

УТВЕРЖДЕНА

Приказом _____ председателя
Комитета контроля медицинской
и фармацевтической деятельности
Министерства здравоохранения и
социального развития
Республики Казахстан
от «10» января 2017 г.
№ 5928

Инструкция по медицинскому применению лекарственного средства

Контролок Контрол

Торговое название

Контролок Контрол

Международное непатентованное название

Пантопразол

Лекарственная форма

Таблетки, покрытые кишечнорастворимой оболочкой, 20 мг

Состав

Одна таблетка содержит

активное вещество - пантопразола натрия сесквигидрат 22,57 мг,
(эквивалентно пантопразолу 20,0 мг),

вспомогательные вещества: натрия карбонат безводный, маннитол,
кросповидон, повидон К90, кальция стеарат, вода очищенная***

состав оболочки: гипромеллоза 2910, повидон К25, титана диоксид (Е171),
железа оксид желтый (Е172), пропиленгликоль

состав кишечнорастворимого покрытия: сополимер кислоты метакриловой и
этакрилата (1:1) 30% дисперсия**, триэтилцитрат, вода очищенная***

состав коричневых чернил Oрасode S-1-16530: шеллак глазурь 45%, железа (III)
оксид красный (Е172), железа (III) оксид черный (Е172), железа (III) оксид
желтый (Е172), аммиака раствор концентрированный.

* - действующее издание;

** - состав дисперсии: сополимер метакриловой кислоты и этилакрилата - 14.13 мг, натрия
лаурилсульфат – 0.10 мг, полисорбат 80 – 0.33 мг;

*** - удаляется в процессе производства.

Описание

Овальные двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой желтого цвета с ядром от белого до почти белого цвета. На одной стороне таблетки коричневыми чернилами напечатано «P20»

Фармакотерапевтическая группа

Препараты для лечения заболеваний, связанных с нарушением кислотности. Противоязвенные препараты и препараты для лечения гастроэзофагального рефлюкса. Ингибиторы протонного насоса. Пантопразол.
Код АТХ А02ВС02

Фармакологические свойства

Фармакокинетика

Всасывание

Пантопразол быстро абсорбируется из желудочно-кишечного тракта. Абсолютная биодоступность составляет 77%. Максимальная концентрация в плазме крови после приема дозы 20 мг - 1 – 1.5 мкг/мл достигается через 2 - 2,5 часа и остается постоянной после многократного применения. Объем распределения – приблизительно 0,15 л/ч/кг, клиренс – около 0,1 л/ч/кг. Совместный прием препарата с пищей не влияет на АUC, максимальную концентрацию сыворотки и, следовательно, на биодоступность. Прием препарата с пищей повышает только вариабельность временной задержки.

Распределение

Степень связывания пантопразола с сывороточными белками составляет приблизительно 98 %. Объем распределения составляет около 0,15 л/кг.

Метаболизм

Период полувыведения составляет около 1 часа и клиренс – приблизительно 0.1 л/час/кг. Вследствие специфического связывания пантопразола с протонными насосами париетальных клеток период полувыведения не коррелирует с длительностью действия препарата (ингибирование секреции кислоты). Основным путем выведения метаболитов пантопразола (примерно 80%) – через почки, остальные выделяются с фекалиями. Основным метаболитом в сыворотке и моче является дисметилпантопразол, связанный с сульфатом. Период полувыведения главного метаболита (приблизительно 1.5 час) не намного больше, чем пантопразола.

Характеристика для пациентов/отдельные группы пациентов

Для пациентов с нарушениями функции почек (в том числе пациентов, находящихся на диализе) снижения доз пантопразола не требуется. Для этих пациентов, как и для здоровых, период полураспада является коротким. Лишь очень небольшое количество пантопразола может подвергаться диализу. Несмотря на то, что основной метаболит пантопразола имеет немного более замедленное время полувыведения (2-3 час), его экскреция еще остается быстрой, и поэтому аккумуляции соединения не происходит.

Несмотря на то, что для пациентов с циррозом печени (класс А и В по Чайлду) время полураспада пантопразола увеличивается до 3-6-часов и величины АUC

возрастают в 3-5 раз, максимальная концентрация сыворотки повышается лишь незначительно – в 1.3 раза по сравнению со здоровыми пациентами.

Незначительное увеличение AUC и C_{max} у пожилых людей по сравнению с соответствующими показателями у более молодых лиц не является клинически значимым.

Фармакодинамика

Пантопразол является замещенным бензимидазолом, замедляющим секрецию соляной кислоты в желудке путем специфического воздействия на протонную помпу париетальных клеток.

В кислой среде париетальных клеток пантопразол превращается в свою активную форму – циклический сульфенамид, где он подавляет фермент H⁺, K⁺-АТФазу.

Процесс ингибирования зависит от дозы и оказывает влияние как на базальную, так и на стимулированную секрецию кислоты. У большинства пациентов исчезновение симптоматики достигается через 1 неделю. Как в случае других ингибиторов протонного насоса и H₂ рецепторов лечение пантопразолом вызывает уменьшение кислотности желудка, что пропорционально приводит к увеличению выделения гастрина. Повышение уровня гастрина обратимо.

Поскольку пантопразол связывает фермент на периферическом уровне по отношению к клеточному рецептору, это соединение может оказывать влияние на секрецию соляной кислоты независимо от стимуляции другими веществами (ацетилхолин, гистамин, гастрин). Пантопразол быстро повышает уровень гастрина. При кратковременном лечении в большинстве случаев уровни гастрина не превышают верхнего предела нормы. При длительном лечении в большинстве случаев уровень гастрина повышается в два раза. Однако его значительное увеличение отмечено только в единичных случаях. В результате повышения уровня гастрина при длительном лечении в единичных случаях наблюдали небольшое или умеренное увеличение количества специфических эндокринных клеток в желудке (аденоматоидная гиперплазия). Тем не менее, согласно недавно проведенным исследованиям, возникновения предшественников злокачественных образований (атипичная гиперплазия) или злокачественных заболеваний желудка, как было показано в экспериментах на животных, у человека обнаружено не было.

Показания к применению

- кратковременное лечение рефлюксных симптомов, таких как изжога, отрыжка кислым

Способ применения и дозы

Кишечнорастворимые таблетки Контролок Контрол 20 мг не следует жевать или раскусывать, они должны проглатываться целиком и запиваться достаточным количеством жидкости. Прием препарата необходимо осуществлять перед едой.

Рекомендуемая суточная доза кишечнорастворимых таблеток Контролок Контрол составляет 20 мг в день

Для купирования симптомов может быть необходимо, принимать препарат в течение 2 – 3 дней. После полного исчезновения симптомов лечение должно быть прекращено. Лечение не должно превышать 4-х недель без консультации с врачом. Если улучшения не наблюдается в течение 2 недель непрерывного лечения, пациенту необходимо обратиться к врачу.

Особые группы пациентов

Печеночная недостаточность

У пациентов с тяжелыми нарушениями функции печени суточную дозу 20 мг пантопразола увеличивать не следует.

Для пациентов пожилого возраста и пациентов с нарушением функции почек специального подбора дозы препарата не требуется.

Контроль Контрол не рекомендуется для применения у детей и подростков, не достигших 18-летнего возраста из-за недостаточных данных о безопасности и эффективности.

Побочные действия

Ниже перечислены наблюдавшиеся побочные 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).

Нечасто

- головная боль, головокружение
- сухость во рту, тошнота, рвота, вздутие живота, абдоминальная боль и дискомфорт, диарея, запор
- кожная сыпь, зуд, экзантема
- астения, утомляемость и недомогание
- повышение активности печеночных ферментов (трансаминаз, γ -GT)
- нарушение сна

Редко

- агранулоцитоз
- повышенная чувствительность к активному и вспомогательным компонентам препарата (включая анафилактические реакции и анафилактический шок)
- гиперлипидемия, повышение уровня триглицеридов, холестерина
- повышение содержания билирубина
- изменение веса, нарушение вкуса
- депрессия (и все сопутствующие ухудшения)
- нарушение зрения / нечеткость зрения
- крапивница, ангионевротический отек
- артралгия, миалгия
- гинекомастия
- повышение температуры тела, периферические отеки

Очень редко

- тромбоцитопения, лейкопения, панцитопения
- дезориентация (и все сопутствующие ухудшения)

Неизвестно

- гипонатриемия, гипомагниемия
- галлюцинации, спутанность сознания (особенно у предрасположенных к этим состояниям больных, а также ухудшение этих симптомов, если они существовали до начала лечения)
- гепатоцеллюлярные повреждения, желтуха, гепатоцеллюлярная недостаточность
- синдром Стивенса-Джонсона, синдром Лайелла, экссудативная многоформная эритема, светочувствительность
- интерстициальный нефрит
- подострая кожная красная волчанка

Противопоказания

- гиперчувствительность к компонентам препарата
- совместное применение пантопразола с атазанавиром

Лекарственные взаимодействия

Следует обратить внимание на одновременный прием с препаратами, всасывание которых является рН-зависимым, например кетоконазолом, итраконазолом, позаконазолом, эрлотинибом, в том числе с препаратами, назначавшимися незадолго до курса лечения Контролок Контролом, ввиду изменения абсорбции данных препаратов.

Одновременный прием Контролок Контрола и атазанавира значительно снижает эффективность последнего.

При совместном применении фенпрокумона или варфарина, было отмечено несколько единичных случаев изменения Международного нормализационного отношения (МНО или INR). Поэтому для больных, проходящих лечение кумариновыми антикоагулянтами (например, фенпрокумоном или варфарином), рекомендуется следить за протромбиновым временем/МНО после начала, окончания или во время нерегулярного применения Контролок Контрола.

Контролок Контрол обладает низким потенциалом взаимодействия с системой цитохрома P450. Поэтому риск побочных реакций, вызванных взаимодействием Контролок Контрола с другими препаратами, метаболизирующимся системой цитохром P450, может считаться минимальным. Специальные исследования не выявили клинически значимого взаимодействия препарата Контролок Контрол с кофеином, карбамазепином, диазепамом, этанолом, диклофенаком, глибенкламидом, напроксеном, метопрололом, нифедипином, фенитоином, пироксикамом, теофиллином, оральными контрацептивами, содержащими левоноргестрел и этинилэстрадиол.

При одновременном приеме с антибиотиками, такими как кларитромицин, амоксициллин, с метронидазолом, взаимодействия не выявлено.

Взаимодействия с антацидами при одновременном приеме не выявлено.

Особые указания

У пациентов с тяжелыми нарушениями функции печени при приеме препарата Контролок Контрол, особенно в течении длительного периода, рекомендуется проводить регулярный контроль уровня ферментов печени. При увеличении уровня печеночных ферментов следует прекратить применение препарата.

Пациентам, нуждающимся в продолжительном лечении неспецифическими нестероидными противовоспалительными (НПВП) препаратами и находящимися в группе повышенного риска развития желудочно-кишечных осложнений, прием препарата Контролок Контрол 20 мг как превентивной меры образования язвы желудка и двенадцатиперстной кишки, вызванной применением НПВП, следует ограничить.

Больные должны проконсультироваться с врачом в следующих случаях:

- если симптоматика не прошла в течение 2-х недель после непрерывной терапии
- непроизвольное снижение веса тела, анемия, желудочно-кишечное кровотечение, дисфагия, стойкая рвота или рвота с кровью, в этих случаях, следует исключать наличие злокачественного процесса
- ранее была язва желудка, или перенесенная хирургическая операция на желудке
- нарушения пищеварения или изжога в течение 4 или более недель
- желтуха, нарушения функции или заболевания печени
- любое другое серьезное заболевание, влияющее на общее самочувствие
- пациенты старше 55 лет при наличии новых или недавно изменившихся симптомов.

Контролок Контрол, как все препараты, блокирующие секрецию кислоты в желудке, может уменьшить всасывание витамина В12 (цианокобаламина) вследствие гипо- или ахлогидрии. Это следует учитывать при наличии соответствующих клинических симптомов.

При продолжительном периоде приема препарата, особенно свыше 1 года, пациенты должны находиться под регулярным наблюдением.

Понижение кислотности желудка повышает количество желудочных бактерий, которые обычно присутствуют в желудочно-кишечном тракте. Лечение препаратами, понижающими кислотность, приводит к повышению риска развития желудочно-кишечных инфекций, вызываемых такими микроорганизмами, как *Salmonella*, *Campylobacter*.

Подострая системная красная волчанка (СКВ)

Ингибиторы протонной помпы в очень редких случаях связаны с подострой СКВ. Пациент немедленно должен обратиться за медицинской помощью в случае, если происходит повреждение, особенно на незащищенных от солнечных лучей участках кожи, и если они сопровождаются артралгией. Подострая СКВ после предыдущего лечения с ингибитором протонного насоса может повысить риск подострой СКВ с другими ингибиторами протонного насоса.

Применение в педиатрии

Из-за недостаточного количества данных по безопасности и эффективности, не рекомендуется применение препарата Контролок Контрол у детей и подростков до 18 лет.

Беременность и лактация

Адекватных данных об использовании пантопразола при беременности нет. Исследования на животных свидетельствуют о репродуктивной токсичности препарата. Потенциальный риск для человека неизвестен. Контролок Контрол не должен применяться во время беременности, если в этом нет очевидной необходимости.

Лактацию на период лечения препаратом прекращают.

Особенности влияния лекарственного средства на способность управлять транспортным средством или потенциально опасными механизмами.

Контролок Контрол 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.

Передозировка

Симптомы: неизвестны

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

Форма выпуска и упаковка

По 14 таблеток помещают в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой.

По 1 или 2 контурные упаковки вместе с инструкцией по медицинскому применению на государственном и русском языках вкладывают в пачку картонную.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25°C.

Хранить в недоступном для детей месте!

Срок хранения

3 года

Не использовать по истечении срока годности.

Условия отпуска из аптек

Без рецепта

Производитель

Такеда ГмбХ, Ораниенбург, Германия

Ленинштрассе 70-98, 16515 Ораниенбург, Германия/

Lehnitzstrasse 70-98, 16515 Oranienburg, Germany

Наименование и страна владельца регистрационного удостоверения

Такеда ГмбХ, Германия

Бик-Гульден-Штрассе 2, Д-78467 Констанц, Германия/

Byk-Gulden-Strasse 2, D-78467 Konstanz, Germany

Наименование и страна организации-упаковщика

Такеда ГмбХ, Ораниенбург, Германия

Леницштрассе 70-98, 16515 Ораниенбург, Германия/

Lehnitzstrasse 70-98, 16515 Oranienburg, Germany

Адрес организации, принимающей на территории Республики Казахстан претензии от потребителей по качеству лекарственных средств за пострегистрационное наблюдение за безопасностью лекарственного средства

ТОО «Такеда Казахстан»

г. Алматы, ул. Шашкина 44

Номер телефона (727) 2444004

Номер факса (727) 2444005

Адрес электронной почты DSO-KZ@takeda.com