

УТВЕРЖДЕНА

Приказом Председателя
РГУ «Комитет медицинского и
фармацевтического контроля
Министерства здравоохранения
Республики Казахстан»
от «14» октября 2021 г.
№N043735

Инструкция по медицинскому применению лекарственного препарата (Листок-вкладыш)

Торговое наименование

Контролок

Международное непатентованное название

Пантопразол

Лекарственная форма, дозировка

Порошок для приготовления раствора для инъекций, 40 мг

Фармакотерапевтическая группа

Пищеварительный тракт и обмен веществ. Препараты для лечения заболеваний, связанных с нарушением кислотности. Противоязвенные препараты и препараты для лечения гастроэзофагеальной рефлюксной болезни (gastro-oesophageal reflux disease - GORD). Протонового насоса ингибиторы. Пантопразол.

Код АТХ А02ВС02

Показания к применению

Контролок показан для применения у взрослых при:

- рефлюкс-эзофагит
- язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки
- синдром Золлингера-Эллисона или другие состояния, характеризующиеся патологической желудочной гиперсекрецией

Перечень сведений, необходимых до начала применения

Противопоказания

- гиперчувствительность к активным компонентам препарата, к замещенным бензимидазолам или к любому из вспомогательных веществ
- совместное применение пантопразола с атазанавиром
- детский возраст до 18 лет
- беременность и период лактации

Необходимые меры предосторожности при применении

Злокачественные новообразования желудка

Симптоматический ответ на пантопразол может маскировать симптомы злокачественного новообразования желудка и может задержать диагностику.

При наличии тревожных симптомов (например, значительная непреднамеренная потеря веса, повторяющаяся рвота, дисфагия, рвота с примесью крови, анемия или мелена) и при наличии или подозрении на язву желудка, следует исключать злокачественный процесс.

При сохранении симптомов, несмотря на проводимое лечение, следует провести дополнительное обследование.

Печеночная недостаточность

У пациентов с тяжелой печеночной недостаточностью следует контролировать уровень печеночных ферментов во время лечения препаратом. В случае повышения уровня печеночных ферментов лечение следует прекратить.

Совместное применение с ингибиторами протеазы ВИЧ

Пантопразол не рекомендуется применять вместе с ингибиторами протеазы ВИЧ, всасывание которых зависит от внутрижелудочной pH, например, с атазанавиром, из-за существенного снижения их биодоступности.

Желудочно-кишечные инфекции, вызванные бактериями

Терапия препаратом Контролок может привести к незначительной гастроинтестинальной инфекции, вызванной такими бактериями, как *Salmonella*, *Campylobacter* или *C. difficile*.

Контролок содержит натрий

В этом лекарственном препарате содержится менее 1 ммоль натрия (23 мг) на флакон, т.е. он практически "безнатриевый".

Гипомагниемия

Тяжелая степень гипомагниемии редко отмечалась у пациентов, получавших ИПН в течение не менее 3-х месяцев, а в большинстве случаев в течение года. Серьезные проявления гипомагниемии, такие как усталость, тетания, делирий, судороги, головокружение и желудочковая аритмия могут начинаться незаметно и могут быть просмотрены. Гипомагниемия может привести к гипокальциемии и/или гипокалиемии. У большинства пациентов с гипомагниемией (и с гипокальциемией, связанная с гипомагниемией, и/или гипокалиемией) она уменьшается после заместительной терапии препаратами магния и отмены ИПН.

Пациентам, которые должны применять длительную терапию, или пациентам, которые принимают ингибиторы протонной помпы вместе с дигоксином или лекарственными средствами, которые могут вызвать гипомагниемия (например диуретики), рекомендуется определять уровень магния перед началом лечения ингибиторами протонной помпы и периодически во время лечения.

Переломы костей

Ингибиторы протонного насоса, особенно при использовании высоких доз и в течение длительного времени (>1 года), могут умеренно повышать риск возникновения переломов бедренной кости, костей запястья и позвоночника, преимущественно у пожилых людей или при наличии других общепризнанных факторов риска. Данные наблюдательных исследований показывают, что ингибиторы протонной помпы могут увеличивать общий риск переломов на 10-40%. В некоторых случаях такое повышение может быть обусловлено наличием других факторов риска. Пациенты с риском развития остеопороза должны получать лечение в соответствии с действующими клиническими руководствами и достаточное количество витамина D и кальция.

Подострая кожная красная волчанка (ПККВ)

При лечении ингибиторами протонного насоса очень редко отмечается развитие ПККВ. При возникновении повреждений, особенно на участках кожи, подвергшихся воздействию солнечных лучей, а также при наличии сопутствующей артралгии, пациент должен немедленно обратиться за медицинской помощью, и медработнику следует оценить необходимость прекращения лечения препаратом Контролок. Возникновение ПККВ после предшествующего лечения ингибитором протонного насоса может повысить риск развития ПККВ при лечении другими ингибиторами протонного насоса.

Взаимодействие с лабораторными исследованиями

Повышение уровня хромогранина А (CgA) может помешать исследованиям нейроэндокринных новообразований. Для того, чтобы избежать эту помеху, лечение препаратом Контролок следует прекратить как минимум за 5 дней до исследования CgA. Если CgA и уровень гастрина не приходят в норму после начального исследования, анализы следует повторять через 14 дней после прекращения лечения ингибитора протонной помпы.

Взаимодействия с другими лекарственными препаратами

Лекарственные препараты, фармакокинетика всасывания которых зависит от pH

Ввиду глубокого и длительного ингибирования секреции желудочного сока, пантопразол может затруднять абсорбцию препаратов, для которых pH желудка является важной детерминантой биодоступности, например для некоторых азольных противогрибковых средств, таких как кетоконазол, итраконазол, позаконазол и др. такими как эрлотиниб.

Ингибиторы протеазы ВИЧ

Пантопразол не рекомендуется применять вместе с ингибиторами протеазы ВИЧ, всасывание которых зависит от внутрижелудочной pH, например, с атазанавиром, из-за существенного снижения их биодоступности.

Если комбинированное использование ингибитора протеазы ВИЧ с ингибитором протонной помпы считается все же необходимым, рекомендуется проводить тщательный клинический контроль (например,

определение вирусной нагрузки). Доза пантопразола не должна превышать 20 мг в день. Может потребоваться корректировка дозировки ингибитора протеазы ВИЧ.

Антикоагулянты кумаринового ряда (фенпрокумон или варфарин)

При совместном применении пантопразола с фенпрокумоном или варфарином, не было выявлено клинически значимых взаимодействий. Тем не менее, нужно отметить, что известны случаи увеличения МНО и протромбинового времени у пациентов, получавших ингибиторы протонной помпы с варфарином или фенпрокумоном. Увеличение МНО и протромбинового времени может привести к патологическим кровотечениям и даже к смерти. Пациенты, получающие пантопразол и варфарин или фенпрокумон, должны находиться под наблюдением врача с целью своевременного выявления увеличения МНО и протромбинового времени.

Метотрексат

Имеются сообщения о повышении уровня метотрексата в крови у некоторых пациентов при его совместном применении в высоких дозах (например, 300 мг) с ингибиторами протонного насоса. Поэтому при использовании высоких доз метотрексата, например, у пациентов со злокачественными новообразованиями и с псориазом, может возникнуть необходимость в рассмотрении вопроса о временной отмене пантопразола.

Другие исследования взаимодействия

Пантопразол активно метаболизируется в печени с помощью ферментной системы цитохрома P450. Основным путем метаболизма является деметилирование с помощью изофермента CYP2C19, а среди других путей метаболизма отмечается окисление с помощью изофермента CYP3A4. В исследованиях взаимодействия с другими лекарственными препаратами, которые также метаболизируются с помощью этих изоферментов (карбамазепин, диазепам, глибенкламид, нифедипин и пероральные контрацептивы, содержащие левоноргестрел и этинилэстрадиол), не было выявлено клинически значимого взаимодействия.

Нельзя исключить взаимодействия пантопразола с другими лекарственными препаратами или веществами, которые метаболизируются с помощью той же ферментной системы.

Результаты различных исследований взаимодействия показывают, что пантопразол не влияет на метаболизм активных веществ, метаболизируемых с помощью изоферментов CYP1A2 (например, кофеин, теofilлин), CYP2C9 (например, пироксикам, диклофенак, напроксен), CYP2D6 (например, метопролол), CYP2E1 (например, этанол) и не мешает всасыванию дигоксина, связанному с р-гликопротеином.

Взаимодействия с совместно принимавшимися антацидами не наблюдались.

Также проводились исследования взаимодействия пантопразола с соответствующими совместно принимавшимися антибиотиками

(кларитромицин, метронидазол, амоксициллин). Клинически значимого взаимодействия обнаружено не было.

Лекарственные препараты, которые подавляют или усиливают активность изофермента CYP2C19: Такие ингибиторы активности изофермента CYP2C19, как флувоксамин, могут повышать системную экспозицию пантопразола. Снижение дозы может понадобиться пациентам, получающим длительное лечение высокими дозами пантопразола, или пациентам с печеночной недостаточностью.

Такие индукторы активности изоферментов CYP2C19 и CYP3A4, как рифампицин и зверобой (*Hypericum perforatum*), могут снижать концентрации в плазме ИПН, которые метаболизируются с помощью этих ферментных систем.

Специальные предупреждения

Контролок содержит натрий

В этом лекарственном препарате содержится менее 1 ммоль натрия (23 мг) на флакон, т.е. он практически "безнатриевый".

Беременность и кормление грудью

В качестве меры предосторожности желательно исключить применение препарата Контролок во время беременности. Сообщалось о выделении пантопразола в грудное молоко. Риск для новорождённых/младенцев, находящихся на грудном вскармливании, исключить нельзя. Поэтому необходимо принимать решение о прекращении грудного вскармливания или об отмене/приостановлении лечения препаратом Контролок с учетом пользы грудного вскармливания для ребенка и пользы лечения препаратом Контролок для женщины.

Особенности влияния препарата на способность управлять транспортным средством или потенциально опасными механизмами

Контролок не влияет или незначительно влияет на способность управлять транспортным средством.

Следует воздержаться от управления транспортными средствами и другими механизмами, требующими повышенного внимания, из-за вероятности головокружений и нарушения зрения.

Рекомендации по применению

Данный препарат должен назначаться врачом и при соответствующем медицинском наблюдении.

Внутривенный прием рекомендуется только при невозможности приема препарата внутрь в таблетированной форме. Данные имеются по внутривенному применению в течение 7 дней. Поэтому внутривенное лечение препаратом Контролок необходимо отменить, как только станет возможно пероральное применение, и вместо внутривенной лекарственной формы следует назначить пероральную дозу пантопразола 40 мг.

Дозировка

Язва желудка и двенадцатиперстной кишки, рефлюкс-эзофагит

Рекомендуемая внутривенная доза оставляет 1 флакон препарата Контролок (40 мг пантопразола) в день.

Синдром Золлингера-Эллисона и другие патологические состояния, сопровождающиеся повышенной секрецией

Для длительного лечения синдрома Золлингера-Эллисона и других патологических состояний, сопровождающихся повышенной секрецией, лечение следует начинать с суточной дозы 80 мг препарата Контролок. Затем, при необходимости, дозу можно повышать или уменьшать, в зависимости от показателей кислотности желудочного сока.

В случае применения препарата в суточной дозе свыше 80 мг, дозу следует разделить и принимать дважды в день. Возможно временное увеличение суточной дозы свыше 160 мг препарата Контролок, но не следует применять дольше необходимого для контроля кислотности. В случае, если необходим быстрый контроль кислотности, начальная доза препарата Контролок 2×80 мг является достаточной для снижения кислотности до нормы (<10 мЭкв/час) в течение одного часа у большинства пациентов.

Особые группы населения

Пациенты с печеночной недостаточностью

У пациентов с тяжелой печеночной недостаточностью суточная доза пантопразола не должна превышать 20 мг в день (половина флакона пантопразола с дозой 40 мг).

Пациенты с почечной недостаточностью

Пациентам с нарушенной функцией почек коррекции дозы не требуется.

Пожилые пациенты

Пожилым пациентам не требуется коррекции дозы.

Дети

Безопасность и эффективность применения препарата Контролок в виде порошка для приготовления раствора для инъекции в дозе 40 мг у детей в возрасте младше 18 лет не установлена. Поэтому препарата Контролок в виде порошка для приготовления раствора для инъекции в дозе 40 мг не рекомендуется использовать у пациентов в возрасте младше 18 лет.

Способ применения

Для приготовления раствора для инъекции во флакон с порошком с целью его растворения добавляют 10 мл 0,9% (9 мг/мл) раствора хлорида натрия для инъекции.

Инструкции по приготовлению раствора

Для приготовления раствора для инъекции во флакон с порошком с целью его растворения добавляют 10 мл 0,9% (9 мг/мл) раствора хлорида натрия для инъекции. Готовый раствор после разведения должен быть прозрачным и иметь желтоватый цвет. Этот раствор можно вводить непосредственно или после смешивания со 100 мл 0,9% (9 мг/мл) раствора хлорида натрия для инъекции или 5% (55 мг/мл) раствора глюкозы для инъекции. Для разведения следует использовать стеклянные или пластмассовые контейнеры.

После растворения или растворения и разведения химическая и физическая стабильность препарата сохраняется в течение 12 часов при температуре 25°C.

С микробиологической точки зрения, препарат следует использовать сразу же после приготовления.

Контролок не следует приготавливать или смешивать с какими-либо другими не указанными выше растворителями.

Препарат следует вводить внутривенно в течение 2–15 мин.

Содержимое флакона предназначено только для однократного использования. Весь оставшийся в контейнере препарат или препарат с измененным внешним видом (например, если наблюдается помутнение или осадок) следует утилизировать в соответствии с местными требованиями.

Меры, которые необходимо принять в случае передозировки

Симптомы: неизвестны

Лечение: при подозрении на передозировку рекомендуется проведение поддерживающей и симптоматической терапии. Препарат не выводится посредством гемодиализа

Описание нежелательных реакций, которые проявляются при стандартном применении ЛП и меры, которые следует принять в этом случае (при необходимости)

Ниже перечислены наблюдавшиеся нежелательные реакции с частотой их встречаемости: очень часто ($\geq 1/10$); часто (от $\geq 1/100$ до $< 1/10$); нечасто (от $\geq 1/1000$ до $< 1/100$); редко (от $\geq 1/10000$ до $< 1/1000$); очень редко ($< 1/10000$); неизвестно (невозможно оценить по имеющимся данным).

Нарушения со стороны кровеносной и лимфатической системы

- Редко: агранулоцитоз
- Очень редко: тромбоцитопения, лейкопения, панцитопения

Нарушения со стороны иммунной системы

- Редко: гиперчувствительность (в том числе анафилактические реакции и анафилактический шок)

Нарушения со стороны обмена веществ и питания

- Редко: гиперлипидемия и повышение уровней липидов (триглицеридов, холестерина), изменение массы тела
- Частота неизвестна: гипонатриемия, гипомагниемия, гипокальциемия¹, гипокалиемия¹

Нарушения со стороны психики

- Нечасто: нарушения сна
- Редко: депрессия (включая обострения)
- Очень редко: дезориентация (включая обострения)
- Частота неизвестна: галлюцинации, спутанность сознания (в особенности у предрасположенных к этому пациентов, а также

обострение этих симптомов при их существовании до начала терапии)

Нарушения со стороны нервной системы

- Нечасто: головная боль, головокружение
- Редко: нарушение вкуса
- Частота неизвестна: парестезия

Нарушения со стороны органов зрения

- Редко: нарушение зрения/затуманивание зрения

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта

- Часто: железистые полипы дна желудка (доброкачественные)
- Нечасто: диарея, тошнота/рвота, вздутие живота и метеоризм, запор, сухость во рту, дискомфорт и боли в животе
- Частота неизвестна: воспаление толстой кишки, которая приводит к постоянной водянистой диарее (микроскопический колит)

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей

- Нечасто: повышение активности печеночных ферментов (трансаминаз, гамма-глутамилтранспептидазы)
- Редко: повышение уровня билирубина
- Частота неизвестна: гепатоцеллюлярные повреждения, желтуха, печеночно-клеточная недостаточность

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей

- Нечасто: сыпь/экзантема/высыпание, зуд
- Редко: крапивница, отек Квинке, отеки лица, языка (ангионевротический отек)
- Частота неизвестна: синдром Стивенса-Джонсона, синдром Лайелла, мультиформная эритема, фоточувствительность, подострая кожная красная волчанка, лекарственная реакция с эозинофилией и системными симптомами (DRESS)

Нарушения со стороны скелетно-мышечной и соединительной ткани

- Нечасто: перелом бедра, запястья или позвоночника
- Редко: артралгия, миалгия
- Частота неизвестна: Спазм мышц²

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей

- Частота неизвестна: интерстициальный нефрит (с возможным прогрессированием до почечной недостаточности)

Нарушения со стороны репродуктивной системы и молочной железы

- Редко: гинекомастия

Общие расстройства и нарушения в месте введения

- Часто: тромбоз/флебит в месте инъекции
- Нечасто: астения, утомляемость и недомогание
- Редко: повышение температуры тела, периферические отеки

¹гипокальциемия и/или гипокалиемия могут быть связаны с возникновением гипомагниемии

² как следствие нарушения электролитного баланса

При возникновении нежелательных лекарственных реакций обращаться к медицинскому работнику, фармацевтическому работнику или напрямую в информационную базу данных по нежелательным реакциям (действиям) на лекарственные препараты, включая сообщения о неэффективности лекарственных препаратов РГП на ПХВ «Национальный Центр экспертизы лекарственных средств и медицинских изделий» Комитет медицинского и фармацевтического контроля Министерства здравоохранения Республики Казахстан
<http://www.ndda.kz>

Дополнительные сведения

Состав лекарственного препарата

Один флакон содержит

активное вещество - пантопразола натрия сесквигидрат 45,10 мг (эквивалентно пантопразолу 40,0 мг),

вспомогательные вещества: динатрия эдетат, натрия гидроксид.

Описание внешнего вида, запаха, вкуса

От белого до почти белого цвета сухое вещество

Форма выпуска и упаковка

По 40 мг активного вещества помещают в стеклянные бесцветные флаконы, укупоренные пробками резиновыми и обжатые алюминиевыми колпачками с дисками из полипропилена.

1 флакон вместе с инструкцией по медицинскому применению на государственном и русском языках вкладывают в картонную коробку с прозрачной защитной наклейкой для контроля первого вскрытия.

Срок хранения

2 года

Не применять по истечении срока годности!

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25°C, в защищенном от света месте.

После растворения или растворения и разведения химическая и физическая стабильность препарата сохраняется в течение 12 часов при температуре 25°C.

С микробиологической точки зрения, препарат следует использовать сразу же после приготовления.

Если препарат не использовался сразу после приготовления, то ответственность за продолжительность и условия хранения готового раствора несет пользователь.

Хранить в недоступном для детей месте!

Условия отпуска из аптек

По рецепту

Сведения о производителе

Такеда Гмбх,
Роберт-Бош-Штрассе, 8 Д-78224 Зинген, Германия
Тел: +49 7531 840

Держатель регистрационного удостоверения

Такеда Гмбх,
Бик-Гульден-Штрассе 2, Д-78467 Констанц, Германия
Тел: +49-7531/84-0
Факс: +49-7531/84-2474

Наименование, адрес и контактные данные (телефон, факс, электронная почта) организации на территории Республики Казахстан, принимающей претензии (предложения) по качеству лекарственных средств от потребителей и ответственной за пострегистрационное наблюдение за безопасностью лекарственного средства

ТОО «Такеда Казахстан»
г. Алматы, ул. Шашкина 44
Номер телефона (727) 2444004
Адрес электронной почты AE.AsiaCaucasus@takeda.com