и рвота) и не влияет на их центральные эффекты.

Особые указания и меры предосторожности:

Препарат содержат лактозу, поэтому не стоит применять его у пациентов с непереносимостью лактозы, галактоземией и нарушением всасывания глюкозы и галактозы.

Было показано, что применение домперидона может быть связано с повышением риска желудочковых аритмий или внезапной коронарной смерти, что более вероятно для пациентов старше 60 лет при суточной дозе домперидона более 30 мг. Применение домперидона и прочих препаратов, приводящих к удлинению интервала QT, требует осторожности у пациентов с имеющимися нарушениями проводимости при удлинении QT, выраженном нарушении электролитного баланса или застойной сердечной недостаточности).

Пациенты с риском развития остеопороза или переломов на его фоне должны находиться под соответствующим клиническим наблюдением, хотя причинно-следственная связь применения омепразола с переломами на фоне остеопороза не установлена.

Имеются сообщения о возникновении выраженной гипомагниемии у пациентов, получающих терапию ингибиторами протонового насоса, в т.ч. омепразолом, свыше одного года. Пациентам, получающим терапию омепразолом в течение длительного времени, особенно в сочетании с дигоксином или другими препаратами, снижающими содержание магния в плазме крови (диуретиками), требуется регулярный контроль содержания магния.

Повышение концентрации хромогранина А (CgA) вследствие снижения секреции соляной кислоты может оказывать влияние на результаты обследований для выявления нейроэндокринных опухолей. Для предотвращения данного влияния терапию ингибиторами протонового насоса необходимо приостановить за 5 дней до проведения исследования концентрации CgA.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения препаратом следует соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и выполнении других потенциально опасных видов деятельности, требующих повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

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