

Состав

действующее вещество: итоприда гидрохлорид;

1 таблетка содержит 50 мг итоприда гидрохлорида;

вспомогательные вещества: лактоза моногидрат, крахмал кукурузный кальция кармеллоза (кальция карбоксиметилцеллюлоза) кремния диоксид коллоидный магния стеарат;

оболочка: смесь для пленочного покрытия Opadray II White: лактоза моногидрат, гипромеллоза (гидроксипропилметилцеллюлоза) полиэтиленгликоль; титана диоксид (E 171) триацетин.

Лекарственная форма

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Основные физико-химические свойства: таблетки, круглой формы с двояковыпуклой поверхностью, покрытые пленочной оболочкой белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа

Стимуляторы перистальтики. Код АТХ A03F A07.

Фармакодинамика

Итоприда гидрохлорид активирует пропульсивную моторику желудочно-кишечного тракта благодаря антагонизма с допаминовыми D2-рецепторами и ингибирующей активности ацетилхолинэстеразы. Итоприду гидрохлорид активирует высвобождение ацетилхолина и ингибирует его распад. Итоприда гидрохлорид также оказывает противорвотным действие благодаря взаимодействию с D2-рецепторами, локализованными в хеморецепторного триггерной зоне, что было продемонстрировано дозозависимым ингибированием апоморфининдукованого рвота у животных. Действие итоприду гидрохлорида является высокоспецифичный относительно верхних отделов желудочно-кишечного тракта.

Итоприда гидрохлорид не влияет на уровень гастрина в сыворотке крови.

Фармакокинетика

Абсорбция. Итоприда гидрохлорид быстро и практически полностью всасывается из желудочно-кишечного тракта. Его относительная биодоступность составляет 60%, что связано с эффектом «первого прохождения» через печень. Пища не влияет на биодоступность. После применения 50 мг итоприда гидрохлорида максимальная концентрация достигается через 0,5 - 0,75 часа и составляет 0,28 мкг / мл. При дальнейшем применении лекарственного средства в дозах от 50 до 200 мг 3 раза в сутки в течение 7 дней фармакокинетика итоприда гидрохлорида и его метаболитов была линейной с минимальной кумуляцией.

Распределение. Примерно 96% итоприда гидрохлорида связывается с белками плазмы (преимущественно с альбумином). Связывание с α 1-кислым гликопротеином составляет менее 15%.

Метаболизм. Итоприда гидрохлорид активно метаболизируется в печени. Идентифицировано три метаболита, только один из которых проявляет незначительную активность, не имеет фармакологического значения (примерно 2 - 3% итоприду гидрохлорида). Первичным метаболитом является N-оксид, который образуется в результате окисления четвертичной амино-N-диметильной группы.

Итоприда гидрохлорид метаболизируется под действием флавинзалежной монооксигеназы (FMO3). Количество и эффективность изоферментов FMO у человека может отличаться в зависимости от генетического полиморфизма, который иногда приводит к развитию аутосомно-рецессивного состояния, известного под названием триметиламинурией (синдром «рыбного запаха»). У больных триметиламинурией, $T_{1/2}$ увеличивается.

Согласно данным фармакокинетических исследований *in vivo* итоприда гидрохлорид не оказывает ингибирующего или индуцирующего действия в отношении CYP2C19 и CYP2E1. Применение итоприду гидрохлорида не влияет на содержание CYP или активность уридиндифосфатглюкуронизил-трансферазы.

Вывод. Итоприда гидрохлорид и его метаболиты выводятся преимущественно с мочой. Почечная экскреция итоприду гидрохлорида и его N-оксида составляла 3,7% и 75,4% соответственно после однократного применения лекарственного средства здоровым добровольцам в терапевтической дозе.

Терминальный период полувыведения ($T_{1/2}$) итоприду гидрохлорида составлял примерно 6 часов.

Показания

Купирования желудочно-кишечных симптомов функциональной неязвенной диспепсии (хронического гастрита), а именно:

- вздутие живота;
- ощущение быстрого насыщения;
- боль и дискомфорт в верхней части живота;
- анорексия;
- изжога;
- тошнота
- рвота.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к итоприду гидрохлорида и других компонентов лекарственного средства.

Состояния, при которых повышение сократительной активности желудочно-кишечного тракта может быть вредным, например желудочно-кишечном кровотечении, механической обструкции или перфорации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Метаболические взаимодействия не ожидается в связи с тем, что итоприда гидрохлорид первично метаболизируется флавиномоноксигеназой, а не изоферментами системы цитохрома P450. Никаких изменений по связыванию с белками при одновременном применении с варфарином, диазепамом, диклофенаком натрия, тиклопидина гидрохлоридом, нифедипином и нитроглицерина гидрохлоридом не наблюдалось. В связи с тем, что итоприда гидрохлорид имеет гастрокинетический эффект, он может влиять на всасывание других лекарственных средств, которые применяют одновременно перорально.

С особой осторожностью следует применять лекарственные средства с узким терапевтическим индексом, замедленным высвобождением или с кишечнорастворимой оболочкой.

Противоязвенные лекарственные средства, такие как циметидин, ранитидин, тепренон и цетраксат, не влияют на прокинетическое действие итоприда гидрохлорида.

Антихолинергические лекарственные средства могут снижать действие итоприда гидрохлорида.

Особенности применения

Итоприда гидрохлорид усиливает действие ацетилхолина и может привести к холинергическим побочным эффектам. Данные о длительном применении отсутствуют.

В общем, итоприда гидрохлорид пациентам пожилого возраста следует назначать с целесообразной осторожностью и последующим наблюдением, учитывая повышенную частоту ухудшенной функции почек, печени, сопутствующих заболеваний или сопутствующую терапию другими лекарственными средствами в таких пациентов.

Лекарственное средство содержит лактозу, поэтому пациентам с редкими наследственными заболеваниями как непереносимость галактозы, дефицит лактазы Лаппа или нарушение мальабсорбции глюкозы-галактозы не следует применять данное лекарственное средство.

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

Информация о возможном влиянии на скорость реакции отсутствует, но при решении вопроса об управлении автотранспортом или работы с механизмами необходимо учесть возможность возникновения головокружения.

Применение в период беременности или кормления грудью

Фертильность. Данных о влиянии итоприду на фертильность человека нет; известно, что исследования на животных не выявили вредного воздействия итоприда.

Беременность. Данные о применении итоприда беременным женщинам отсутствуют или ограничены (менее 300 случаев исходов беременности). Исследования на животных не выявили никакого прямого или косвенного вредного токсического эффекта на репродуктивную функцию. Как профилактическое мероприятие желательно отказаться от применения итоприда в период беременности.

Кормления грудью. Итоприд проникает в грудное молоко у животных, но по проникновению итоприда в грудное молоко у человека данных недостаточно. Риск для ребенка, находящегося на грудном вскармливании, не может быть исключен. Решение о прекращении грудного вскармливания или прекращения / приостановления приема итоприда следует принимать с учетом пользу грудного вскармливания для ребенка и пользу лечения для женщины.

Способ применения и дозы

Для взрослых рекомендуемая доза становить 150 мг в сутки (по 1 таблетке (50 мг) 3 раза в сутки перед приемом пищи). Указанную дозу можно снизить с учетом возраста пациента и симптомов (см. Раздел «Особенности применения»).

Известно, что во время клинических исследований продолжительность применения итоприда гидрохлорида составляла до 8 недель.

Дети

Безопасность применения итоприда гидрохлорида детям в возрасте до 16 лет не установлена.

Передозировка

Лечение. В случае чрезмерного передозировки необходимо принять обычные меры по промыванию желудка и провести симптоматическое лечение.

Побочные реакции

Со стороны иммунной системы: гиперчувствительность, включая анафилактикоидные реакции.

Со стороны эндокринной системы: повышенный уровень пролактина в крови.

Со стороны системы крови и лимфатической системы: лейкопения, тромбоцитопения.

Со стороны желудочно-кишечного тракта: боль в животе, диарея, запор, повышенное слюноотделение, тошнота.

Со стороны нервной системы: головокружение, головная боль, тремор.

Со стороны кожи и подкожной клетчатки: сыпь, эритема и зуд.

Со стороны печени и желчевыводящих путей: желтуха.

Со стороны репродуктивной системы и молочных желез: гинекомастия.

Лабораторные исследования: повышение уровня АСТ (аспартатаминотрансферазы), АЛТ (аланинаминотрансферазы), ГГТ (гамма-глутамилтрансферазы), щелочной фосфатазы, билирубина в крови, повышенный уровень аминотрансферазы, снижено количество белых кровяных телец.

Срок годности

2 года.

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 ° С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 10 таблеток в блистере, по 2 блистера в пачке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

АО «Киевский витаминный завод».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

04073, Украина, г.. Киев, ул. Копылевская, 38.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).