

КОНТРОЛОК® (CONTROLOC®)

PANTOPRAZOLE

зарегистрировано и произведено
TAKEDA GmbH (Германия)**ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА, СОСТАВ И УПАКОВКА**

✧ **Таблетки, покрытые кишечнорастворимой оболочкой**, овальные, двояковыпуклые, покрытые пленочной оболочкой желтого цвета, с ядром от белого до почти белого цвета; на одной стороне таблетки коричневыми чернилами напечатано "P20".

1 таб.

пантопразола натрия сесквигидрат 22.57 мг,

что соответствует содержанию пантопразола..... 20 мг

Вспомогательные вещества: натрия карбонат безводный – 5 мг, маннитол – 21.33 мг, кросповидон – 25 мг, повидон K90 – 2 мг, кальция стеарат – 1.6 мг, вода очищенная – 4.5 мг.

Состав оболочки: гипромеллоза 2910 – 11.88 мг, повидон K25 – 0.24 мг, титана диоксид (E171) – 0.21 мг, краситель железа оксид желтый (E172) – 0.02 мг, пропиленгликоль – 2.66 мг, эудрагит L 30D-55* – 8.18 мг, триэтилцитрат – 0.82 мг.

* Состав дисперсии Эудрагита L 30D-55: эудрагит L 30D-55 (Метакриловой кислоты и этилакрилата сополимер [1:1]) – 7.94 мг, полисорбат 80 – 0.18 мг, натрия лаурилсульфат – 0.06 мг.

Состав коричневых чернил Opacode 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% – 0.001 мг.

7 шт. – блистеры (1) – обложки картонные складывающиеся (1) – пачки картонные.

14 шт. – блистеры (1) – пачки картонные.

Таблетки, покрытые кишечнорастворимой оболочкой, овальные, двояковыпуклые, покрытые пленочной оболочкой желтого цвета, с ядром от белого до почти белого цвета; на одной стороне таблетки коричневыми чернилами напечатано "P40".

1 таб.

пантопразола натрия сесквигидрат 45.1 мг,

что соответствует содержанию пантопразола..... 40 мг

Вспомогательные вещества: натрия карбонат безводный – 10 мг, маннитол – 42.7 мг, кросповидон – 50 мг, повидон K90 – 4 мг, кальция стеарат – 3.2 мг, вода очищенная – 9 мг.

Состав оболочки: гипромеллоза 2910 – 19 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 – 0.1 мг.

Состав коричневых чернил Opacode 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% – 0.001 мг.

7 шт. – блистеры (1) – обложки картонные складывающиеся (1) – пачки картонные.

7 шт. – блистеры (1) – обложки картонные складывающиеся (4) – пачки картонные.

14 шт. – блистеры (1) – пачки картонные.

14 шт. – блистеры (2) – пачки картонные.

Номер и дата регистрации: П N011341/01 от 28.04.08**Код АТХ:** A02BC02**Клинико-фармакологическая группа:**Ингибитор H⁺-K⁺-АТФ-азы. Противоязвенный препарат**ФАРМАКОЛОГИЧЕСКОЕ ДЕЙСТВИЕ**

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

Антисекреторная активность. После приема внутрь препарата Контролок® в дозе 20 мг снижение секреции желудочного сока на 24% наступает через 2.5-3.5 ч и на 26% через 24.5-25.5 ч. После приема 1 раз/сут 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 ЖКТ. Секреторная активность нормализуется через 3-4 дня после окончания применения.

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

ФАРМАКОКИНЕТИКА

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

Всасывание

Пантопразол быстро всасывается после приема внутрь. C_{\max} в плазме крови при пероральном применении достигается уже после первой дозы в 20 мг или 40 мг. В среднем C_{\max} составляет 1.0-1.5 мкг/мл и достигается через 2-2.5 ч при дозе 20 мг и 2.0-3.0 мкг/мл – через 2.5 ч при дозе 40 мг. Данный показатель остается постоянным после многократного применения данного препарата. Абсолютная биодоступность таблеток пантопразола – 77%. Одновременное применение таблеток пантопразола с пищей не влияет на AUC и C_{\max} .

Распределение

Связывание пантопразола с белками плазмы крови составляет 98%. V_d составляет 0.15 л/кг.

Метаболизм

Метаболизируется в печени. Основным метаболитом в плазме крови и в моче является десметилпантопразол, конъюгирующий с сульфатом.

Выведение

$T_{1/2}$ препарата – 1 ч. Клиренс – 0.1 л/ч/кг. Основной путь выведения – через почки (около 80%) в виде метаболитов пантопразола, в небольшом количестве выводится через кишечник.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

При применении пантопразола у пациентов с ограниченным функционированием почек (в т.ч. пациенты, находящиеся на гемодиализе) снижения дозы не требуется. Как и у здоровых пациентов, $T_{1/2}$ пантопразола является коротким. Диализируется только очень небольшая часть препарата. Кумуляции не происходит.

У пациентов с циррозом печени (классы А, В и С по классификации Чайлд-Пью) значение $T_{1/2}$ увеличивается до 3-6 ч при дозе 20 мг и до 7-9 ч при дозе 40 мг. Показатель AUC увеличивается в 3-5 раз (для дозы 20 мг) и в 5-7 раз (для дозы 40 мг).

C_{\max} увеличивается в 1.3 раза (для дозы 20 мг) и в 1.5 раза (для дозы 40 мг) по сравнению со здоровыми пациентами. Небольшое повышение показателя AUC и C_{\max} у пожилых людей не является клинически значимым.

ПОКАЗАНИЯ**Для таблеток 20 мг**

– лечение симптомов гастроэзофагеальной рефлюксной болезни легкой степени выраженности (таких как изжога, тошнота, кислая отрыжка) у взрослых.

Для таблеток 40 мг

- язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки (в фазе обострения), эрозивный гастрит (в т.ч. связанные с приемом НПВС);
- синдром Золлингера-Эллисона;
- эрадикация *Helicobacter pylori* в комбинации с антибактериальными средствами.

РЕЖИМ ДОЗИРОВАНИЯ

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

Таблетки 20 мг

Для лечения симптомов гастроэзофагеальной рефлюксной болезни легкой степени выраженности (таких как изжога, тошнота, кислая отрыжка) у **взрослых** назначают Контролок® по 20 мг/сут. Для достижения положительной динамики в устранении симптомов может потребоваться прием препарата в течение 2-3 дней, однако для полного устранения симптомов может потребоваться прием препарата в течение 7 дней. При ухудшении состояния в течение первых 3 дней лечения рекомендуется консультация специалиста.

Прием препарата следует прекратить сразу после исчезновения симптомов. Если в течение 2 недель непрерывного приема препарата положительная динамика отсутствует, пациент должен проконсультироваться с врачом.

Таблетки 40 мг

При лечении язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки, эрозивного гастрита (в т.ч. связанных с применением НПВС) препарат назначают в дозе 40-80 мг/сут.

Курс лечения составляет 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/сут.

Для эрадикации *Helicobacter pylori* рекомендованы следующие комбинации:

1. Контролок® по 20-40 мг 2 раза/сут + амоксициллин по 1000 мг 2 раза/сут + кларитромицин по 500 мг 2 раза/сут;
2. Контролок® по 20-40 мг 2 раза/сут + метронидазол по 500 мг 2 раза/сут + кларитромицин по 500 мг 2 раза/сут;
3. Контролок® по 20-40 мг 2 раза/сут + амоксициллин по 1000 мг 2 раза/сут + метронидазол по 500 мг 2 раза/сут.

Курс лечения – 7-14 дней.

При синдроме Золлингера-Эллисона Контролок® назначают в дозе 40-80 мг/сут.

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 уровня печеночных ферментов следует прекратить применение препарата.

Пациентам пожилого возраста, а также пациентам с нарушенной функцией почек коррекция дозы не требуется, но нельзя превышать дозу 40 мг/сут. Исключением является применение комбинированной антибактериальной

терапии в отношении *Helicobacter pylori*, когда и пожилые пациенты должны применять Контролок® в дозе 40 мг 2 раза/сут.

Не следует принимать Контролок® в целях профилактики.

ПОБОЧНОЕ ДЕЙСТВИЕ

При применении препарата Контролок® в соответствии с показаниями и в рекомендованных дозах побочные реакции возникают крайне редко. *Наиболее часто (около 1%)* наблюдаются диарея и головная боль.

Определение частоты побочных реакций: очень часто (>1/10), часто (>1/100 и < 1/10), нечасто (>1/1000 и < 1/100), редко (> 1/10 000 и < 1/1000), очень редко (< 1/10 000, включая отдельные случаи), частота неизвестна (невозможно оценить на основании имеющихся данных).

Со стороны системы кроветворения: редко – агранулоцитоз; очень редко – тромбоцитопения, лейкопения, панцитопения.

Со стороны нервной системы: нечасто – головная боль, головокружение; редко – дисгевзия.

Со стороны органа зрения: редко – нарушение зрения (затуманивание).

Со стороны ЖКТ: нечасто – диарея, тошнота/рвота, вздутие живота и метеоризм, запор, сухость во рту, боли в животе.

Со стороны печени и желчевыводящих путей: нечасто – повышение активности печеночных ферментов (АСТ, ГГТ); редко – повышение уровня билирубина; частота неизвестна – гепатоцеллюлярные повреждения, желтуха.

Со стороны мочевыделительной системы: частота неизвестна – интерстициальный нефрит.

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.

Со стороны костно-мышечной системы: редко – артралгия, миалгия.

Со стороны обмена веществ: редко – гиперлипидемия и повышенная концентрация липидов (триглицеридов, холестерина), изменение массы тела; частота неизвестна – гипонатриемия, гипомагниемия.

Со стороны иммунной системы: редко – гиперчувствительность (в т.ч. анафилактические реакции и анафилактический шок).

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.

Со стороны половых органов и молочной железы: редко – гинекомастия.

Общие расстройства: нечасто – слабость, утомляемость и недомогание; редко – повышение температуры тела, периферические отеки.

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

- диспепсия невротического генеза;
- совместное применение с атазанавиром;
- беременность;
- период лактации;
- возраст до 18 лет;
- повышенная чувствительность к компонентам препарата, а также к сое.

БЕРЕМЕННОСТЬ И ЛАКТАЦИЯ

Контролок® противопоказан при беременности и в период лактации.

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 в следующих случаях:

- 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 ЖКТ или язва желудка;
- непрерывное симптоматическое лечение диспепсии и изжоги в течение 4 недель и более;
- заболевания печени, в т.ч. 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 инфекций, возбудителями которых являются бактерии рода *Salmonella spp.*, *Campylobacter spp.* или *Clostridia difficile*.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Пациентам следует воздержаться от управления транспортными средствами и другими механизмами, требующими повышенного внимания, из-за вероятности головокружения и нарушения зрения.

ПЕРЕДОЗИРОВКА

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

Лечение: в случае передозировки и только при наличии клинических проявлений проводится симптоматическая и поддерживающая терапия. Пантопразол не выводится посредством гемодиализа.

ЛЕКАРСТВЕННОЕ ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ

Одновременное применение препарата Контролок® может уменьшить всасывание препаратов, биодоступность которых зависит от pH среды желудка (в т.ч. 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 ЖКТ, принимающим антациды, антибиотики (амоксциллин, кларитромицин);
- пациентам, принимающим пероральные контрацептивы, содержащие левоноргестрел и этинилэстрадиол;
- пациентам, принимающим НПВС (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 пантопразола);
- пациентам, перенесшим трансплантацию, принимающим циклоспорин, такролимус.

Отмечено отсутствие клинически значимого лекарственного взаимодействия с кофеином, этанолом, теофиллином.

УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ И СРОКИ ГОДНОСТИ

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°C. Срок годности – 3 года. Не использовать после истечения срока годности, указанного на упаковке.

УСЛОВИЯ ОТПУСКА ИЗ АПТЕК

Контролок® в форме таблеток 20 мг разрешен к применению в качестве средства безрецептурного отпуска.

Контролок® в форме таблеток 40 мг отпускается по рецепту.

Такеда Фармасьютикалс ООО
119048 Москва, Усачева ул. 2, стр. 1
Бизнес-Центр "Фьюжн Парк", эт. 5
Тел.: (495) 933-55-11; Факс: (495) 502-16-25