

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

КОНТРОЛОК®

Регистрационный номер:

Торговое название: Контролок®

Международное непатентованное название (МНН): пантопразол

Лекарственная форма: порошок для приготовления раствора для внутривенного введения

Состав

Состав на 1 флакон

Активное вещество: пантопразола натрия сесквигидрат 45,1 мг

соответствует: пантопразолу натрия (ангидрид) 42,3 мг

и пантопразолу (свободная кислота) 40,0 мг

Вспомогательные вещества: динатрия эдетат 1,0 мг; натрия гидроксид 0,24 мг;

Описание

Белая или почти белая сухая субстанция.

Фармакотерапевтическая группа: желез желудка секрецию понижающее средство - протонного насоса ингибитор

Код АТХ: А02ВС02

Фармакологическое действие

Ингибитор протонного насоса (H⁺ K⁺ АТФ-азы). Блокирует заключительную стадию секреции соляной кислоты, снижая базальную и стимулированную секрецию, независимо от природы раздражителя.

По сравнению с другими ингибиторами протонного насоса пантопразол имеет большую химическую стабильность при нейтральном рН и меньший потенциал взаимодействия с оксидазной системой печени, зависящей от цитохрома Р450. Поэтому не наблюдалось

клинически значимого взаимодействия между препаратом Контролок® и многими другими препаратами.

Фармакокинетика

Объем распределения составляет 0,15 л/кг, клиренс – 0,1 л/ч/кг.

Период полувыведения препарата – 1 ч.

Было отмечено несколько случаев замедленной элиминации.

Фармакокинетика одинакова как после однократного, так и после многократного применения препарата. В диапазоне доз от 10 мг до 80 мг кинетическая прямая концентрации пантопразола в плазме крови имеет линейную зависимость как после перорального, так и после внутривенного применения.

Связывание пантопразола с белками плазмы крови составляет 98%. Метаболизируется в печени. Основной путь выведения – через почки (около 80%) в виде метаболитов пантопразола, в небольшом количестве выводится через кишечник. Основным метаболитом в плазме крови и в моче является десметилпантопразол, конъюгирующий с сульфатом. Период полувыведения метаболита – около 1,5 ч.

При применении пантопразола у пациентов с нарушением функции почек (включая пациентов, находящихся на гемодиализе) снижения дозы не требуется. Как и у пациентов с нормальной функцией почек, период полувыведения пантопразола является коротким. Диализируется только очень небольшая часть препарата. Не аккумулирует.

У пациентов с циррозом печени (классов А и В по классификации Чайлд-Пью) значение периода полувыведения увеличивается до 7 – 9 ч. Показатель АUC увеличивается в 5 – 7 раз. C_{\max} увеличивается в 1,5 раза по сравнению с пациентами с нормальной функцией печени.

Небольшое повышение показателя АUC и C_{\max} у пожилых людей не является клинически значимым.

Показания к применению

- язвенная болезнь желудка и 12-перстной кишки (в фазе обострения), эрозивный гастрит (в том числе связанные с приемом нестероидных противовоспалительных препаратов НПВП);
- гастроэзофагеальная рефлюксная болезнь (ГЭРБ): эрозивный рефлюкс-эзофагит (лечение), симптоматическое лечение ГЭРБ (т.е. НЭРБ – неэрозивная рефлюксная болезнь);
- синдром Золлингера-Эллисона;

- эрадикация *Helicobacter pylori* в комбинации с антибактериальными средствами;
- лечение и профилактика стрессовых язв, а также их осложнений (кровотечение, перфорация, пенетрация).

Противопоказания к применению

- повышенная чувствительность к любому из компонентов препарата.
- совместное применение с атазановиром.
- возраст до 18 лет.
- беременность, период лактации.

Способ применения и дозы

Внутривенное введение препарата должно осуществляться медицинским персоналом.

Внутривенное применение препарата Контролок® рекомендовано в случаях, когда невозможен пероральный прием препарата и сроком не более 7 дней. При возникновении у пациента возможности перорального приема, внутривенное введение следует заменить приемом препарата Контролок® таблетки покрытые кишечнорастворимой оболочкой.

Язвенная болезнь желудка и 12-перстной кишки (в фазе обострения), эрозивный гастрит (в том числе связанные с приемом нестероидных противовоспалительных препаратов НПВП). Гастроэзофагеальная рефлюксная болезнь (ГЭРБ).

Рекомендованной суточной дозой является 40 мг (1 флакон) в сутки.

Синдром Золлингера-Эллисона.

При длительном лечении синдрома Золингера-Эллисона и других патологических гиперсекреторных состояний рекомендованная суточная доза в начале лечения составляет 80 мг препарата Контролок® внутривенно. После этого доза может быть увеличена или уменьшена. В случае применения препарата в суточной дозе свыше 80 мг, доза должна быть разделена и вводиться дважды в день. Возможно временное увеличение суточной дозы до 160 мг, но не дольше чем необходимо для адекватного контроля кислотности.

При необходимости экстренного контроля кислотности, начальная доза дважды по 80 мг, достаточна для снижения кислотного выброса в диапазоне менее 10 мЭкв/ч в течение 1 часа у большинства пациентов.

Лечение и профилактика стрессовых язв, а также их осложнений (кровотечение, перфорация, пенетрация).

Рекомендованной суточной дозой является 80 мг в сутки. В случае применения препарата в суточной дозе свыше 80 мг, доза должна быть разделена и вводиться дважды в день. Возможно временное увеличение суточной дозы до 160 мг.

Для приготовления готового к употреблению раствора для инъекций 10 мл 0,9% раствора натрия хлорида добавляют во флакон, содержащий сухое вещество. Готовый раствор может быть введен в количестве 10 мл, также допустимо разведение его в 100 мл 0,9% растворе натрия хлорида или в 5% растворе глюкозы.

Не использовать другие растворители!

Введение препарата следует производить в течение 2-15 минут.

Приготовленный раствор стабилен в течение 12 часов после приготовления. Однако рекомендуется использовать раствор немедленно после приготовления во избежание микробной контаминации.

У пациентов с выраженными нарушениями функции печени суточная доза не должна превышать 20 мг пантопразола (половина флакона).

Коррекции дозы у пожилых пациентов и пациентов с нарушением функции почек не требуется, однако не следует превышать рекомендованную суточную дозу пантопразола 40 мг.

Побочное действие

При приеме препарата Контролок® в соответствии с показаниями и в рекомендованных дозах побочные явления возникают крайне редко. Наиболее частой нежелательной побочной реакцией является тромбоз в месте введения препарата. Диарея и головная боль наблюдаются примерно у 1% пациентов.

Ниже приводятся данные о нежелательных побочных реакциях в зависимости от частоты их возникновения:

Очень часто $\geq 1/10$

Часто $\geq 1/100$ и $< 1/10$

Нечасто $\geq 1/1000$ и $< 1/100$

Редко $\geq 1/10000$ и $< 1/1000$

Очень редко $< 1/10000$, включая отдельные случаи

Частота неизвестна (невозможно оценить на основании имеющихся данных).

Нарушения со стороны кровеносной и лимфатической системы:

Редко:

Агранулоцитоз.

Очень редко:

Тромбоцитопения, лейкопения, панцитопения.

Нарушения со стороны нервной системы:

Нечасто:

Головная боль, головокружение.

Редко:

Дисгевзия.

Нарушения со стороны органов зрения:

Редко:

Нарушение зрения (затуманивание).

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта:

Нечасто:

Диарея, тошнота/рвота, вздутие живота и метеоризм, запор, сухость во рту, дискомфорт и боли в животе.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей:

Частота неизвестна:

Интерстициальный нефрит.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей:

Нечасто:

Экзантема/сыпь, зуд.

Редко:

Крапивница, ангионевротический отек.

Частота неизвестна:

злокачественная экссудативная эритема (синдром Стивенса – Джонсона), экссудативная многоформная эритема, токсический эпидермальный некролиз, светочувствительность.

Нарушения со стороны скелетно-мышечной и соединительной ткани:

Редко:

Артралгия, миалгия.

Нарушения со стороны обмена веществ:

Редко:

Гиперлипидемия и повышенная концентрация липидов (триглицеридов, холестерина), изменение массы тела.

Частота неизвестна:

Гипонатриемия, гипомагниемия.

Общие расстройства:

Часто:

Тромбофлебит в месте введения.

Нечасто:

Слабость, утомляемость и недомогание.

Редко:

Повышение температуры тела, периферические отеки.

Нарушения со стороны иммунной системы:

Редко:

Гиперчувствительность (в том числе анафилактические реакции и анафилактический шок).

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей:

Нечасто:

Повышение активности печеночных ферментов (аспартатаминотрансферазы, γ -глутаминтрансферазы).

Редко:

Повышение уровня билирубина.

Частота неизвестна:

Гепатоцеллюлярные повреждения, желтуха.

Нарушения со стороны половых органов и молочной железы:

Редко:

Гинекомастия.

Нарушения со стороны психики:

Нечасто:

Нарушение сна.

Редко:

Депрессия (включая обострения имеющихся расстройств).

Очень редко:

Дезориентация (включая обострения имеющихся расстройств).

Частота неизвестна:

Галлюцинации, спутанность сознания (в особенности у предрасположенных к этому пациентов), а также возможное обострение симптомов при их существовании до начала терапии.

Передозировка.

До настоящего времени явлений передозировки в результате применения препарата Контролок® отмечено не было. Дозы до 240 мг вводились внутривенно в течение 2 минут и переносились хорошо.

Тем не менее, в случае передозировки и только при наличии клинических проявлений проводится симптоматическая и поддерживающая терапия.

Пантопразол не выводится посредством гемодиализа.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

Одновременное применение препарата Контролок® может уменьшить всасывание препаратов, биодоступность которых зависит от pH среды желудка (например, кетоконазол, интраконазол, позаконазол и таких как эрлотиниб). Препарат Контролок® может быть назначен без риска негативного лекарственного взаимодействия:

- пациентам с заболеваниями сердечно-сосудистой системы, принимающим сердечные гликозиды (дигоксин), блокаторы медленных кальциевых каналов (нифедипин), бета-адреноблокаторы (метопролол);
- пациентам с заболеваниями желудочно-кишечного тракта, принимающим антациды, антибиотики (амоксициллин, кларитромицин, метронидазол);
- пациентам, принимающим пероральные контрацептивы, содержащие левоноргестрел и этинилэстрадиол;
- пациентам, принимающим нестероидные противовоспалительные препараты (диклофенак, напроксен, пироксикам);
- пациентам с заболеваниями эндокринной системы, принимающим глибенкламид;
- пациентам с тревожными состояниями и расстройствами сна, принимающим диазепам;
- пациентам с эпилепсией, принимающим карбамазепин и фенитоин;
- пациентам, принимающим непрямые антикоагулянты, такие как варфарин и фенпрокумон, под контролем протромбинового времени и МНО в начале и по окончании лечения, а также во время нерегулярного приема пантопразола;

Также отмечено отсутствие клинически значимого лекарственного взаимодействия с кофеином, этанолом, теофиллином.

Особые указания

Применение пантопразола не показано для лечения легких жалоб со стороны ЖКТ, таких как диспепсия неврогенного генеза.

Пациенты должны проконсультироваться с врачом при возникновении следующих симптомов:

- значимая непреднамеренная потеря веса,

- периодическая рвота,
- расстройство глотания,
- желудочно-кишечное кровотечение,
- анемия или мелена.

При подозрении или наличии язвы желудка перед началом лечения пантопразолом следует исключить возможность злокачественного новообразования, поскольку препарат может маскировать симптомы и отсрочить правильную постановку диагноза.

Если симптомы сохраняются, несмотря на адекватное лечение, то следует провести дальнейшее обследование.

У пациентов с выраженными нарушениями функции печени необходимо контролировать биохимические показатели крови. При увеличении активности печеночных ферментов следует прекратить применение препарата.

При приеме препаратов, снижающих кислотность желудочного сока, незначительно повышается риск желудочно-кишечных инфекций, возбудителями которых являются бактерии рода *Salmonella spp.*, *Campylobacter spp.*

Влияние на способность управления транспортными средствами/механизмами.

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

Форма выпуска

Порошок для приготовления раствора для внутривенного введения 40 мг.

По 40 мг пантопразола во флаконах прозрачного стекла, укупоренных резиновой пробкой и обжатых колпачком алюминиевым с диском из полипропилена серого цвета.

По 1 флакону помещают в картонную пачку с инструкцией по применению.

Срок годности

2 года.

Не использовать после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия хранения

В защищенном от света месте.

При температуре не выше 25°C.

Хранить в недоступном для детей месте.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Производитель/Владелец регистрационного удостоверения:

Никомед ГмбХ, Германия

Nucomed GmbH, Germany

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

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

Адрес производственной площадки:

Никомед ГмбХ, Германия

Nucomed GmbH, Germany

Роберт-Босш-Штрассе 8, Д-78224, Зинген, Германия

Robert-Bosch-Str. 8, D-78224, Singen, Germany

Претензии потребителей направлять по адресу:

ООО «Никомед Дистрибьюшн Сентэ»

119048, Москва, ул. Усачева, д. 2, стр. 1

Телефон: (495) 933-55-11

Факс: (495) 502-16-25

Электронная почта: russia@takeda.com

Адрес в интернете: www.nucomed.ru

Директор по вопросам медицины,
регистрации и фармакобезопасности
ООО «Никомед Дистрибьюшн Сентэ»



О.М. Супряга

МИНЗДРАВ РОССИИ
АСР-004368/08-301112
СОГЛАСОВАНО

МЗРО
ЭКСПЕРТНЫЙ ОТЧЕТ
ДЕЙСТВИТЕЛЕН ДЛЯ ДАННОЙ
ВЕРСИИ ДОКУМЕНТА
000000008