

**Инструкция по применению лекарственного препарата**  
**(информация для специалистов)**  
**Лосек**

**Регистрационный номер:**

**Торговое название: Лосек (Losec)**

**Международное непатентованное название: омепразол**

**Химическое название: 5-метокси-2-[[[(4-метокси-3,5-диметил-2-перидинил) метил]сульфинил]-1Н-бензоимидазол натрия**

**Лекарственная форма: лиофилизат для приготовления раствора для инфузий**

**Состав**

*Активный ингредиент:* омепразол натрия 42.6 мг, эквивалентно 40 мг омепразола.

*Вспомогательные ингредиенты:* динатриевая соль этилендиамина тетрауксусной кислоты (ЭДТА) 1.5 мг, натрия гидроксид 0.1-1.2 мг для доведения рН, азот, вода для инъекций до 2.0 мл

**Описание**

Лиофилизат белого или белого с оттенком цвета, в виде спрессованной массы или порошка во флаконах по 10 мл.

**Фармакотерапевтическая группа** протонного насоса ингибитор

**АТХ код:** A02BC01

**Фармакологические свойства**

**Фармакодинамика**

Омепразол является рацемической смесью двух энантиомеров, снижает секрецию кислоты за счет специфического ингибирования кислотной помпы париетальных клеток. При однократном назначении препарат быстро действует и оказывает обратимое угнетение секреции кислоты.

*Механизм действия*

Омепразол является слабым основанием, концентрируется и конвертируется в активную форму в кислой среде канальцев клеток пристеночного слоя слизистой оболочки желудка, где активируется и ингибирует  $H^+,K^+$  -АТФазы-кислотной помпы. Препарат оказывает дозозависимое действие на последний этап синтеза кислоты, угнетает как базальную, так и стимулированную секрецию независимо от стимулирующего фактора.

*Влияние на желудочную секрецию*

Внутривенное введение омепразола оказывает дозозависимое угнетение секреции соляной кислоты у людей. Для того чтобы достичь быстрого снижения внутрижелудочной кислотности, рекомендуется внутривенное введение 40 мг омепразола, после которого происходит быстрое снижение внутрижелудочной секреции, которое поддерживается в течение 24 часов.

Степень угнетения секреции кислоты пропорциональна площади под кривой (концентрация-время АUC) омепразола и не пропорциональна действительной концентрации препарата в крови в данный момент времени.

Во время лечения омепразолом тахифилаксия не отмечалась.

Снижение секреции кислоты в желудке под действием ингибиторов протонного насоса или других кислото-ингибирующих агентов приводит к повышению роста нормальной микрофлоры кишечника, что в свою очередь может приводить к небольшому увеличению риска развития кишечных инфекций, вызванных такими бактериями как *Salmonella* и *Campylobacter*.

## **Фармакокинетика**

### *Распределение*

Объем распределения у здоровых субъектов составляет 0.3 л/кг, сходный показатель определяется у пациентов с почечной недостаточностью. У пациентов пожилого возраста и у больных с печеночной недостаточностью объем распределения несколько снижен. Показатель связываемости омепразола с белками плазмы составляет около 95%.

### *Метаболизм и экскреция*

После внутривенного введения средний показатель полувыведения в терминальной фазе составляет 40 минут; общий клиренс составляет от 0.3 до 0.6 л/мин. Во время лечения не отмечается изменения длительности периода полувыведения.

Омепразол полностью метаболизируется цитохромом P450 (CYP) в печени. Метаболизм препарата в основном зависит от специфического изофермента CYP2C19 (S-мефинитон гидроксилаза), который отвечает за образование основного метаболита гидроксидомепразола. Метаболиты не оказывают влияния на желудочную секрецию кислоты. Около 80% от внутривенно введенной дозы выводится в виде метаболитов с мочой, а остальная часть - с фекалиями.

У больных с пониженной функцией почек экскреция омепразола не претерпевает каких-либо изменений. Отмечается повышение периода полувыведения у пациентов с нарушенной функцией печени, однако, аккумуляции омепразола не происходит.

## **Показания**

Язва двенадцатиперстной кишки, язва желудка, рефлюкс-эзофагит, лечение синдрома Золлингера-Эллисона.

## **Противопоказания**

Повышенная чувствительность к омепразолу.

## **Беременность и лактация**

### *Беременность*

Результаты эпидемиологических исследований показали отсутствие побочного действия омепразола на протекание беременности, на плод или на новорожденного.

Лосек может применяться во время беременности.

### *Лактация*

Омепразол выделяется с грудным молоком. Влияние на детей, если таковое имеется, не известно.

## **Способ применения и дозы**

При невозможности проведения пероральной терапии пациентам с язвой желудка и двенадцатиперстной кишки или рефлюкс-эзофагитом рекомендуется назначать инфузию препарата Лосек в дозе 40 мг один раз в день. Пациентам с синдромом Золлингера-Эллисона рекомендуется начальное внутривенное введение Лосека в дозе 60 мг в день. Дозы подбираются индивидуально, иногда требуется введение более высокой дозы. Если величина суточной дозы превышает 60 мг, то доза должна быть разделена на два приема.

Инфузионный Лосек вводится внутривенно в течение 20-30 минут.

Рекомендуется вводить раствор для инфузий сразу же после его приготовления.

### *Больные с нарушенной функцией почек*

У больных с нарушенной функцией почек нет необходимости проводить коррекцию дозы.

#### *Больные с нарушенной функцией печени*

Для больных с нарушенной функцией печени суточная доза 10-20 мг в сутки может быть достаточной, поскольку у этих больных увеличен период полувыведения омепразола.

#### *Больные пожилого возраста*

Нет необходимости проводить корректировку дозы у больных пожилого возраста.

#### *Дети*

Имеется ограниченный опыт применения Лосека у детей.

### **Инструкция по приготовлению инфузионного раствора**

Инфузионный раствор готовится путем растворения лиофилизированного порошка омепразола в 100 мл 5% инфузионного раствора декстрозы или в 100 мл инфузионного физиологического раствора.

Инфузионный раствор на 5% декстрозе должен быть использован в течение 6 часов. Инфузионный раствор на физиологическом растворе должен быть использован в течение 12 часов.

#### *Приготовление*

1. Набрать шприцем 5 мл инфузионного раствора из флакона или инфузионного мешка.
2. Ввести инфузионный раствор во флакон с лиофилизированным порошком омепразола, встряхнуть флакон до полного растворения препарата.
3. Набрать в шприц раствор омепразола.
4. Перенести раствор омепразола во флакон или инфузионный мешок.
5. Повторить операции 1-4 для того, чтобы перенести весь препарат из флакона.

#### *Альтернативное приготовление инфузионного раствора в мягком контейнере*

1. Для приготовления раствора использовать двустороннюю иглу (-переходник). Одним концом иглы проколоть мембрану инфузионного мешка, другой конец иглы соединить с флаконом лиофилизированного омепразола.
2. Растворить порошок омепразола, прокачивая инфузионный раствор из мешка во флакон и обратно.
3. Убедиться, что порошок полностью растворился, после чего отсоединить пустой флакон и удалить иглу из инфузионного мешка.

### **Особые указания**

При подозрении на язву желудка на ранних стадиях необходимо пройти рентгеновское или эндоскопическое обследование для установки правильного диагноза и назначения адекватного лечения.

При наличии любых тревожных симптомов (например, таких как значительная спонтанная потеря массы тела, частая рвота, дисфагия, рвота с кровью или мелена), а также при наличии язвы желудка (или при подозрении на язву желудка) следует исключить возможность злокачественного новообразования, поскольку лечение Лосеком может привести к сглаживанию симптоматики и отсрочить постановку диагноза.

### **Несовместимость**

Не отмечается, если следовать инструкции в разделе “Способ применения и дозы”.

### **Взаимодействие с другими лекарственными формами**

Следует избегать совместного применения Лосека лиофилизата для приготовления раствора для внутривенных инфузий с кетоконазолом и итраконазолом.

Абсорбция некоторых препаратов может изменяться в связи с воздействием омепразола на кислотность желудочной среды.

Так, растворение таблеток кетоконазола снижается при увеличении желудочного pH

вследствие применения препаратов, ингибирующих секрецию кислоты (антацидные агенты, сукральфат), что в свою очередь приводит к снижению концентрации кетоконазола в плазме. При совместном применении омепразола и итраконазола концентрация в плазме и площадь под кривой «концентрация-время» итраконазола уменьшается приблизительно до 65%, вероятно, вследствие более низкой абсорбции, которая зависит от pH.

Омепразол ингибирует CYP2C19, в связи с чем совместное применение омепразола с препаратами, в метаболизме которых принимает участие CYP2C19, такими как диазепам, варфарин, фенитоин, может привести к повышению концентраций этих препаратов в плазме и потребовать снижения дозы.

При совместном приеме кларитромицина или эритромицина и омепразола повышается концентрация омепразола в плазме. Совместный прием с амоксициллином или метронидазолом не влияет на концентрацию омепразола в плазме.

*Влияние лекарственных препаратов на фармакокинетику омепразола*

Препараты, ингибирующие ферменты CYP2C19 или CYP3A (ингибиторы ВИЧ протеазы, кетоконазол, итраконазол), могут повышать концентрацию омепразола в плазме.

Не выявлено влияние омепразола на следующие препараты: антациды, теофиллин, кофеин, хинидин, лидокаин, пропранолол или этанол.

### **Побочное действие**

Препарат Лосек в целом хорошо переносится. Сообщалось о следующих побочных эффектах, однако, в большинстве случаев действительная связь между эффектами и лечением не была установлена.

#### *Кожные покровы*

Кожные высыпания и/или кожный зуд.

В отдельных случаях реакция фоточувствительности, мультиформная эритема, алопеция.

#### *Костно-мышечная система*

В редких случаях артралгия, мышечная слабость, миалгия.

#### *Центральная и периферическая нервная система*

Головная боль, гипонатриемия.

Головокружение, парестезия, сонливость, бессонница. В редких случаях у больных с тяжелыми сопутствующими заболеваниями может отмечаться депрессия, возбужденность, агрессивность и галлюцинации.

#### *Желудочно-кишечная система*

Диарея, запор, абдоминальные боли, тошнота/рвота, метеоризм. В отдельных случаях сухость во рту, стоматит, гастроинтестинальный кандидоз.

#### *Система печени*

В редких случаях повышение активности печеночных ферментов. В крайне редких случаях у пациентов с тяжелым заболеванием печени (гепатит с/без желтухи, печеночная недостаточность) может развиваться энцефалопатия.

#### *Эндокринная система*

В крайне редких случаях гинекомастия

#### *Кровеносная система*

В редких случаях лейкопения, тромбоцитопения, агранулоцитоз и панцитопения.

### *Другие*

Общее недомогание.

Реакция гиперчувствительности в виде крапивницы (редко), в отдельных случаях ангионевротический отек, лихорадка, бронхоспазм, интерстициальный нефрит, анафилактический шок.

В отдельных случаях может отмечаться повышенное потоотделение, периферический отек, нарушение зрения, изменения вкусовых ощущений.

Имелись сообщения о синдроме Стивенса-Джонсона и токсическом эпидермальном некролизе, связь с приемом препарата не установлена.

Имелись сообщения о необратимом нарушении функции зрения у больных с тяжелыми сопутствующими заболеваниями на фоне внутривенных инъекций омепразола в больших дозах. Однако, причинная связь между ухудшением функции зрения и лечением омепразолом не была установлена.

### **Передозировка**

В клинических исследованиях проводилось внутривенное введение препарата в течение одного дня до 270 мг и до 650 мг в течение трехдневного периода без каких-либо последствий для пациента.

### **Влияние на способность управлять транспортом и работу с механизмами**

Лосек не влияет на способность управлять транспортом и работу с механизмами.

### **Форма выпуска**

По 40 мг активного вещества омепразола в стеклянном флаконе. Стеклянный флакон с резиновой пробкой и алюминиевым обжимным кольцом и пластиковой крышечкой. 5 флаконов в пластиковой контурной ячейке помещены в картонную коробку с инструкцией по применению.

### **Условия хранения**

В защищенном от света месте при температуре ниже 25° С. Флаконы хранить в упаковке. Флакон (флакон без картонной коробки): хранить в защищенном от света месте, при комнатном освещении хранить не более 24 часов.

Приготовленный раствор: инфузия должна быть проведена в течение 12 часов, если использовался физиологический раствор и в течение 6 часов, если использовался раствор 5% декстрозы.

### Специальные предосторожности при хранении

Порошок для инфузии должен растворяться в 100 мл инфузионного физиологического раствора или в 100 мл 5% инфузионного раствора декстрозы. Инфузия должна быть проведена в течение 12 часов, если использовался физиологический раствор, в течение 6 часов, если использовался раствор 5% декстрозы.

Растворы готовятся при комнатном освещении без особых предосторожностей.

### **Срок годности**

2 года

10 JC/GI/000-042-948.2.0

**Форма отпуска**

По рецепту.

**Фирма-производитель**

АстраЗенека АБ, SE - 151 85 Содерталье, Швеция.

Дальнейшая информация предоставляется по требованию:  
АстраЗенека ЮК Лтд, 119021 Москва, ул. Тимура Фрунзе д.11, стр.2-5

GI.000-042-948.2.0

Лосек торговая марка- собственность компании АстраЗенека.

©AstraZeneca 2005