Контролок (порошок)



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:

Порошок для приготовления раствора для в/в введения в виде сухой субстанции белого или почти белого цвета.

	1 фл.
пантопразола натрия сесквигидрат	45.1 мг,
что соответствует содержанию пантопразола натрия (ангидрид)	42.3 мг,
что соответствует содержанию пантопразола (свободная кислота)	40 мг

Вспомогательные вещества: динатрия эдетат - 1 мг, натрия гидроксид - 0.24 мг.

Флаконы бесцветного стекла (1) - 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.

По сравнению с другими ингибиторами протонового 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

В диапазоне доз от 10 до 80 мг кинетическая прямая концентрации пантопразола в плазме крови имеет линейную зависимость как после приема внутрь, так и после в/в применения.

Распределение

Связывание пантопразола с белками плазмы крови составляет 98%.

V_d составляет 0.15 л/кг, клиренс - 0.1 л/ч/кг.

Метаболизм

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

Выведение

Основной путь выведения - почками (около 80%) в виде метаболитов пантопразола, в небольшом количестве выводится через кишечник. $T_{1/2}$ препарата - 1 ч, $T_{1/2}$ метаболита - около 1.5 ч. Было отмечено несколько случаев замедленной элиминации.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

При применении пантопразола у пациентов с нарушением функции 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. Не кумулирует.

У пациентов с циррозом печени (классы А, В по шкале Чайлд-Пью) значение $T_{1/2}$ увеличивается до 7-9 ч и AUC увеличивается в 5-7 раз, C_{max} в плазме кровиувеличивается в 1.5 раза по сравнению с пациентами с нормальной функцией печени.

Небольшое повышение показателя AUC и C_{max} у пациентов пожилого возраста не является клинически значимым.

Показания к применению:

— язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки (в фазе обострения), эрозивный гастрит (в т.ч. связанные с приемом НПВС);

— гастроэзофагеальная рефлюксная болезнь (ГЭРБ): лечение эрозивного рефлюкс-эзофагита, симптоматическое лечение неэрозивной рефлюксной болезни (НЭРБ);

— синдром Золлингера-Эллисона;

— эрадикация Helicobacter pylori в комбинации с антибактериальными средствами;

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

Относится к болезням:

- Гастрит
- Рефлюкс-эзофагит
- Эзофагит
- Язвенная болезнь
- Язвенная болезнь желудка

Противопоказания:

— совместное применение с атазанавиром;

— беременности;

— период лактации (грудного вскармливания);

— детский и подростковый возраст до 18 лет;

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

Способ применения и дозы:

Контролок следует вводить в/в лишь в тех случаях, когда невозможен прием препарата внутрь. Длительность применения - не более 7 дней. При возникновении возможности перорального применения в/в введение следует заменить приемом внутрь препарата Контролок таблетки, покрытые кишечнорастворимой оболочкой.

Язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки (в фазе обострения), эрозивный гастрит (в т.ч. связанные с приемом НПВС), ГЭРБ: рекомендуемая доза составляет 40 мг (1 флакон) в сут.

Синдром Золлингера-Эллисона: при длительном лечении синдрома Золингера-Эллисона и других патологических гиперсекреторных состояний рекомендуемая суточная доза для в/в введения в начале лечения составляет 80 мг. После этого доза может быть увеличена или уменьшена. В случае применения препарата в суточной дозе более 80 мг, дозу следует разделить и вводить 2 раза/сут. Возможно временное увеличение суточной дозы до 160 мг, но не дольше чем необходимо для адекватного контроля кислотности. При необходимости экстренного контроля кислотности начальная доза по 80 мг 2 раза/сут достаточна для снижения кислотного выброса в диапазоне менее 10 мЭкв/ч в течение 1 ч у большинства пациентов.

Лечение и профилактика стрессовых язв, а также их осложнений (кровотечение, перфорация, пенетрация): рекомендуемая доза составляет 80 мг/сут. В случае применения препарата в суточной дозе более 80 мг, дозу следует разделить и вводить 2 раза/сут. Возможно временное увеличение суточной дозы до 160 мг.

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

У **пациентов пожилого возраста и у пациентов с нарушением функции почек** коррекция дозы не требуется, однако не следует превышать рекомендуемую суточную дозу пантопразола 40 мг.

Правила приготовления и введения раствора для инъекций

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% раствора натрия хлорида или в 5% растворе глюкозы.

Не использовать другие растворители!

Введение препарата следует производить в течение 2-15 мин.

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

Побочное действие:

При применении препарата Контролок в соответствии с показаниями и в рекомендованных дозах побочные реакции возникают крайне редко. *Наиболее часто* наблюдается тромбофлебит в месте введения препарата; примерно в 1% случаев - 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, дискомфорт и 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.

Местные реакции: часто - тромбофлебит в месте введения.

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.

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

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказано применение препарата Контролок 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 (например, кетоконазол, итраконазол, позаконазол и таких как эрлотиниб).

Контролок может быть назначен без риска нежелательного 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), метронидазол; пациентам, принимающим пероральные контрацептивы, содержащие левоноргестрел и этинилэстрадиол; пациентам, принимающим НПВС (диклофенак, напроксен, пироксикам); пациентам с заболеваниями эндокринной системы, принимающим глибенкламид, левотироксин натрия; 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 также отсутствие лекарственного взаимодействия с теофиллином, кофеином и этанолом.

Особые указания и меры предосторожности:

Применение пантопразола не показано для лечения легких желудочно-кишечных жалоб, таких как диспепсия неврогенного генеза.

Пациенты должны проконсультироваться с врачом при возникновении следующих симптомов:

— значимая непреднамеренная потеря массы тела;

— периодическая рвота;

— расстройство глотания;

— анемия, мелена.

При подозрении или наличии язвы желудка перед началом лечения пантопразолом следует исключить возможность злокачественного новообразования, т.к. лечение препаратом может маскировать симптомы и отсрочить правильную диагностику.

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 к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения пациентам следует воздержаться от управления транспортными средствами и другими механизмами, требующими повышенного внимания, из-за вероятности головокружений 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

У **пациентов пожилого возраста** коррекция дозы не требуется, однако не следует превышать рекомендуемую суточную дозу пантопразола 40 мг.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет.

Условия хранения:

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

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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