Состав

действующее вещество: итоприда гидрохлорид;

1 таблетка содержит 50 мг итоприда гидрохлорида;

вспомогательные вещества: лактоза моногидрат, крахмал кукурузный; натрия кроскармеллоза; кремния диоксид коллоидный магния стеарат Opadry II White 85F 18422 (титана диоксид (Е 171), спирт поливиниловый, тальк, полиэтиленгликоль).

Лекарственная форма

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Основные физико-химические свойства: белые или почти белые таблетки, покрытые пленочной оболочкой, двояковыпуклые, с насечкой с одной стороны, диаметром около 7 мм.

Фармакотерапевтическая группа

Средства, применяемые при функциональных расстройствах пищеварительного тракта. Стимуляторы перистальтики. Код АТХ A03F A.

Фармакодинамика

Итоприда гидрохлорид активирует пропульсивную моторику желудочно-кишечного тракта благодаря антагонизма с допаминовыми D2-рецепторами и ингибирующей активности ацетилхолинэстеразы. Итоприда 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 итоприда гидрохлорида является высокоспецифичный относительно верхних отделов желудочно-кишечного тракта.

Итоприда гидрохлорид не влияет на уровень гастрина в сыворотке крови.

Итоприда гидрохлорид ускоряет эвакуацию желудочного содержимого, улучшает гастродуоденальную координацию, стимулирует прохождение

кишечного содержимого.

Фармакокинетика

Абсорбция

Итоприда гидрохлорид быстро и почти полностью всасывается в желудочно-кишечном тракте. Его относительная биодоступность составляет 60%, что связано с метаболизмом при «первом прохождении» через печень (пресистемный метаболизм). Прием пищи не влияет на биодоступность препарата. Максимальная концентрация максимальная концентрация в плазме крови достигается в течение 30-45 минут после приема 50 мг итоприда гидрохлорида и составляет 0,28 мкг / мл. Не проникает через гематоэнцефалический барьер и в клетки проводящей системы миокарда.

При дальнейшем применении лекарственного средства в дозах от 50 до 200 мг три раза в сутки в течение 7 дней фармакокинетика итоприда гидрохлорида и его метаболитов была линейной с минимальной кумуляцией препарата.

*Распределени*е

Примерно 96% итоприда гидрохлорида связывается с белками плазмы крови (преимущественно с альбумином). Связывания с альфа-1-кислым гликопротеином составляет менее 15%.

Исследования на животных показали, что итоприда гидрохлорид в значительной степени распределяется в различные ткани (объем распределения 6,1 л / кг), за исключением центральной нервной системы; высокие концентрации препарата достигаются в почках, тонком кишечнике, печени, надпочечниках и желудка. Проникновение препарата в ЦНС является минимальным. Итоприду гидрохлорид проникает в грудное молоко животных.

Метаболизм

У человека итоприда гидрохлорид подвергается интенсивному метаболизму в печени. Идентифицированы 3 метаболиты препарата, из которых только один проявляет незначительную активность, не является фармакологически значимой (примерно 2-3% от фармакологической активности итоприду гидрохлорида). Главным метаболитом у человека есть N-оксид, который образуется в результате окисления четвертичной амино-N-диметильнои группы.

Итоприду гидрохлорид метаболизируется под действием флавинзалежнои монооксигеназы (FMO). Количество и эффективность ФМО-изоферментов у человека может отличаться в зависимости от генетического полиморфизма, что

иногда может приводить к редкому аутосомно-рецессивного нарушения, известного под названием «триметиламинурией» (синдром «рыбьего запаха»). Период полувыведения T ½ итоприда гидрохлорида у пациентов с триметиламинурией может быть более длительным.

Согласно данным фармакокинетических исследований in vivo итоприда гидрохлорид не оказывает ингибирующего или индуцирующего действия в отношении CYP2C19 и CYP2E1. Применение итоприда гидрохлорида не влияло на содержание CYP-ферментов и активность уридин-дифосфат-глюкуронозил-трансферазы.

Вывод

Итоприду гидрохлорид и его метаболиты выводятся преимущественно с мочой. У здоровых добровольцев после однократного приема терапевтической дозы препарата экскреция итоприда и его метаболита N-оксида составляла 3,7% и 75,4% соответственно.

Период полувыведения итоприда гидрохлорида составляет примерно 6 часов.

Показания

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

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

Противопоказания

Повышенная чувствительность к действующему веществу или к любому компоненту препарата.

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 флавинмонооксигеназою, а не изоферментами системы цитохрома Р450.

Не наблюдалось каких-либо изменений по связыванию с белками при одновременном применении с варфарином, диазепамом, диклофенаком натрия, тиклопидина гидрохлоридом, нифедипином и никардипина гидрохлорид. В связи с тем, что итоприду гидрохлорид усиливает моторику желудка, он может влиять на процесс всасывания других лекарственных средств при одновременном применении. Особенно осторожным нужно быть при применении лекарственных средств с низким терапевтическим индексом, лекарственных форм с замедленным высвобождением или с кишечно-растворимой оболочкой.

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

Антихолинергические лекарственные средства могут снижать лечебный эффект итоприду гидрохлорида.

Особенности применения

Итоприда гидрохлорид усиливает действие ацетилхолина и может проявлять холинергические побочные реакции. Данные длительного применения отсутствуют.

Лицам пожилого возраста, учитывая снижение в них функции печени и почек и сопутствующих заболеваний или сопутствующей терапии другими лекарственными средствами, при применении итоприду следует соблюдать осторожность в связи с возможным частым развитием побочных реакций.

В случае пропуска приема дозы ее необходимо принять как можно быстрее; не применять, если наступило время приема следующей дозы НЕ удваивать дозы.

Препарат содержит лактозу, поэтому пациентам с редкими наследственными формами непереносимости галактозы, недостаточностью лактазы Лаппа или синдромом глюкозо-галактозной мальабсорбции нельзя применять препарат.

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

Способ применения и дозы

Взрослым назначать по 1 таблетке (50 мг) 3 раза в день до еды, не разжевывая, запивая достаточным количеством воды.

Рекомендуемая суточная доза составляет 150 мг. Указанная доза быть уменьшена с учетом клинической симптоматики, возраста пациента (см. «Особенности применения»).

Пациентам с нарушениями функции печени и почек препарат следует проводить под надлежащим контролем врача, в случае необходимости надо уменьшить дозу или прекратить терапию.

Продолжительность лечения определяет врач. Во время клинических исследований продолжительность применения итоприду гидрохлорида составляла до 8 недель.

Дети

Препарат не применять детям.

Передозировка

О случаях передозировки не сообщалось.

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

Побочные реакции

Побочные реакции, о которых сообщалось в течение клинических исследований.

Во время клинических исследований (I-III фазы) итоприда гидрохлорид переносился хорошо, о развитии серьезных побочных реакций не сообщалось. В общем сообщалось о 19 случаев возникновения побочных реакций, которые наблюдались у 14 из 572 пациентов, составляет 2,4%. Большинство указанных побочных реакций, которые наблюдались более чем у одного пациента, составляли: диарея (0,7%), головная боль (0,3%), боль в животе (0,3%).

Отклонение лабораторных показателей, которые наблюдались во время клинических исследований: снижение уровня лейкоцитов (лейкопения) (0,7%), повышение уровня пролактина (0,3%).

Побочные реакции, о которых сообщалось в течение постмаркетингового наблюдения и в ходе клинических исследований, продолжающихся у пациентов, получавших лечение итоприда гидрохлорид:

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

Со стороны пищеварительной системы: диарея, запор, боль в животе, повышенное слюноотделение, тошнота.

Со стороны печени и желчевыводящих путей: желтуха.

Со стороны иммунной системы: анафилактоидные реакции.

Со стороны эндокринной системы: возможно повышение уровня пролактина крови, гинекомастия или галакторея. В случае, когда, например, возникают галакторея или гинекомастия, необходимо временно прекратить или полностью отменить прием препарата.

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

Со стороны почек и мочевыводящих путей: повышение уровня креатинина крови повышение уровня креатинина в моче.

Со стороны кожи и подкожной клетчатки: аллергические реакции (сыпь, покраснение, зуд).

Другие: повышенная утомляемость, раздражение.

Лабораторные исследования: повышение уровня АСТ, АЛТ, ГГТ, щелочной фосфатазы, билирубина.

Срок годности

5 лет.

Условия хранения

Хранить в недоступном для детей месте. Не нужны специальные условия хранения.

Упаковка

По 20 таблеток в блистере, по 5 блистеров в картонной коробке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

ПРО.МЕД.ЦС Прага a.c. (PRO.MED.CS Praha a.s.).

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Телчска 377/1, Михля, Прага 4, 140 00, Чешская Республика

Источник инструкции

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