

ІНСТРУКЦІЯ  
для медичного застосування препарату  
**КОНТРОЛОК**  
(**CONTROLOC**)

**Склад:**

*діюча речовина:* пантопразол;

1 флакон містить 42,3 мг пантопразолу натрію, що еквівалентно 40 мг пантопразолу;

*допоміжні речовини:* динатрію едетат, натрію гідроксид.

**Лікарська форма.** Порошок для приготування розчину для ін'єкцій.

**Фармакотерапевтична група.** Засоби для лікування пептичної виразки та гастроєзофагеальної рефлюксної хвороби. Інгібітор протонного насоса. Код АТС А02В С02.

**Клінічні характеристики.****Показання.**

- Виразка дванадцятипалої кишки.
- Виразка шлунка.
- Рефлюкс-езофагіт середнього та важкого ступеня.
- При синдромі Золлінгера-Еллісона та інших патологічних гіперсекреторних станах.

**Противоказання.** Підвищена чутливість до пантопразолу або до будь-якого компонента препарату.

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

**Спосіб застосування та дози.**

Внутрішньовенне введення препарату рекомендується лише у випадку, коли його застосування перорально не можливе.

**Рекомендовані дози.**

*Виразка шлунка, виразка дванадцятипалої кишки та рефлюкс-езофагіт середнього та важкого ступеня:*

1 флакон (40 мг пантопразолу) на добу внутрішньовенно.

Пептичні виразки, ускладнені шлунково-кишковими кровоточками, з метою профілактики повторної кровотечі - Контролок 80 мг внутрішньовенно болюсно, потім у вигляді краплинної інфузії 8 мг/год протягом 3-х днів.

*Тривале лікування синдрому Золлінгера-Еллісона та інших патологічних станів гіперсекреції.*

Початкова добова доза препарату становить 80 мг. За необхідності дозу можна титрувати, збільшуючи або зменшуючи, залежно від показників секреції кислоти в шлунку. При дозах, що перевищують 80 мг на добу, їх необхідно поділити на два введення. Можливе тимчасове збільшення дози пантопразолу більше 160 мг, аж тривалість застосування повинна обмежуватися тільки періодом, який необхідний для адекватного контролю секреції кислоти.

У випадку, коли необхідне швидке зменшення кислотності, більшості пацієнтів досить початкової дози 2 x 80 мг для досягнення бажаного рівня (< 10 мЕкв/год) протягом 1 години. При клінічній можливості здійснюється перехід від внутрішньовенного введення Контролоку до перорального.

**Загальні вказівки.**

Порошок розчиняють у 10 мл фізіологічного розчину хлориду натрію, що додається у флакон. Цей розчин можна вводити безпосередньо або після змішування із 100 мл розчину хлориду натрію 0,9 % чи 5 % або 10 % розчином глюкози.

Приготований розчин необхідно використати протягом 12 годин.

Контролок не можна готувати або змішувати з іншими розчинниками крім тих, що зазначені вище.

Внутрішньовенне введення необхідно проводити протягом 2 – 15 хв.

**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, тромбофлебіт у місці введення.

**Порушення з боку печінки.**

Дуже рідко: підвищення рівня печінкових ферментів (трансаміназ, -ГТ), тригліцеридів, підвищення температури тіла, гепатоклітинний розлад, що призводить до жовтяниці або безпечінкової 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 Лайєлла, синдром Стивенса-Джонсона, фоточутливість.

**Порушення з боку нервової системи.**

Часто: головний біль.

Іноді: запаморочення, порушення зору (затьмареність).

Дуже рідко: депресії.

*Порушення з боку нирок та сечовидільної системи.*

Дуже рідко: інтерстиціальний нефрит.

**Передозування.** Симптоми передозування у людини невідомі. Дози до 240 мг, що вводилися внутрішньовенно довше 2 хв, добре переносилися. У разі передозування з ознаками інтоксикації застосовують 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 у грудне молоко немає. Тому в період вагітності і годування груддю пантопрозол можна застосовувати тільки у разі, коли очікувана користь від застосування перевищує можливий ризик для плода.

**Діти.** Контролок® не слід застосовувати дітям віком до 18 років.

#### **Особливості застосування.**

Внутрішньовенне введення препарату рекомендується тільки, якщо пероральне застосування протипоказане.

Контролок не рекомендується застосовувати при незначних шлунково-кишкових порушеннях, таких як нервова диспепсія.

При наявності тривожних симптомів (значна втрата маси тіла, періодичне блювання, диспазія, блювання із кров'ю, анемія, мелена), наявності виразки шлунка повинна бути виключена злякисність, оскільки лікування пантопрозолом може маскувати симптоми злякисної виразки та відстрочувати встановлення діагнозу.

Пацієнтам з порушеннями функції нирок та пацієнтам літнього віку не слід перевищувати добову дозу 40 мг.

Пацієнтам з тяжкими порушеннями функції печінки добову дозу необхідно зменшити до 20 мг пантопрозолу. Крім того, у цих пацієнтів необхідно контролювати рівень печінкових ферментів, у випадку їх підвищення лікування препаратом Контролок слід припинити.

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

Доведено, що застосування 300 мг атазанавіру/100 мг ритонавіру з омепразолом (40 мг один раз на добу) або атазанавіру 400 мг із лансопрозолом (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 Р<sub>450</sub>. Не виключається взаємодія пантопрозолу з іншими препаратами, які метаболізуються 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<sup>+</sup>/К<sup>+</sup>-АТФ, 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'язується з ферментами, віддаленими від клітинних рецепторів, він впливає на секрецію соляної кислоти незалежно від стимуляції іншими речовинами (ацетилхоліном, гістаміном, гастрином).

**Фармакокінетика.** Об'єм розподілу становить 0,15 л/кг, його кліренс – приблизно 0,1 л/год/кг. Період напіввиведення – 1 година. Через специфічну активацію пантопрозолу у парієтальних клітинах період напіввиведення не корелює з тривалістю дії (пригнічення секреції кислоти).

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

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

**Характеристики для окремих груп пацієнтів.** Пацієнтам із порушеннями функції нирок (включаючи пацієнтів, які перебувають на гемодіалізі) зменшення дози пантопрозолу не потрібне. Так само, як і у здорових осіб, період напіввиведення пантопрозолу у цих пацієнтів короткий. Зовсім невелика кількість пантопрозолу діалізується. Незважаючи на те, що період напівжиття головного метаболіту дещо збільшується (2 – 3 години), він швидко виводиться, тому не накопичується.

Хоча у хворих на цироз печінки (клас А та В за класифікацією Чайлда (Child)) період напіввиведення діючої речовини збільшується до 7 – 9 годин і, відповідно до цього збільшується АUC, максимальна концентрація пантопрозолу в плазмі збільшується лише у 1,5 рази, порівняно зі здоровими особами.

Невелике збільшення АUC і C<sub>max</sub> у пацієнтів літнього віку, порівняно з пацієнтами молодшого віку, не є клінічно значущим.

#### **Фармацевтичні характеристики.**

**Основні фізико-хімічні властивості:** сухий порошок від білого до білуватого кольору;

**Термін придатності.** 2 роки. Термін зберігання готового розчину – 12 год.

**Умови зберігання.** Зберігати при температурі 25 °С у недоступному для дітей місці.

**Упаковка.** Порошок для ін'єкцій у флаконі. По 1 флакону у картонній коробці.

**Категорія відпуску.** За рецептом.

**Виробник.** „Нікомед ГмБХ”, Німеччина / „Nycomed GmbH”, Germany.

**Місцезнаходження.** Бік Гульден Штрассе 2, Д-78467 Констанц, Німеччина / Byk-Gulden-Strabe 2, D-78467 Konstanz, Germany.