

**СОВОКУПНЫЕ ДАННЫЕ О ЛЕКАРСТВЕННОМ СРЕДСТВЕ
(ИНСТРУКЦИЯ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ДЛЯ СПЕЦИАЛИСТА)**

НАЗВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО СРЕДСТВА

ИТОМЕД® (ITOMED®)

КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

1 таблетка, покрытая оболочкой, содержит 50 мг итоприда гидрохлорида

Вспомогательные вещества: моногидрат лактозы, прежелатинизированный кукурузный крахмал, натрия кроскармеллоза, диоксид кремния коллоидный безводный, магния стеарат

Оболочка Opadry II 85F18422 белый: частично гидролизованый поливиниловый спирт, диоксид титана, макрогол 3350, тальк.

ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки покрытые оболочкой

Описание: белые или почти белые, двояковыпуклые таблетки, покрытые оболочкой, с риской с одной стороны.

Риска способствует разламыванию таблетки с целью облегчения ее проглатывания, а не для деления ее на две дозы.

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА.

Фармакотерапевтическая группа: Прокинетики

АТС код: A03FA07

Фармакодинамические свойства.

Итоприд активирует моторику желудочно-кишечного тракта посредством антагонистического воздействия на допаминовые D₂ -рецепторы и ингибирования ацетилхолинэстеразы. Итоприд активирует высвобождение ацетилхолина и подавляет его деградацию. Итоприд оказывает противорвотный эффект на основе антагонистического воздействия на допаминовые D₂ -рецепторы, находящиеся в хеморецепторной зоне. Этот зависимый от дозы эффект был продемонстрирован подавлением рвоты, вызванной у собак апоморфином. Итоприд ускоряет опорожнение желудка у человека. В исследованиях, проведенных на собаках, было показано, что одноразовая доза итоприда способствует опорожнению желудка. Итоприд оказывает весьма специфическое воздействие на верхний отдел желудочно-кишечного тракта. Итоприд не влияет на концентрацию гастрина в плазме крови.

Фармакокинетические свойства

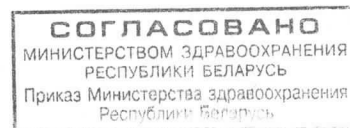
Абсорбция

Итоприд быстро и почти полностью абсорбируется в желудочно-кишечном тракте. Относительная биологическая доступность, составляющая приблизительно 60%, в основном обусловлена метаболизмом при первом прохождении через печень (first-pass effect). Пища не влияет на биологическую доступность лекарственного средства. Максимальная плазматическая концентрация достигается через 30-50 минут после приема 50 мг итоприда.

Повторное пероральное применение дозы 50-200 мг 3 раза в сутки на протяжении 7 дней показало, что итоприд и его метаболиты имеют линейную фармакокинетику с минимальной аккумуляцией.

Распределение

Примерно 96% итоприда связывается с белками плазмы, и в первую очередь с альбумином. С альфа -1 – кислым гликопротеином связывается менее 15% общего количества связанного итоприда.



Исследования на лабораторных крысах показали хорошее распределение итоприда в различных тканях ($Vd_B = 6,1$ л/кг), включая центральную нервную систему; высоких концентраций итоприд достигает в почках, тонкой кишке, печени, надпочечниках и в желудке. Связывание белками плазмы у крыс было ниже, чем у людей (78% по сравнению с 96%). Переход в ЦНС был минимальный. Итоприд проникает в молоко кормящих крыс.

Метаболизм

У людей итоприд в значительной мере метаболизируется в печени. Идентифицированы три метаболита итоприда и только один из них проявляет небольшую активность без фармакологического эффекта (приблизительно 2-3% эффекта итоприда).

Итоприд метаболизируется флавином - содержащей монооксигеназой 3 (FM03). Количество и эффективность изоферментов у человека может отличаться в зависимости от генетического полиморфизма, который в редких случаях может приводить к аутосомно - рецессивному заболеванию, известному, как триметиламинурия (fish odour syndrome/ синдром рыбного запаха). Биологический период полураспада итоприда у пациентов с триметиламинурией может быть продолжительным.

Фармакокинетические *in vivo* исследования CYP опосредованного метаболизма не обнаружили ни ингибирующего, ни индуцирующего действия на CYP2C19 и CYP2E1. Применение итоприда не оказывало влияние на CYP, а также на активность уридиндифосфат-глюкоронилтрансферазы.

Выведение

Итоприд и его метаболиты выводятся главным образом с мочой. Количество выведенного с мочой итоприда и N- оксида после перорального приема одноразовой терапевтической дозы у здоровых добровольцев составляло 3,7% и 75,4%, соответственно.

Период полувыведения итоприда составляет приблизительно 6 часов.

Показания к применению

Лекарственное средство предназначено для лечения функциональных гастроинтестинальных симптомов, функциональной диспепсии с ощущениями вздутия живота, переполненного желудка, от дискомфорта до болезненного ощущения в области эпигастрия.

Способ применения и дозы

Таблетки следует глотать целиком, запивая достаточным количеством жидкости.

Дозировка

Рекомендуемая суточная доза для взрослых составляет 150 мг, т.е. по 1 таблетке 3 раза в сутки перед едой. Доза может быть уменьшена в зависимости от заболевания. Точная дозировка и продолжительность лечения зависит от клинического состояния пациента. В клинических испытаниях максимальный период применения лекарственного средства составлял 8 недель.

Пациенты с нарушением функции печени или почек

Итоприд метаболизируется в печени, выводится в основном из организма посредством почек. Пациенты с нарушением функции печени или почек, должны находиться под тщательным контролем врача, а в случае неблагоприятных реакций, необходимо снизить дозу или прекратить лечение.

Дети и подростки

Безопасность применения препарата Итомед® 50 мг у педиатрической популяции в возрасте до 18 лет не была установлена.

Пожилые пациенты

Частота возникновения побочных реакций у пациентов старше 65 лет выше, чем у остальных пациентов. В связи с этим, необходимо соблюдать осторожность при применении лекарственного средства у лиц пожилого возраста.

Побочное действие

Наблюдаемые побочные явления можно сгруппировать по частоте встречаемости:

Очень часто ($>1/10$), часто ($>1/100$, $<1/10$), нечасто ($>1/1000$, $<1/100$), редко ($>1/10000$, $<1/1000$), очень редко ($<1/100000$), включая единичные случаи, неизвестные (невозможно определить исходя из доступных данных)

Со стороны ЦНС:

нечасто – головные боли, нарушение сна, головокружение.

неизвестно – тремор, раздражительность.

Со стороны пищеварительной системы:

Нечасто – запор, понос, боли в животе, повышенное слюноотделение

Неизвестно – тошнота.

Со стороны мочевыделительной системы:

Нечасто – повышение BUN (мочевинный азот в крови) и креатинина.

Со стороны опорно-двигательного аппарата и соединительной ткани:

Нечасто – боли в груди или в области спины.

Со стороны эндокринной системы:

Нечасто – повышение уровня пролактина (в случае появления галактореи или гинекомастии лечение необходимо прервать или совсем прекратить).

Со стороны кровеносной и лимфатической систем:

Нечасто – лейкопения (особое внимание следует уделять пациентам во время гематологического обследования. При появлении побочных реакций лечение должно быть приостановлено).

Неизвестно – тромбоцитопения.

Со стороны кожи и подкожной ткани

Редко – кожная сыпь, покраснение, зуд.

Со стороны иммунной системы:

Неизвестно – анафилактические реакции.

Общие нарушения и реакции в месте аппликации

Нечасто – усталость.

Со стороны печени и желчных протоков:

Неизвестно – желтуха.

Изменения лабораторных показателей:

Неизвестно – повышение активности аспартатаминотрансферазы (АСТ), аланинаминотрансферазы (АЛТ), гамма-глутамилтранспептидазы (ГГТП), щелочной фосфатазы и уровня билирубина.

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

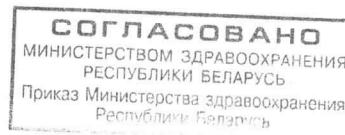
Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации лекарственного средства с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения польза/риск лекарственного средства. Необходимо проинформировать пациента о необходимости немедленно сообщать лечащему врачу о всех случаях возникновения нежелательных реакций, перечисленных в данной инструкции, а также не упомянутых в ней, и о случаях неэффективности лекарственного средства. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях или неэффективности лекарственного средства в Республиканское унитарное предприятие «Центр экспертиз и испытаний в здравоохранении» (<https://www.rceth.by>).

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к итроприду, а также к любому из вспомогательных веществ лекарственного средства;
- детский возраст;
- усиленная гастроинтестинальная моторика, гастроинтестинальное кровотечение, механическая обструкция или наличие перфорации;
- беременность и период кормления грудью.

Передозировка

Данные о передозировках лекарственного средства отсутствуют. При передозировке рекомендуется проводить промывание желудка и симптоматическую терапию.

**Специальные предупреждения и меры предосторожности при использовании**

Применение итоприда усиливает действие ацетилхолина и может вызывать побочные холинергические реакции.

Итомед® содержит лактозу, в связи с этим пациентам, страдающим редкими наследственными заболеваниями, такими как непереносимость галактозы, дефицит лактазы Лаппа или синдром мальабсорбции глюкозы и галактозы, не следует принимать данное лекарственное средство.

Данные о долговременном применении лекарственного средства отсутствуют.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Антихолинергические вещества снижают эффективность итоприда.

Взаимодействий при одновременном приеме итоприда с варфарином, диазепамом, диклофенаком, тиклопидином, нифедипином и никардипином не обнаружено.

Итоприд усиливает моторику желудка, поэтому он может повлиять на всасывание других лекарственных средств, которые назначают внутрь. Особую осторожность следует соблюдать при применении лекарственных средств с низким терапевтическим индексом, а также форм с замедленным высвобождением активного вещества или с кишечнорастворимой оболочкой.

Противоязвенные средства, такие как циметидин, ранитидин, тетролон и цетрекسات не влияют на прокинетическую эффективность итоприда.

Взаимодействие на уровне цитохрома P450 не предполагается, так как метаболизм итоприда происходит главным образом посредством флаavin монооксигеназы.

Беременность и период лактации

Безопасность применения лекарственного средства во время беременности не была установлена. Поэтому, во время беременности и в случае предполагаемой беременности, применение итоприда возможно только в случае, когда терапевтические преимущества превышают потенциальный риск.

Из-за отсутствия данных о проникновении итоприда в грудное молоко, применение данного лекарственного средства в период кормления грудью не рекомендуется.

Влияние на способность вождения автотранспорта и управления механизмами

Хотя влияния Итомеда® на способность вождения автотранспорта и управления механизмами не было обнаружено, при его применении нельзя исключить снижение концентрации внимания в связи с тем, что в очень редких случаях прием лекарственного средства может сопровождаться возникновением головокружений.

Доклинические данные относительно безопасности лекарственного средства

Летальная доза при пероральном однократном введении у лабораторных мышей и крыс составляла 2000 мг/кг, а у собак – 600 мг/кг.

Доклинические исследования безопасности проводились с дозами, значительно превышающими терапевтические дозы для людей, в связи с этим обнаруженные последствия имеют лишь небольшое значение для использования итоприда у людей. Кроме того, некоторые люди проявляют значительно меньшую чувствительность по сравнению с животными.

Высокие дозы итоприда (30 мг/кг/сутки) вызывали у лабораторных крыс гиперпролактинемия и вторичную реверсивную гиперплазию слизистой матки. Подобных проявлений у собак (при дозе до 100 мг/кг/сутки) и у обезьян (при дозе до 300 мг/кг/сутки) выявить не удалось.

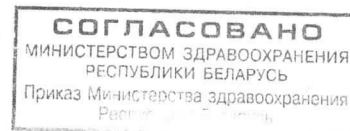
3-х месячное исследование токсичности, проведенное на собаках, выявило атрофию простаты после перорального введения собакам дозы 30 мг/кг/сутки, однако подобного эффекта у лабораторных крыс и у обезьян обнаружить не удалось даже после 6-ти месячного перорального введения дозы 100 мг/кг/сутки, и 300 мг/кг/сутки, соответственно.

Долгосрочные исследования канцерогенности Итомеда® не проводились.

В сериях тестов, проведенных *in vitro* и *in vivo*, кластогенный и мутагенный эффекты итоприда не были обнаружены.

Исследования фертильности у лабораторных крыс обнаружили гиперпролактинемия и секундарное продление цикла течки после применения дозы 30 мг/кг/сутки и выше. При дозах 300

НД РБ
9588 - 2021



мг/кг/сутки отмечался более длительный предкоитальный интервал. Нежелательного воздействия на копуляцию и фертильность не было обнаружено.

Несовместимость

Неизвестна.

Срок годности

5 лет. Не применять после окончания срока годности!

Условия хранения

Не требует специальных условий хранения. Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

Блистер по 20 таблеток из ПВХ/ПВДХ/алюминевой фольги, 2 и 5 блистеров вместе с инструкцией по применению в картонной коробке.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

ПРОИЗВОДИТЕЛЬ, ВЛАДЕЛЕЦ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

PRO.MED.CS Praha a.s.
Telčská 377/1, Michle
140 00 Praha 4
Česká republika

ПРО.МЕД.ЦС Прага а.о.
ул. Телчка 377/1, Михле
140 00 Прага 4
Чешская Республика