Состав

действующее вещество: пантопразол;

1 таблетка гастрорезистентная содержит 20 мг пантопразола в виде пантопразола натрия сесквигидрата;

вспомогательные вещества: маннит (Е 421), кросповидон, натрия карбонат, сорбит (Е 420), кальция стеарат, гипромеллоза, повидон (К 25), титана диоксид (Е 171), железа оксид желтый (Е 172), пропиленгликоль, метакрилатного сополимера дисперсия, тальк, макрогол 6000.

Лекарственная форма

Таблетки гастрорезистентные.

Основные физико-химические свойства: таблетки светлого желто-коричневого цвета, овальные, слегка двояковыпуклые, покрытые оболочкой.

Фармакотерапевтическая группа

Препарат для лечения кислотозависимых заболеваний. Ингибиторы протонной помпы. Код АТХ А02В С02.

Фармакодинамика

Пантопразол является замещенным бензимидазола, который блокирует секрецию соляной кислоты в желудке из-за специфического влияния на протонные помпы париетальных клеток.

Пантопразол трансформируется в активную форму в кислой среде, а именно - в париетальных клетках, где ингибирует фермент Н + -К + -АТФазы, то есть блокирует конечный этап выработки соляной кислоты в желудке. Ингибирования зависит от дозы и подавляет как базальную, так и стимулированную секрецию кислоты.

Лечение пантопразолом, как и другими ингибиторами протонной помпы и ингибиторами Н2-рецепторов, снижает кислотность в желудке и таким образом увеличивает секрецию гастрина пропорционально уменьшению кислотности.

Увеличение секреции гастрина является обратимым. Поскольку пантопразол связывает фермент дистально по отношению к клеточному рецептору, он может ингибировать секрецию соляной кислоты независимо от стимуляции другими веществами (ацетилхолином, гистамином, гастрином). Эффективность препарата одинакова при пероральном применении или внутривенном введении.

При применении пантопразола увеличивается уровень гастрина натощак. При непродолжительном применении они в большинстве случаев не превышают верхней границы нормы. При длительном лечении уровня гастрина в большинстве случаев растут вдвое. Чрезмерное их увеличение, однако, возникает только в редких случаях. Как следствие, в небольшом количестве случаев при длительном лечении наблюдается слабое или умеренное увеличение количества ентерохромафиноподибних клеток (ECL-клеток) желудка (аденоматоидна гиперплазия). Тем не менее, согласно проведенным на данный момент исследованиями, образование клеток-предшественников нейроэндокринных опухолей желудка, которые были обнаружены в экспериментах с животными, у людей не наблюдалось. Но при длительном (более 1 года) лечении нельзя исключать влияния пантопразола на эндокринные параметры щитовидной железы.

На фоне лечения антисекреторными лекарственными средствами уровень гастрина в сыворотке крови возрастает в ответ на снижение секреции кислоты. Кроме того, из-за снижения кислотности желудка повышается уровень хромогранину А (CgA). Повышенный уровень CgA может влиять на результаты исследований при диагностике нейроэндокринных опухолей. Имеющиеся опубликованные данные свидетельствуют о том, что лечение ингибиторами протонной помпы следует прекратить в течение периода от 5 дней до 2 недель до измерений уровня CgA. Это позволяет уровню CgA, который может быть ошибочно повышенным после лечения ИПП, вернуться в диапазон нормы.

Фармакокинетика

Пантопразол быстро всасывается, максимальная концентрация в плазме крови достигается даже после приема одной дозы 40 мг. В среднем максимальная концентрация в плазме крови 2-3 мкг/мл достигается в течение 2,5 часа после приема и остается постоянным также после многократного введения. Объем распределения составляет примерно 0,15 л/кг, а клиренс - около 0,1 л/ч/кг.

Период полувыведения составляет примерно 1 час. В случаях вывода был продлен. Благодаря специфическому связыванию пантопразола с протонной помпой париетальных клеток период полувыведения не соотносится с более продленной продолжительностью действия.

Фармакокинетика не меняется после однократного или многократного приема. При дозах от 10 до 80 мг кинетика пантопразола в плазме является линейной как после перорального, так и после внутривенного введения.

Связывание пантопразола с белками плазмы составляет 98%. Препарат почти полностью метаболизируется в печени. Главным путем выведения почки - примерно 80% метаболитов пантопразола; остальные выделяется с калом. Основным метаболитом как в плазме, так и в моче дисметилпантопразол, который соединяется с сульфатом. Период полувыведения основного метаболита (примерно 1,5 часа) ненамного длиннее, чем пантопразола.

Биодоступность. После приема внутрь пантопразол всасывается полностью. Биодоступность таблетки составляет примерно 77%. Прием пищи не оказывает никакого влияния на значение площади под фармакокинетической кривой «концентрация-время» (AUC), максимальную концентрацию в плазме и биодоступность; происходит только изменение в начале действия.

Характеристика особых групп пациентов

Медленные метаболизаторы. Около 3% европейцев имеют низкую функциональную активность фермента CYP2C19; их называют медленными метаболизаторами. В организмах таких лиц метаболизм пантопразола, вероятно, главным образом катализируется ферментом CYP3A4. После приема одной дозы 40 мг пантопразола средняя площадь, ограниченная фармакокинетической кривой «концентрация в плазме - время», была примерно в 6 раз больше в медленных метаболизаторов, чем у лиц, имеющих функционально активный фермент CYP2C19 (быстрые метаболизаторы). Максимальная концентрация в плазме крови выросла примерно на 60%. Эти результаты не влияют на дозировку пантопразола.

Для пациентов с нарушениями функции почек (включая пациентов, находящихся на гемодиализе), не нужно уменьшение дозы. Как и у здоровых людей, период полувыведения пантопразола является коротким. Диализуются лишь очень

небольшие количества пантопразола. Несмотря на то, что период полувыведения основного метаболита несколько возрастает (2-3 часа), он быстро выводится и следовательно, не накапливается.

У пациентов с циррозом печени (классы А и В согласно Чайлд-Пью) период полувыведения увеличивается до 7-9 часов и соответственно этому в 5-7 раз увеличивается значение AUC и максимальная концентрация пантопразола в плазме увеличивается на 1,5 по сравнению со здоровыми людьми.

Незначительное увеличение AUC и максимальная концентрация пантопразола в плазме у добровольцев пожилого возраста по сравнению с молодыми также не является клинически значимыми.

Пациенты пожилого возраста. Незначительное увеличение AUC и Cmax у добровольцев пожилого возраста по сравнению с соответствующими показателями у более молодых добровольцев также не имеет клинического значения.

Показания

Лечение гастроэзофагеальной рефлюксной болезни и ее симптомов (таких как изжога, заброс кислым) у взрослых.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к пантопразолу или к любому компоненту препарата.

Пантопразол противопоказано применять одновременно с атазанавиром (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Пантопразол может уменьшать всасывание препаратов, биодоступность которых зависит от pH желудочного сока (например, некоторых противогрибковых препаратов, таких как кетоконазол, итраконазол, позаконазол или других препаратов, таких как эрлотиниб).

Доказано, что применение атазанавира 300 мг/ритонавира 100 мг с омепразолом (40 мг один раз в сутки) или атазанавира 400 мг с лансопразолом (60 мг однократно) у здоровых добровольцев вызывает существенное уменьшение биодоступности атазанавира. Абсорбция атазанавира зависит от pH. Таким образом, пантопразол противопоказано применять одновременно с атазанавиром (см. Раздел «Противопоказания»).

Несмотря на отсутствие взаимодействия при одновременном назначении с фенпрокумон и варфарином при проведении клинических исследований, были зарегистрированы единичные случаи изменения МНИ (международного нормализованного индекса) в ходе постмаркетингового исследования. Таким образом, пациентам, которые применяют непрямых антикоагулянтов (например, фенпрокумон и варфарин), рекомендуется осуществлять мониторинг ПВ/МНИ в начале, в конце и в случае нерегулярного лечения пантопразолом.

Сообщалось, что одновременное применение высоких доз метотрексата (например, 300 мг) и ингибиторов протонной помпы увеличивают уровне метотрексата в крови у некоторых пациентов. Пациентам, принимающим высокие дозы метотрексата, например, пациентам, больным раком или псориаз, рекомендуется временно прекратить лечение пантопразолом.

Пантопразол метаболизируется в печени через систему ферментов цитохрома P450.

Проведение исследований с большинством таких средств не выявили клинически значимых взаимодействий с карбамазепином, кофеином, диазепамом, диклофенаком, дигоксином, этанолом, глибенкламидом, метопрололом, напроксен, нифедипином, фенитоином, пироксикамом, теофиллином и пероральными контрацептивами, содержащими левоноргестрел и этинилэстрадиол. Однако не исключается взаимодействие пантопразола с другими препаратами, которые метаболизируются через эту же ферментную систему.

Не выявлено взаимодействия с одновременно назначаемыми антацидными препаратами.

Были проведены исследования по взаимодействию пантопразола с одновременно назначаемыми определенными антибиотиками (кларитромицин, метронидазол, амоксициллин). Клинически значимых взаимодействий между этими

препаратами не выявлено.

Особенности применения

Больным следует проконсультироваться с врачом, если:

- у них наблюдается непреднамеренная существенная потеря массы тела, анемия, желудочно-кишечное кровотечение, дисфагия, периодическое рвота или рвота с кровью, так как лечение пантопразолом может маскировать симптомы и отсрочить диагностику более серьезных заболеваний. В этих случаях следует исключить риск появления злокачественной опухоли. Если симптомы сохраняются при дальнейшем адекватном лечении, необходимо продолжать исследования;
- имеют в анамнезе язву желудка или двенадцатиперстной кишки, перенесших операции на желудочно-кишечном тракте;
- находятся на длительном симптоматическом лечении расстройства пищеварения или изжоги в течение 4 недель или более:
- наблюдается желтуха, печеночная недостаточность или заболевания печени
- наблюдаются другие серьезные заболевания, которые негативно влияют на общее состояние здоровья;
- более 55 лет и у наблюдаются новые или недавно изменены симптомы расстройства пищеварения или изжоги.

Пациенты с длительными рецидивирующими симптомами расстройства пищеварения или изжоги должны регулярно проходить обследование. Пациенты в возрасте от 55 лет, ежедневно применяют любые безрецептурные средства от расстройства пищеварения или изжоги, должны сообщить об этом врачу.

Пациентам не следует одновременно применять любой другой ингибитор протонной помпы или блокатор H2-рецепторов.

При необходимости проведения эндоскопического исследования или уреазного дыхательного теста перед приемом пантопразола пациентам следует проконсультироваться с врачом.

Пациенты должны знать, что применение таблеток пантопразола не предназначено для немедленного облегчения симптомов. Пациенты могут испытывать облегчение симптомов через 1 день после начала лечения пантопразолом, но может потребоваться до 7 дней для достижения полного исчезновения симптомов изжоги. Пациентам не следует применять пантопразол как профилактическое средство.

Нарушение функций печени. Пациентам с тяжелыми нарушениями функции печени необходимо регулярно контролировать уровень печеночных ферментов. В случае повышения уровня печеночных ферментов лечения необходимо прекратить.

Ингибиторы протеазы ВИЧ. Не рекомендуется совместное применение пантопразола с ингибиторами протеазы ВИЧ (такими как атазанавир, нелфинавир), абсорбция которых зависит от внутрижелудочного pH, из-за существенного снижения их биодоступности.

Инфекции желудочно-кишечного тракта, вызванные бактериями. Снижение кислотности желудка из-за применения любых средств, включая ингибиторы протонной помпы, повышает количество желудочных бактерий, которые обычно присутствуют в желудочно-кишечном тракте. Лечение препаратами, снижающими кислотность, несколько повышает риск развития желудочно-кишечных инфекций, вызванных такими микроорганизмами как Salmonella, Campylobacter или Clostridium difficile.

Совместное применение с НПВС. Применение препарата Нольпаза® контрол для профилактики язвы желудка и двенадцатиперстной кишки, вызванных приемом НПВС долгое время, следует ограничить для пациентов, склонных к частым обострениям язвы желудка и двенадцатиперстной кишки. Оценка уровня риска проводится с учетом индивидуальных факторов риска, включая возраст (> 65 лет), анамнез развития язвы желудка или двенадцатиперстной кишки, а также желудочно-кишечных кровотечений.

Абсорбция витамина B12. Пантопразол, как и все препараты, блокирующие продукцию соляной кислоты, может снижать всасывание витамина B12 (цианокобаламина) в связи с возникновением гипо- или ахлоргидрии. Это следует учитывать пациентам с пониженной массой тела или при наличии факторов риска снижения поглощения витамина B12 при длительной терапии или если наблюдаются соответствующие клинические симптомы.

Длительное лечение. При длительном периоде лечения, особенно более 1 года, пациенты должны находиться под постоянным наблюдением врача.

Гипомагниемия. Спостеригалися случаи тяжелой гипомагниемии у пациентов, получавших ИПП, такие как пантопразол, в течение не менее трех месяцев, и в большинстве случаев - в течение года. Могут возникнуть и незаметно развиваться следующие серьезные клинические проявления гипомагниемии: усталость, тетания, делирий, судороги, головокружение и желудочковая аритмия. В случае гипомагниемии в большинстве случаев состояние пациентов улучшалось после заместительной корректирующей терапии препаратами

магния и прекращения приема ИПП.

Пациентам, нуждающимся в длительной терапии, или пациентам, которые принимают ИПП в комбинации с дигоксином или препаратами, которые могут вызвать гипомагниемию (например, диуретики), нужно проводить измерения уровня магния перед началом лечения ИПП и периодически во время лечения.

Переломы костей. Длительное лечение (более 1 года) высокими дозами ингибиторов протонной помпы может незначительно увеличить риск перелома бедра, запястья и позвоночника, преимущественно у пожилых людей или при наличии других факторов риска. Наблюдательные исследования указывают на то, что применение ингибиторов протонной помпы может увеличить общий риск переломов на 10-40%. Некоторые из них могут быть обусловлены другими факторами риска. Пациенты с риском развития остеопороза должны получать лечение в соответствии с действующими клинических рекомендаций и потреблять достаточное количество витамина D и кальция.

Подострый кожная красная волчанка. Применение ингибиторов протонной помпы связывают с очень редкими случаями развития подострого кожного красной волчанки.

В случае поражения, особенно на участках, подвергающихся воздействию солнечного света, и это сопровождаются артралгией, пациенту необходимо немедленно обратиться к врачу и рассмотреть возможность отмены препарата Нольпаза® контрол. Возникновение подострого кожного красной волчанки у пациентов при предварительной терапии ингибиторами протонной помпы может повысить риск его развития при применении других ингибиторов протонной помпы.

Влияние на результаты лабораторных исследований.

Повышенный уровень хромогранину А (CgA) может влиять на результаты исследований при диагностике нейроэндокринных опухолей. Чтобы избежать такого воздействия, лечения Нольпаза® контрол следует временно прекратить по крайней мере за 5 дней до проведения оценки уровня CgA (см. Раздел «Фармакологические»). Если уровне CgA и гастрина не вернулись в диапазон нормы после начального измерения, следует провести повторные измерения через 14 дней после отмены лечения ингибиторами протонной помпы.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

Пантопразол не влияет или имеет очень незначительное влияние на скорость реакции при управлении автотранспортом или другими механизмами. Необходимо принимать во внимание возможное развитие побочных реакций, таких как головокружение и расстройства зрения (см. раздел «Побочные реакции»). В таких случаях не следует управлять автотранспортом или работать с механизмами.

Применение в период беременности или кормления грудью

*Беременност*ь. Имеющиеся данные по применению препарата Нольпаза® контрол беременным женщинам указывают на отсутствие эмбриональной или фето/неонатальной токсичности препарата. У животных наблюдалась репродуктивная токсичность. В качестве меры пресечения, следует избегать применения препарата Нольпаза® контрол беременным женщинам.

Кормления грудью. Исследования на животных показали выведение пантопразола в грудное молоко. Недостаточно данных по экскреции пантопразола в грудное молоко, однако о таком выведении сообщали. Нельзя исключать риск для новорожденных/младенцев. Решение о прекращении кормления грудью или прекращения/удержания от лечения Нольпаза® контрол нужно принимать с учетом пользы от кормления грудью для ребенка и пользы от лечения Нольпаза® контрол для женщины.

Фертильность. Пантопразол не нарушал фертильность в исследованиях на животных.

Способ применения и дозы

Дозировка

Рекомендуемая доза составляет 20 мг пантопразола (1 таблетка) 1 раз в сутки.

Для купирования симптомов может возникнуть необходимость применять таблетки в течение 2-3 дней. После того как симптомы исчезнут, лечение следует прекратить. Продолжительность лечения не должна превышать 4 недель

без дополнительного медицинского обследования (после консультации с врачом).

Если облегчения симптомов не наступает после двух недель непрерывного лечения, больному следует обратиться к врачу.

Характеристика особых групп пациентов

Пациентам пожилого возраста или пациентам с нарушением функции почек или печени коррекции дозы не требуется.

Способ введения

Таблетки, покрытые кишечно-растворимой оболочкой, препарата Нольпаза® контрол по 20 мг следует глотать целиком, не разжевывая и не разламывая, запивая небольшим количеством жидкости перед едой.

Дети

Не рекомендуется применять препарат Нольпаза® контрол у детей из-за недостатка данных по безопасности и эффективности препарата для этой возрастной группы.

Передозировка

Нет сообщений о передозировке у людей.

Дозы до 240 мг при внутривенном введении в течение 2 минут хорошо переносились.

Поскольку пантопразол активно связывается с белками плазмы, он не выводится с помощью диализа.

В случае передозировки с клиническими признаками интоксикации отсутствуют какие-либо специфические терапевтические рекомендации, кроме симптоматического и поддерживающего лечения.

Побочные реакции

Возникновение побочных реакций наблюдали в около 5% пациентов. Наиболее частые побочные реакции - диарея и головная боль (около 1%).

Побочные эффекты по частоте возникновения классифицируют по таким категориям: 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), неизвестно (частота не определена по имеющимся данным).

Со стороны крови и лимфатической системы.

Редко: агранулоцитоз.

Очень редко: лейкопения, тромбоцитопения, панцитопения.

Со стороны иммунной системы.

Редко: реакции гиперчувствительности (включая анафилактические реакции, анафилактический шок).

Метаболизм и нарушения обмена веществ.

Редко: гиперлипидемия и повышение уровня липидов (триглицериды, холестирол), изменения массы тела.

Неизвестно: гипонатриемия, гипомагниемия (см. Раздел «Особенности применения»), гипокальциемия1, гипокалиемия.

Психические расстройства.

Нечасто: расстройства сна.

Редко: депрессия (в том числе обострения).

Очень редко: дезориентация (в том числе обострения).

Неизвестно: галлюцинация, спутанность сознания (особенно у пациентов со склонностью к данным расстройств, а также обострение этих симптомов в случае их предсуществования).

Со стороны нервной системы.

Нечасто: головная боль, головокружение.

Редко: нарушения вкуса.

Неизвестно: парестезии.

Со стороны органов зрения.

Редко: нарушение зрения/затуманивание зрения.

Со стороны пищеварительного тракта.

Часто: полипы с фундальных желез (доброкачественные).

Нечасто: диарея, тошнота, рвота, вздутие живота, запор, сухость во рту, боль в животе и дискомфорт.

Со стороны пищеварительной системы.

Нечасто: повышение уровня печеночных ферментов (трансаминаз, g-ГТ).

Редко: повышение уровня билирубина.

Неизвестно: поражение гепатоцитов, желтуха, гепатоцеллюлярная недостаточность.

Со стороны кожи и подкожных тканей.

Нечасто: кожная сыпь, сыпь, зуд.

Редко: крапивница, ангионевротический отек.

Неизвестно: синдром Стивенса-Джонсона, синдром Лайелла, многоформная эритема, фотосенсибилизация, подострый кожная красная волчанка (см. Раздел «Особенности применения»).

Со стороны костно-мышечной системы и соединительной ткани.

Нечасто: переломы бедра, запястья, позвоночника (см. Раздел «Особенности применения»).

Редко: артралгия, миалгия.

Неизвестно: спазм мьязив2.

Со стороны почек и мочевыделительной системы.

Неизвестно: интерстициальный нефрит (с возможным развитием почечной недостаточности).

Со стороны репродуктивной системы и молочных желез.

Редко: гинекомастия.

Общие расстройства.

Нечасто: астения, усталость, недомогание.

Редко: повышение температуры тела, периферические отеки.

1. гипокальциемия одновременно с гипомагниемией.

2. Спазм мышц как следствие нарушения баланса электролитов.

Срок годности

5 лет.

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 30 ° С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 7 таблеток в блистере, по 2 блистера в картонной коробке.

Категория отпуска

Без рецепта.

Производитель

КРКА, д.д., Ново место, Словения.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Шмарьешка цеста 6, 8501 Ново место, Словения.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — Государственного реестра лекарственных средств Украины.