

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
КОНТРОЛОК
(CONTROLOC)

Загальна характеристика:

міжнародна та хімічна назви: пантопразол; заміщений бензimidазол, натрій-5-дифлуорометокси-2-[(3,4-диметокси-2-піридилметил)-сульфініл]-1H-бензimidазолу сесквігідрат;

основні фізико-хімічні властивості: таблетки двоопуклі, овальні, жовтого кольору, вкриті плівковою оболонкою, резистентною до дії шлункового соку, з ядрами білого або майже білого кольору; маркування коричневими чорнилами на одному боці: "P20";

склад: 1 таблетка містить 22,6 мг пантопразолу натрію сесквігідрат, що відповідає 20 мг пантопразолу;

допоміжні речовини: Д-манітол, натрію карбонат, кросповідон, повідон К90, кальцію стеарат, вода очищена, метилгидроксипропілцелюлоза, повідон К25, титану діоксид (Е 171), заліза оксид жовтий (Е 172), пропіленгліколь, метакрилова кислота-етакрилат-кополімер (1:1), натрію лаурилсульфат, полісорбат-80, триетилцитрат, чорнила коричневі.

Форма випуску. Таблетки, резистентні до шлункового соку.

Фармакотерапевтична група. Препарат для лікування пептичних виразок; інгібітор протонної помпи. Код АТС А02В С02.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Пантопразол - діюча речовина препарату - пригнічує секрецію соляної кислоти у шлунку шляхом специфічного впливу на протонну помпу парієтальних клітин.

Пантопразол перетворюється на свою активну форму в кислому середовищі, а саме: у парієтальних клітинах шлунка, де він пригнічує H^+/K^+ -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 пантопразолом зменшує рівень кислотності шлунка, що пропорційно спричиняє збільшення виділення гастрину. Збільшення рівня гастрину є оборотним.

При короткотривалому лікуванні у більшості випадків рівні гастрину не перевищують верхню межу норми. При довготривалому лікуванні рівні гастрину у більшості випадків збільшуються вдвічі. Надмірне їх збільшення спостерігалось рідко. Як результат, у поодиноких випадках при довготривалому лікуванні відмічалось незначне або помірне збільшення кількості різних ендокринних клітин шлунка (аденоматоїдна гіперплазія).

Фармакокінетика. Пантопразол швидко всмоктується, максимальна концентрація його у плазмі досягається навіть після прийому однієї дози препарату 20 мг. У середньому максимальна концентрація 1,0–1,5 мкг/мл досягається через 2,0–2,5 год після прийому, ці рівні залишаються сталими після багаторазового прийому. Об'єм розподілу становить 0,15 л/кг, його кліренс – приблизно 0,1 л/год/кг. Період напіввиведення - 1 год. У зв'язку зі специфічною активацією пантопразолу в парієтальних клітинах період напіввиведення не корелює з тривалістю дії (пригнічення секреції кислоти).

Фармакокінетика не змінюється після одноразового або багаторазового прийому. В діапазоні доз від 10 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 год) не набагато довший, ніж у пантопразолу.

Біодоступність.

Пантопразол повністю всмоктується після перорального прийому. Абсолютна біодоступність таблеток становить 77 %. Вживання їжі не впливає на АUC (площа під кривою "концентрація-час"), максимальну концентрацію та біодоступність.

Характеристики для окремих груп пацієнтів. Пацієнтам із порушеннями функції нирок (включаючи пацієнтів, які знаходяться на гемодіалізі) зменшення дози пантопразолу не потрібне. Так само, як і у здорових суб'єктів, період напівжиття препарату у цих пацієнтів короткий. Незначна кількість пантопразолу діалізується. Незважаючи на те що період напівжиття головного метаболіту дещо збільшується (2–3 год), він швидко виводиться, і таким чином, не накопичується.

Хоча у хворих на цироз печінки (клас А та В) період напівжиття пантопразолу збільшується до 3–6 год і відповідно до цього у 3–5 разів збільшується АUC, максимальна концентрація пантопразолу в плазмі збільшується лише в 1,3 раза порівняно зі збільшенням такої концентрації у здорових суб'єктів.

Невелике збільшення АUC та максимальної концентрації (C_{max}) у пацієнтів літнього віку порівняно з відповідними даними у пацієнтів молодшого віку не є клінічно значущим.

Показання для застосування.

Контролок® таблетки, резистентні до шлункового соку, по 20 мг застосовується:

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

Спосіб застосування та дози.

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

Рекомендована доза становить 20 мг препарату Контролок® на день (1 таблетка). Симптоматика, як правило, минає через 2 – 4 тижні лікування. Для вилікування асоційованого езофагіту, як правило, необхідно 4 – 8 тижнів.

Тривале лікування та профілактика рецидиву рефлюкс-езофагіту.

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

При тривалості лікування понад 1 рік необхідно враховувати ризик та вигоду такого лікування, оскільки безпека прийому препарату протягом декількох років не підтверджена.

Профілактика виразок шлунка та дванадцятипалої кишки, спричинених прийомом неселективних нестероїдних протизапальних засобів (НПЗЗ) у пацієнтів групи ризику, які повинні застосовувати НПЗЗ тривалий час.

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

Таблетки препарату Контролок® 20 мг слід приймати натщесерце, запиваючи водою, не розжовуючи і не подрібнюючи.

Побічна дія.

З боку ШКТ: біль в епігастральній ділянці, діарея, запор або метеоризм. У поодиноких випадках повідомлялося про нудоту.

З боку ЦНС: іноді може виникати головний біль. У поодиноких випадках повідомлялося про запаморочення та розлади зору (затьмареність зору).

З боку шкіри та прилеглих тканин: іноді відмічалися алергічні реакції у вигляді свербіжів та шкірних висипів. У поодиноких випадках спостерігалися кропив'янка, еритема мультиформна, синдром Луелла, синдром Стівена-Джонсона, фоточутливість та ангіоневротичний набряк.

З боку жовчовивідної системи: дуже рідко відмічалася ушкодження клітин печінки, що призводило до розвитку жовтухи з або без печінкової недостатності.

З боку кістково-м'язового апарату: в поодиноких випадках відмічалася міалгія, яка минала після припинення прийому препарату.

З боку сечовидільної системи: в поодиноких випадках спостерігався інтерстиціальний нефрит.

Розлади психіки: рідко - депресія, галюцинації, дезорієнтація і збентеження, особливо у пацієнтів, які мають схильність до цього, а також погіршення цих симптомів у випадку їх наявності.

Організм загалом: у поодиноких випадках відмічалася підвищення температури та периферичні набряки, які минали після відміни препарату. Лікування препаратом Контролок® 20 мг іноді призводило до розвитку анафілактичних реакцій, включаючи анафілактичний шок.

Розлади метаболізму: дуже рідко відмічалася підвищення рівня печінкових ферментів (трансаміназ, -ГТ), тригліцеридів, яке минало після припинення застосування препарату.

Протипоказання. Препарат Контролок® протипоказаний пацієнтам із відомою гіперчутливістю до пантопразолу або до будь-якого компонента таблетки. Пантопрозол, як і інші інгібітори протонної помпи, протипоказано застосовувати із атазанавіром.

Передозування. Симптоми передозування у людини не відомі.

Дози до 240 мг при внутрішньовенному введенні протягом 2 хв добре переносялися.

У разі передозування з ознаками інтоксикації вживають загальних дезінтоксикаційних заходів.

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 лікування необхідно припинити.

Добову дозу 20 мг пантопразолу не слід перевищувати пацієнтам із тяжкими порушеннями функції печінки.

Немає необхідності у зменшенні дози пацієнтам літнього віку та пацієнтам із порушеною функцією нирок.

Вплив на здатність керувати транспортними засобами та механізмами. Не впливає.

До початку лікування повинна бути виключена можливість злоякісної хвороби стравоходу або шлунка, оскільки лікування пантопразолом може маскувати ознаки злоякісних хвороб і може в такий спосіб відстрочити встановлення діагнозу.

Пацієнти, які після 4 тижнів терапії не піддаються лікуванню, повинні бути додатково досліджені.

Вагітність і годування груддю. Досвід застосування препарату вагітними обмежений. У дослідженнях репродуктивної функції на тваринах спостерігалася незначна ембріотоксичність у дозах більше 5 мг/кг. Таблетки пантопразолу можуть бути використані тільки тоді, коли користь від застосування перевищує можливий ризик для плода. Даних щодо виділення пантопразолу з грудним молоком немає.

Дитячий вік. Немає достатнього досвіду застосування препарату для лікування дітей.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами. Препарат Контролок® може зменшувати всмоктування препаратів, біодоступність яких залежить від кислотності шлунка (наприклад, кетоконазолу).

Пантопрозол метаболізується в печінці через систему ферментів цитохрому P450. Не виключено взаємодії пантопразолу з іншими препаратами, які метаболізується через цю саму систему. Однак проведення спеціальних досліджень з більшістю таких

Інструкцію завантажено з сайту www.dovgolit.com

засобів не виявило клінічно значущих взаємодій, а власне з карбамазепіном, кофеїном, діазепамом, диклофенаком, дигоксином, етанолом, глібенкламідом, метопрололом, напроксеном, ніфедипіном, фенпрокоумоном, фенітоїном, піроксикамом, теофіліном, варфариним та пероральними контрацептивами.

Взаємодії пантопразолу з одночасно призначеними антацидами не виявлено.

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 протонної помпи, включаючи пантопразол, не повинні застосовуватися разом з атазанавіром.

Умови та термін зберігання.

Зберігати у недоступному для дітей місці при температурі 15-25 °С.

Термін придатності – 3 роки.

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка. По 14 таблеток у блістері; 1 блістер у картонній коробці.

Виробник. Нікомед Оранієнбург ГмбХ, Німеччина для Нікомед ГмбХ, Німеччина.
Nycomed Oranienburg GmbH, Germany for Nycomed GmbH, Germany.

Адреса. Бік Гульден Штрассе 2, 78467 Констанц, Німеччина / Birk-Gulden-Strabe 2, 78467 Konstanz, Germany.