

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату

КОНТРОЛОК®
(CONTROLOC®)

Склад:

діюча речовина: 1 таблетка містить 22,6 мг пантопрозолу сесквігідрату натрію, що відповідає 20 мг пантопрозолу;

допоміжні речовини: маніт (Е 421), натрію карбонат безводний, кросповідон, повідон К 90, кальцію стеарат;

оболонка: гідроксипропілметилцелюлоза, повідон К 25, титану діоксид (Е 171), заліза оксид (Е 172), пропіленгліколь, метакрилатний сополімер (тип А), натрію лаурилсульфат, полісорбат 80, триетилцитрат, чорнила коричневі (S-1-26514).

Лікарська форма. Таблетки, резистентні до шлункового соку.

Фармакотерапевтична група.

Засоби для лікування пептичної виразки та гастроезофагеальної рефлюксної хвороби. Інгібітор протонного насоса. Код АТС А02В С02.

Клінічні характеристики.

Показання.

Контролок®, таблетки по 20 мг, застосовують для:

- лікування рефлюксної хвороби легкого ступеня тяжкості та її симптомів (таких як печія, закид кислоти, біль при ковтанні);
- тривалого лікування та профілактики рецидивів рефлюкс-езофагіту;
- профілактика утворення виразки шлунка та дванадцятипалої кишки, спричиненої прийомом неселективних нестероїдних протизапальних засобів (НПЗЗ) у пацієнтів групи ризику, які повинні застосовувати НПЗЗ довгий час.

Противоказання.

Підвищена чутливість до пантопрозолу або до будь-якого компонента препарату.

Пантопрозол, як і інші інгібітори протонного насоса, протипоказано застосовувати з атазанавіром (див. розділ „Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій”).

Дитячий вік до 12 років.

Спосіб застосування та дози.

Лікування рефлюксної хвороби легкого ступеня тяжкості та її симптомів (таких як печія, закид кислоти, біль при ковтанні)

Рекомендована доза для дорослих та дітей віком від 12 років становить 20 мг препарату Контролок® на день (1 таблетка). Симптоматика, як правило, минає через 2 - 4 тижні лікування. Зазвичай термін лікування езофагіту становить 4 тижні. Якщо цього терміну недостатньо, лікування продовжують протягом наступних 4-х тижнів. Після зникнення симптоматики, її рецидиви можна контролювати, застосовуючи 20 мг препарату на добу залежно від необхідності.

Тривале лікування та профілактика рецидиву рефлюкс-езофагіту.

Для довготривалого лікування підтримуюча доза становить 20 мг препарату Контролок® на день (1 таблетка), при очікуваному загостренні можливо збільшення дози до 40 мг на день. У такому разі рекомендується прийом таблеток Контролок® 40 мг. Після покращання стану дозу знову можна зменшити до 20 мг препарату на добу.

Профілактика виразок шлунка та дванадцятипалої кишки, спричинених прийомом неселективних НПЗЗ у пацієнтів групи ризику, які повинні приймати НПЗЗ тривалий час

Препарат Контролок® слід приймати натщесерце, запиваючи водою, не розжовуючи і не подрібнюючи.

Рекомендована доза для дорослих становить 20 мг препарату Контролок® на день (1 таблетка).

Пацієнтам з тяжкими порушеннями функції печінки добу дозу 20 мг препарату Контролок® не слід перевищувати.

Для пацієнтів літнього віку та з порушеннями функції нирок зменшення дози зазвичай не потрібно.

Побічні реакції. Небажані ефекти за частотою виникнення класифікують за такими категоріями:

часто (> 1/100 і < 1/10), іноді (> 1/1000 і < 1/100), рідко (> 1/10000 і < 1/1000), дуже рідко (< 1/10000, включаючи поодинокі випадки).

Порушення з боку крові та лімфатичної системи.

Дуже рідко: лейкопенія, тромбоцитопенія.

Порушення з боку шлунково-кишкового тракту.

Часто: біль в епігастральній ділянці, діарея, запор, метеоризм.

Іноді: нудота, блювання.

Рідко: сухість у роті.

Загальні розлади:

Дуже рідко: периферичні набряки.

Порушення з боку печінки.

Дуже рідко: підвищення рівня печінкових ферментів (трансаміназ, -ГТ), тригліцеридів, підвищення температури тіла, гепатоцелюлярні порушення, що призводили до жовтяниці або печінкової недостатності.

Порушення з боку імунної системи.

Дуже рідко: анафілактичні реакції, включаючи анафілактичний шок.

Порушення з боку шкіри та кістково-м'язової системи.

Іноді: алергічні реакції (свербіж, шкірні висипання).

Рідко: артралгія.

Дуже рідко: міалгія, кропив'янка, ангіоедема, мультиформна еритема, синдром Лайелла, синдром Стівенса-Джонсона, фоточутливість.

Порушення з боку нервової системи.

Часто: головний біль.

Іноді: запаморочення, порушення зору (затьмареність).

Рідко: депресії, галюцинації, дезорієнтація і збентеження, особливо у пацієнтів, які мають схильність до цього, а також погіршення цих симптомів у випадку їх наявності.

Порушення з боку нирок та сечовидільної системи.

Дуже рідко: інтерстиціальний нефрит.

Передозування.

Симптоми передозування у людини невідомі.

Дози до 240 мг при внутрішньовенному введенні протягом 2 хвилин добре переносяться. У разі передозування з ознаками інтоксикації вживають загальні дезінтоксикаційні заходи.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Досвід застосування препарату у вагітних жінок обмежений. У дослідженнях репродуктивної функції на тваринах спостерігалася незначна ембріотоксичність у дозах понад 5 мг/кг. Даних щодо виділення пантопрозолу в грудне молоко немає. Тому в період вагітності і годування груддю таблетки пантопрозолу можна застосовувати тільки тоді, коли очікувана користь для матері перевищує потенційний ризик для плода або дитини.

Діти.

Контролок® не слід застосовувати дітям віком до 12 років.

Особливості застосування.

При тяжких порушеннях функції печінки під час лікування препаратом, особливо при тривалому застосуванні, необхідний регулярний контроль за рівнями печінкових ферментів. У випадку збільшення рівня ферментів лікування необхідно припинити.

Пацієнтам, які застосовують НПЗЗ довгий час та знаходяться в групі підвищеного ризику розвитку шлунково-кишкових ускладнень, прийом препарату для профілактики виразки шлунка та дванадцятипалої кишки слід обмежити.

Оцінка рівня ризику проводиться з урахуванням індивідуальних факторів ризику, включаючи вік (понад 65 років), анамнез розвитку виразки шлунка або дванадцятипалої кишки, а також шлунково-кишкових кровотеч.

Пантопрозол може знижувати абсорбцію вітаміну В₁₂ (ціанкобаламіну), що може призвести до гіпо- або ахлоргідрії. Це слід враховувати при довготривалому застосуванні препарату та пацієнтам зі зниженою масою тіла.

При довготривалому періоді лікування, особливо більше року, пацієнти повинні знаходитися під постійним спостереженням.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами.

Не впливає.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Препарат може зменшувати всмоктування препаратів, біодоступність яких залежить від рН (наприклад, кетоконазол).

Доведено, що застосування атазанавіру 300 мг/ритонавіру 100 мг з омепразолом (40 мг один раз на добу) або атазанавіру 400 мг з лансопразолом (60 мг одноразово) у здорових добровольців спричиняє суттєве зменшення біодоступності атазанавіру. Всмоктування атазанавіру залежить від рН. Тому інгібітори протонного насоса, включаючи пантопрозол, не слід застосовувати разом з атазанавіром.

Пацієнтам, які застосовують непрямі антикоагулянти, фенпрокумон, варфарин, рекомендується проводити лабораторні тести на згортання тромбоцитів на початку, в кінці та у випадку нерегулярного лікування пантопрозолом.

Пантопрозол метаболізується в печінці через систему ферментів цитохром Р450. Не виключається взаємодія пантопрозолу з іншими препаратами, які метаболізується через цю ж систему. Проте проведення спеціальних досліджень із більшістю таких засобів не виявило клінічно значущих взаємодій з карбамазепіном, кофейном, діазепамом, диклофенаком, етанолом, глібенкламідом, метопрололом, напроксеном, ніфедипіном, фенітоїном, теофіліном, піроксикамом та оральними контрацептивами.

Не виявлено взаємодії з одночасно призначеними антацидними препаратами.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Пантопрозол – діюча речовина препарату Контролок® – пригнічує секрецію соляної кислоти у шлунку шляхом специфічного впливу на протонний насос парієтальних клітин.

Пантопрозол перетворюється на свою активну форму в кислому середовищі, а саме: у парієтальних клітинах шлунка, де він пригнічує Н⁺/К⁺-АТФазу, тобто кінцеву фазу утворення соляної кислоти незалежно від природи подразника, що стимулює її утворення. Пригнічення є дозозалежним і впливає на базальну та стимульовану секрецію шлункового соку. Лікування пантопрозолом зменшує рівень кислотності шлунка, що пропорційно спричиняє збільшення виділення гастрину. Збільшення рівня гастрину є оборотним. Оскільки пантопрозол зв'язує фермент на периферичному рівні щодо клітинного рецептора, ця сполука може впливати на секрецію соляної кислоти незалежно від стимуляції іншими сполуками (ацетилхолін, гістамін, гастрин). Ця дія не залежить від способу введення препарату – перорально або внутрішньовенно.

Пантопрозол швидко підвищує рівень гастрину. При короткочасному лікуванні у більшості випадків рівень гастрину не перевищує верхню межу норми. При довготривалому лікуванні рівень гастрину у більшості випадків збільшується вдвічі. Надмірне їх збільшення спостерігалася дуже рідко. Як результат, у поодиноких випадках при довготривалому лікуванні відзначалося незначне або помірне збільшення кількості різних ендокринних клітин шлунка (аденоматоїдна гіперплазія).

Фармакокінетика. Пантопрозол швидко всмоктується, максимальна концентрація (C_{max}) його у плазмі досягається навіть після

прийому однієї дози препарату 20 мг. У середньому C_{\max} 1 - 1,5 мкг/мл досягається через 2 - 2,5 години після прийому, ці рівні залишаються сталими після багаторазового приймання. Об'єм розподілу становить 0,15 л/кг, його кліренс – приблизно 0,1 л/год/кг. Період напіввиведення – 1 година. Через специфічну активацію пантопразолу у парієтальних клітинах період напіввиведення не корелює з тривалістю дії (пригнічення секреції кислоти).

Фармакокінетика не змінюється після одноразового або багаторазового приймання. В діапазоні доз від 10 мг до 80 мг фармакокінетика пантопразолу залишається лінійною як після перорального прийому, так і після внутрішньовенного введення.

Зв'язування з білками плазми становить 98 %. Препарат метаболізується в печінці. Головним шляхом виведення метаболітів є нирковий (майже 80 %), з фекаліями виділяється 20 %. Головним метаболітом як у плазмі, так і в сечі є дисметилпантопразол, зв'язаний із сульфатом. Період напіввиведення головного метаболіту (1,5 години) не набагато довший, ніж у пантопразолу.

Біодоступність. Пантопразол повністю всмоктується після перорального прийому. Абсолютна біодоступність таблеток становить 77 %. Вживання їжі не впливає на AUC (площа під кривою «концентрація-час»), C_{\max} та біодоступність.

Характеристики для особливих груп пацієнтів. Пацієнтам із порушеннями функції нирок (в тому числі пацієнтів, які перебувають на гемодіалізі) зменшення дози пантопразолу не потрібне. Як і у здорових добровольців, період напіввиведення препарату у цих пацієнтів короткий. Незначна кількість пантопразолу діалізується. Незважаючи на те, що період напіввиведення головного метаболіту дещо зростає (2 - 3 години), він швидко виводиться і завдяки цьому не накопичується.

Хоча у пацієнтів із цирозом печінки (клас А та В) період напіввиведення діючої речовини збільшується до 3 - 6 годин і відповідно до цього у 3 - 5 раз збільшується AUC, C_{\max} пантопразолу в плазмі збільшується у 1,3 разу порівняно зі здоровими добровольцями.

Невелике збільшення AUC та C_{\max} у пацієнтів літнього віку, порівняно з пацієнтами молодшого віку, не є клінічно значущим.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості: таблетки жовтого кольору, овальні, двоопуклі, вкриті плівковою оболонкою, що резистентна до шлункового соку, з ядрами білого або майже білого кольору. Маркування «P20» коричневими чорнилами з одного боку таблетки.

Термін придатності.

3 роки.

Умови зберігання.

Зберігати при температурі 15 - 25 °С.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 14 таблеток у блістері; по 1 блістеру в картонній коробці.

Категорія відпуску.

За рецептом.

Виробник.

«Нікомед Оранієнбург ГмбХ», Німеччина для „Нікомед ГмбХ”, Німеччина /

«Nucomed Oranienburg GmbH», Germany for „Nucomed GmbH”, Germany.