

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

КОНТРОЛОК®

Регистрационный номер: П N011341/01

Торговое название: Контролок®

Международное непатентованное название (МНН): пантопразол

Лекарственная форма: таблетки покрытые кишечнорастворимой оболочкой

Состав

Состав на одну таблетку 40 мг

Ядро

Активное вещество: пантопразола натрия оксалигидрат 45,10 мг, соответствует пантопразолу 40,00 мг

Вспомогательные вещества: натрия карбонат безводный 10,00 мг; маннитол 42,70 мг; кросповидон 50,00 мг; повидон K90 4,00 мг; кальция стеарат 3,20 мг; вода очищенная 9,00 мг;

Оболочка

гипромеллоза-2910 19,00 мг, повидон K25 0,38 мг, титана диоксид E171 0,34 мг, краситель железа оксид желтый E172 0,03 мг; пропиленгликоль 4,25 мг; эудрагит L 30D-55* 14,56 мг; триэтилцитрат 1,45 мг.

* Состав дисперсии Эудрагита L 30D-55: эудрагит L 30D-55 (Метакриловой кислоты и этилакрилата сополимер [1:1]) 14,13 мг; полисорбат 80 0,33 мг; натрия лаурилсульфат 0,10 мг;

Коричневые чернила Oрасode S-1-16530 для нанесения маркировки на таблетки: шеллак (shellac) 0,036 мг; краситель железа оксид красный (E172) 0,009 мг; краситель железа оксид черный (E172) 0,009 мг; краситель железа оксид желтый (E172) 0,0009 мг; аммиака раствор концентрированный 25 % 0,009 мг;

Описание

Овальные двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой желтого цвета с ядром от белого до почти белого цвета. На одной стороне таблетки коричневыми чернилами напечатано: «P40».

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

Код АТХ: A02BC02

Фармакологическое действиеИнгибитор протонного насоса (H⁺ K⁺ АТФ-азы). Блокирует заключительную стадию секреции соляной кислоты, снижая базальную и стимулированную секрецию, независимо от природы раздражителя.**Антисекреторная активность.** После первого перорального приема 20 мг препарата Контролок® снижение секреции желудочного сока на 24% наступает через 2,5-3,5 ч и на 26% через 24,5-25,5 ч. После перорального приема однократно в сутки в течение 7 дней антисекреторная активность возрастает до 56% через 2,5-3,5 ч и до 50% через 24,5-25,5 ч. При язвенной болезни двенадцатиперстной кишки, ассоциированной с *Helicobacter pylori*, снижение желудочной секреции повышает чувствительность микроорганизмов к антибиотикам. Не влияет на моторику желудочно-кишечного тракта. Секреторная активность нормализуется через 3-4 дня после окончания приема.

По сравнению с другими ингибиторами протонного насоса Контролок® имеет большую химическую стабильность при нейтральном pH, и меньший потенциал взаимодействия с оксидантной системой печени, зависящей от цитохрома P450. Поэтому не наблюдалось клинически значимого взаимодействия между препаратом Контролок® и многими другими препаратами.

ФармакокинетикаПантопразол быстро всасывается после приема внутрь. Максимальная концентрация в плазме крови (C_{max}) при пероральном применении достигается уже после первой дозы в 40 мг. В среднем, C_{max} равная 1,0 – 1,5 мкг/мл достигается через 2,0 – 3,0 мкг/мл через 2,5 ч для дозировки 40 мг. Данный показатель остается постоянным после многократного применения данного препарата.

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

Период полувыведения препарата – 1 ч.

Фармакокинетика одинакова как после однократного, так и после многократного применения препарата.

Связывание пантопразола с белками плазмы крови составляет 98%. Метаболизируется в печени. Основным путем 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.

Абсолютная биодоступность таблеток пантопразола - 77%. Одновременное применение их с пищей не влияет на площадь под

кривой «концентрация-время» (AUC) и C_{max}.

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

У пациентов с циррозом печени (классов А, В и С по классификации Чайлд-Пью) значение периода полувыведения увеличивается до 7-9 ч при применении пантопразола в дозировке 40 мг. Показатель AUC увеличивается в 5-7 раз для дозировки 40 мг. C_{max} увеличивается в 1,5 раза для дозировки 40 мг по сравнению со здоровыми пациентами. Небольшое повышение показателя AUC и C_{max} у пожилых людей не является клинически значимым.**Показания к применению**

- язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки (в фазе обострения); эрозивный гастрит (в том числе связанный с приемом нестероидных противовоспалительных препаратов НПВП);
- синдром Золлингера-Эллисона;
- эрадикация *Helicobacter pylori* в комбинации с антибактериальными средствами;

Противопоказания

- повышенная чувствительность к любому из компонентов препарата, а также к соев.
- диспепсия невротического генеза.
- совместное применение с атазановиром.
- возраст до 18 лет.
- беременность, период лактации.

Способ применения и дозы

Контролок® принимают внутрь, до еды, не разжевывая и не измельчая, запивая достаточным количеством жидкости.

Язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, эрозивный гастрит (в том числе, связанные с приемом нестероидных противовоспалительных препаратов НПВП).

По 40-80 мг в сутки.

Курс лечения - 2 недели при обострении язвенной болезни двенадцатиперстной кишки и 4-8 недель при обострении язвенной болезни желудка.

Противорецидивное лечение язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки - по 20 мг в сутки.

Эрадикация *Helicobacter pylori*.

Рекомендованы следующие комбинации:

1. Контролок® по 20-40 мг 2 раза в сутки + амоксициллин по 1000 мг 2 раза в сутки + кларитромицин по 500 мг 2 раза в сутки
2. Контролок® по 20-40 мг 2 раза в сутки + метронидазол по 500 мг 2 раза в сутки + кларитромицин по 500 мг 2 раза в сутки
3. Контролок® по 20-40 мг 2 раза в сутки + амоксициллин по 1000 мг 2 раза в сутки + метронидазол по 500 мг 2 раза в сутки.

Курс лечения - 7-14 дней.

Синдром Золлингера-Эллисона.

По 40-80 мг в сутки.

У пациентов с выраженными нарушениями функции печени дозу следует уменьшить до 40 мг 1 раз в 2 дня. В этом случае необходимо контролировать биохимические показатели крови. При увеличении активности печеночных ферментов следует прекратить применение препарата.

Коррекции дозы у пожилых пациентов, а также у пациентов с нарушением функции почек и печени не требуется, но нельзя превышать суточную дозу 40 мг. Исключением является применение комбинированной антимикробной терапии в отношении *Helicobacter pylori*, когда и пожилые пациенты должны применять Контролок® 40 мг 2 раза в сутки. Не следует принимать Контролок® в целях профилактики.**Побочное действие**

При приеме препарата Контролок® в соответствии с показаниями и в рекомендуемых дозах побочные явления возникают крайне редко. Наиболее частыми нежелательными побочными реакциями являются диарея и головная боль - наблюдаются примерно у 1% пациентов. Ниже приводятся данные о нежелательных побочных реакциях в зависимости от частоты их возникновения:

Очень часто	≥ 1/10
Часто	≥ 1/100 и < 1/10
Нечасто	≥ 1/1000 и < 1/100
Редко	≥ 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, 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, гипомалиемия.

Общие расстройства:

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: Деориентация (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. Пантопрозол не выводится посредством гемодиализа.

Взаимодействие с другими лекарственными веществами

Не рекомендуется одновременное применение других ингибиторов протонного насоса или блокаторов H_2 -гистаминовых рецепторов без консультации врача.

Одновременное применение препарата Контролок[®] может уменьшить всасывание препаратов, чья биодоступность зависит от pH среды желудка (например, соли железа, кетоконазол).

Контролок[®] может быть назначен без риска 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 (амоксциллин, кларитромицин);
- пациентам, принимающим пероральные контрацептивы, содержащие левоноргестрел и этинилэстрадиол;
- пациентам, принимающим нестероидные противовоспалительные препараты (диклофенак, феназон, напроксен, пироксикам);
- пациентам с заболеваниями эндокринной системы, принимающим глибенкламид, левотироксин;

- 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 пантопрозола;
 - пациентам, перенесшим трансплантацию, принимающим циклоспорин, такролимус.
- Также отмечено отсутствие клинически значимого лекарственного взаимодействия с кофеином, этанолом, теофиллином.

Особые указания

Перед началом лечения препаратом Контролок[®] следует исключить возможность злокачественного новообразования, поскольку препарат может маскировать симптомы и отсрочить правильную постановку диагноза.

Пациенты должны проконсультироваться с врачом, если им предстоит проведение эндоскопии или мочевинового дыхательного теста.

Пациенты должны проконсультироваться с врачом, если имеются следующие случаи:

- непреднамеренная потеря веса, анемия, желудочно-кишечное кровотечение, расстройство глотания, постоянная рвота или рвота с кровью. В этих случаях прием препарата может частично облегчить симптомы и отсрочить правильную диагностику;
- ранее перенесенное хирургическое вмешательство на желудочно-кишечном тракте или язва желудка;
- непрерывное симптоматическое лечение диспепсии и изжоги в течение 4 недель и более;
- заболевания печени, в том числе желтуха и печеночная недостаточность;
- другие серьезные заболевания, ухудшающие общее состояние здоровья;

Пациенты в возрасте старше 55 лет, при наличии новых или недавно изменившихся симптомов, должны проконсультироваться с врачом.

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

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

Таблетки покрытые кишечнорастворимой оболочкой 40 мг.

По 14 таблеток в блистер Алюминий ПВХ/Алюминий ПВХ. 1 или 2 блистера вместе с инструкцией по применению в пачку картонную.

По 7 таблеток в блистере, вложенном в складывающуюся картонную обложку. По 1 или 4 картонных обложки вместе с инструкцией по применению помещают в пачку картонную.

Срок годности

3 года.

Не использовать после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия хранения

При температуре не выше 25°C.

Хранить в недоступном для детей месте.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Производитель/Владелец регистрационного удостоверения:

Такеда ГмБХ, Германия

Takeda GmbH, Germany

Бих-Гульден-Штрассе 2, D-78467 Констанц, Германия

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

Адрес производственной площадки:

Такеда ГмБХ, Германия

Takeda GmbH, Germany

Леницштрассе 70-98, 16515 Ораниенбург, Германия

Lehnitzstraße 70-98, 16515 Oranienburg, Germany

Претензии потребителей направлять по адресу:

ООО «Такеда Фармасьютикалс»

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.takeda.com.ru