Контролок



Код АТХ:

- A02BC02

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Пантопразол

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

◊ ***Таблетки, покрытые кишечнорастворимой оболочкой***, овальные, двояковыпуклые таблетки, 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 - 5.00 мг, маннитол - 21.33 мг, кросповидон - 25.00 мг, повидон K90 - 2.00 мг, кальция стеарат - 1.60 мг, вода очищенная - 4.50 мг.

Состав оболочки: гипромелоза-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 L30D-55 - 8.18 мг (метакриловой кислоты и этилакрилата сополимер [1:1] - 7.94 мг, полисорбат 80 - 0.18 мг, натрия лаурилсульфат - 0.06 мг), триэтилцитрат - 0.82 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 таблетки, 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 - 10.00 мг, маннитол - 42.70 мг, кросповидон - 50.00 мг, повидон K90 - 4.00 мг, кальция стеарат - 3.20 мг, вода очищенная - 9.00 мг.

Состав оболочки: гипромелоза-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 L30D-55 - 14.56 мг (метакриловой кислоты и этилакрилата сополимер [1:1] - 14.13 мг, полисорбат 80 - 0.33 мг, натрия лаурилсульфат - 0.10 мг), триэтилцитрат - 1.45 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.

5 шт. - блистеры (1) - обложки картонные складывающиеся (3) - пачки картонные.
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.

Фармакотерапевтическая группа:

- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Ингибитор протонового 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 Контролок не взаимодействует со многими другими препаратами.

Фармакокинетика

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

Всасывание

После приема внутрь пантопразол быстро всасывается из ЖКТ. 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 - с мочой (около 80%) в виде метаболитов пантопразола, в небольшом количестве выводится с калом.

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 по шкале 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 к применению:

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

— 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.

Относится к болезням:

- Гастрит
- Изжога
- Отрыжка
- Тошнота
- Язвенная болезнь
- Язвенная болезнь желудка

Противопоказания:

— диспепсия невротического генеза;

— совместное применение с атазанавиром;

— беременность;

— период лактации (грудного вскармливания);

— детский и подростковый возраст до 18 лет;

— повышенная чувствительность к компонентам препарата, а также к сое.

Способ применения и дозы:

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

Для *лечения симптомов гастроэзофагеальной рефлюксной болезни легкой степени выраженности (таких как изжога, тошнота, кислая отрыжка)* у взрослых назначают Контролок в форме таблеток, покрытых кишечнорастворимой оболочкой 20 мг. 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.

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 20-40 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 пищеварительной системы: 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 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 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 мочевыделительной системы: частота неизвестна - интерстициальный нефрит.

Со стороны кожи и подкожных тканей: нечасто - экзантема/сыпь, зуд; частота неизвестна - злокачественная экссудативная эритема (синдром Стивенса-Джонсона), экссудативная многоформная эритема, токсический эпидермальный некролиз, фотосенсибилизация.

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

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

Аллергические реакции: редко - крапивница, ангионевротический отек.

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

Со стороны эндокринной системы: редко - гинекомастия.

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

Передозировка:

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

Симптомы: возможно усиление побочных эффектов.

Лечение: проводится симптоматическая и поддерживающая терапия. Пантопразол не выводится посредством гемодиализа.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Контролок противопоказан при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

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 (амоксициллин, 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.

Не отмечено клинически значимого лекарственного взаимодействия с кофеином, этанолом, теофиллином.

Особые указания и меры предосторожности:

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 мочевинного 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 язвенная болезнь 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 инфекций, возбудителями которых являются бактерии рода желудочно-кишечных 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.

При нарушениях функции почек

Не следует повышать дневную дозу пантопразола 40 мг у пациентов с нарушенной почечной функцией, а также пациентов пожилого возраста.

При нарушениях функции печени

С *осторожностью* следует применять препарат при печеночной недостаточности.

У лиц с тяжелой печеночной недостаточностью дневная доза должна быть уменьшена до 20 мг пантопразола. Кроме того, у таких пациентов во время терапии препаратом Контролок необходимо контролировать ферменты печени. В случае повышения их уровня лечение должно быть прервано.

Применение в пожилом возрасте

Пациентам пожилого возраста, 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 20-40 мг 2 раза/сут.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°С.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Kontrolok