

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

ІТОМЕД®

(ІТОМЕД®)

Склад:

діюча речовина: ітоприду гідрохлорид;

1 таблетка містить 50 мг ітоприду гідрохлориду;

допоміжні речовини: лактоза, моногідрат; крохмаль прежелатинізований; натрію кроскармелоза; кремнію діоксид колоїдний безводний; магнію стеарат; Opadry II White 85F 18422 (титану діоксид (E 171), спирт полівініловий, тальк, поліетиленгліколь).

Лікарська форма. Таблетки, вкриті плівковою оболонкою.

Основні фізико-хімічні властивості: білі або майже білі таблетки, вкриті плівковою оболонкою, двоопуклі, з рискою з одного боку, діаметром близько 7 мм.

Фармакотерапевтична група. Засоби, що застосовуються при функціональних розладах травного тракту. Стимулятори перистальтики. Код АТХ А03F А.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Ітоприду гідрохлорид активує пропульсивну моторику шлунково-кишкового тракту завдяки антагонізму з допаміновими D₂-рецепторами та інгібуючій активності ацетилхолінестерази. Ітоприду гідрохлорид активує вивільнення ацетилхоліну та інгібує його розпад.

Ітоприду гідрохлорид також чинить протиблювальну дію завдяки взаємодії з

D₂-рецепторами, локалізованими в хеморецепторній тригерній зоні, що було продемонстровано дозозалежним інгібуванням апоморфініндукованого блювання у тварин.

Дія ітоприду гідрохлориду є високоспецифічною відносно верхніх відділів шлунково-кишкового тракту.

Ітоприду гідрохлорид не впливає на рівень гастрину в сироватці крові.

Ітоприду гідрохлорид прискорює евакуацію шлункового вмісту, поліпшує гастродуоденальну координацію, стимулює проходження кишкового вмісту.

Фармакокінетика.

Абсорбція.

Ітоприду гідрохлорид швидко та майже повністю всмоктується у шлунково-кишковому тракті. Його відносна біодоступність становить 60 %, що пов'язано з метаболізмом при «першому проходженні» через печінку (пресистемний метаболізм). Вживання їжі не впливає на біодоступність препарату. Максимальна концентрація препарату $C_{\max}$ у плазмі крові досягається протягом 30-45 хвилин після прийому 50 мг ітоприду гідрохлориду та становить 0,28 мкг/мл. Не проникає через гематоенцефалічний бар'єр та в клітини провідної системи міокарда.

При подальшому застосуванні лікарського засобу в дозах від 50 до 200 мг три рази на добу впродовж 7 днів фармакокінетика ітоприду гідрохлориду та його метаболітів була лінійною з мінімальною кумуляцією препарату.

Розподіл.

Приблизно 96 % ітоприду гідрохлориду зв'язується з білками плазми крові (переважно з альбуміном). Зв'язування з альфа-1-кислим глікопротеїном становить менше 15 %.

Дослідження на тваринах виявили, що ітоприду гідрохлорид значною мірою розподіляється в різні тканини (об'єм розподілу 6,1 л/кг), за винятком центральної нервової системи; високі концентрації препарату досягаються у нирках, тонкому кишечнику, печінці, надниркових залозах та шлунку. Проникнення препарату у ЦНС є мінімальним. Ітоприду гідрохлорид проникає у грудне молоко тварин.

Метаболізм.

У людини ітоприду гідрохлорид зазнає інтенсивного метаболізму у печінці. Ідентифіковані 3 метаболіти препарату, з яких лише один проявляє незначну активність, що не є фармакологічно значущою (приблизно 2-3 % від фармакологічної активності ітоприду гідрохлориду). Головним метаболітом у людини є N-оксид, що утворюється в результаті окиснення четвертинної аміно-N-диметильної групи.

Ітоприду гідрохлорид метаболізується під дією флавінзалежної монооксигенази (FMO). Кількість та ефективність FMO-ізоферментів у людини може відрізнятися залежно від генетичного поліморфізму, що інколи може призводити до рідкісного аутосомно-рецесивного порушення, відомого під назвою «триметиламініурія» (синдром «риб'ячого запаху»). Період напіввиведення $T_{1/2}$ ітоприду гідрохлориду у пацієнтів із триметиламініурією може бути більш тривалим.

Згідно з даними фармакокінетичних досліджень *in vivo* ітоприду гідрохлорид не чинить інгібуючої або індукуючої дії відносно CYP2C19 і CYP2E1. Застосування ітоприду гідрохлориду не впливало на вміст CYP-ферментів або активність уридин-дифосфат-глюкуронозил-трансферази.

Виведення.

Ітоприду гідрохлорид та його метаболіти виводяться переважно із сечею. У здорових добровольців після разового перорального прийому терапевтичної дози препарату екскреція ітоприду та його метаболіту N-оксиду становила 3,7 % і 75,4 % відповідно.

Період напіввиведення ітоприду гідрохлориду становить приблизно 6 годин.

Клінічні характеристики.

Показання.

Купірування шлунково-кишкових симптомів функціональної невиразкової диспепсії (хронічного гастриту), а саме:

- здуття живота;
- відчуття швидкого перенасичення;
- біль та дискомфорт у верхній частині живота;
- печія;
- нудота;
- блювання;
- анорексія.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до діючої речовини або до будь-якого компонента препарату.

Стани, при яких підвищення скорочувальної активності шлунково-кишкового тракту може бути шкідливим, наприклад при шлунково-кишковій кровотечі, механічній обструкції або перфорації.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Метаболічні взаємодії не очікуються у зв'язку з тим, що ітоприду гідрохлорид первинно метаболізується флавінмонооксигеназою, а не ізоферментами системи цитохрому P450.

Не спостерігалось будь-яких змін щодо зв'язування з білками при одночасному застосуванні з варфарином, діазепамом, диклофенаком натрію, тиклопідину гідрохлоридом, ніфедипіном та нікардипіну гідрохлоридом. У зв'язку з тим, що ітоприду гідрохлорид посилює моторику шлунка, він може впливати на процес всмоктування інших лікарських засобів при одночасному застосуванні. Особливо обережним необхідно бути при застосуванні лікарських засобів з низьким терапевтичним індексом, лікарських форм з уповільненим вивільненням або з кишковорозчинною оболонкою.

Противиразкові лікарські засоби, такі як циметидин, ранітидин, тепренон та цетраксат, не впливають на прокінетичну дію ітоприду гідрохлориду.

Антихолінергічні лікарські засоби можуть знижувати лікувальний ефект ітоприду гідрохлориду.

Особливості застосування.

Ітоприду гідрохлорид посилює дію ацетилхоліну та може проявляти холінергічні побічні реакції. Дані довготривалого застосування відсутні.

Особам літнього віку, враховуючи зниження у них функції печінки і нирок та супутніх захворювань або супутньої терапії іншими лікарськими засобами, при застосуванні ітоприду слід дотримуватись обережності у зв'язку з можливим частішим розвитком побічних реакцій.

У разі пропуску прийому дози її необхідно прийняти якнайшвидше; не застосовувати, якщо настав час прийому наступної дози; не подвоювати дози.

Препарат містить лактозу, тому пацієнтам з рідкісними спадковими формами непереносимості галактози, недостатністю лактази Лаппа або синдромом глюкозо-галактозної мальабсорбції не можна застосовувати препарат.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Вагітність.

Безпека застосування ітоприду гідрохлориду у період вагітності не встановлена. Тому ітоприду гідрохлорид не слід застосовувати у період вагітності, окрім випадків, коли очікувана користь від застосування препарату перевищує можливий ризик.

Період годування груддю.

Ітоприду гідрохлорид проникає у грудне молоко, що було доведено у процесі досліджень на тваринах. З метою запобігання виникненню побічних реакцій у немовлят має бути прийнято відповідне рішення щодо припинення годування груддю або припинення лікування, беручи до уваги важливість терапії для матері.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

Інформація щодо можливого впливу на швидкість реакції відсутня, але під час вирішення питання щодо керування автотранспортом або роботи з іншими механізмами необхідно врахувати можливість виникнення запаморочення.

Спосіб застосування та дози.

Дорослим призначати по 1 таблетці (50 мг) 3 рази на добу до прийому їжі, не розжовуючи і запиваючи достатньою кількістю води.

Рекомендована добова доза становить 150 мг. Зазначена доза бути зменшена з урахуванням клінічної симптоматики, віку пацієнта (див. «Особливості застосування»).

Пацієнтам з порушеннями функції печінки та нирок застосування препарату слід проводити під належним контролем лікаря, в разі необхідності треба зменшити дозу або припинити терапію.

Тривалість лікування визначає лікар. Під час клінічних досліджень тривалість застосування ітоприду гідрохлориду становила до 8 тижнів.

Діти.

Препарат не застосовувати дітям.

Передозування.

Про випадки передозування не повідомлялося.

Лікування. У випадку надмірного передозування необхідно вжити звичайних заходів щодо промивання шлунка та провести симптоматичне лікування.

Побічні реакції.

Побічні реакції, про які повідомлялося протягом клінічних досліджень.

Під час клінічних досліджень (I-III фази) ітоприду гідрохлорид переносився добре, про розвиток серйозних побічних реакцій не повідомлялося. Загалом повідомлялося про

19 випадків виникнення побічних реакцій, які спостерігались у 14 з 572 пацієнтів, що становить 2,4 %. Більшість зазначених побічних реакцій, що спостерігались більше ніж у одного пацієнта, становили: діарея (0,7 %), головний біль (0,3 %), біль у животі (0,3 %).

Відхилення лабораторних показників, що спостерігались під час клінічних досліджень: зниження рівня лейкоцитів (лейкопенія) (0,7 %), підвищення рівня пролактину (0,3 %).

Побічні реакції, про які повідомлялося протягом постмаркетингового спостереження та у ході клінічних досліджень, що продовжуються, у пацієнтів, які отримували лікування ітоприду гідрохлоридом:

З боку системи крові та лімфатичної системи: лейкопенія, тромбоцитопенія.

З боку травної системи: діарея, запор, біль у животі, підвищене слиновиділення, нудота.

З боку печінки та жовчовивідних шляхів: жовтяниця.

З боку імунної системи: анафілактична реакція.

З боку ендокринної системи: можливе підвищення рівня пролактину крові, гінекомастія або галакторея. У випадку, коли, наприклад, виникають галакторея або гінекомастія, необхідно тимчасово припинити або повністю відмінити прийом препарату.

З боку нервової системи: запаморочення, головний біль, безсоння, тремор.

З боку нирок та сечовивідних шляхів: підвищення рівня креатиніну крові; підвищення рівня креатиніну в сечі.

З боку шкіри і підшкірної клітковини: алергічні реакції (висипання, почервоніння, свербіж).

Інші:

підвищена втомлюваність, роздратування.

Лабораторні дослідження: підвищення рівнів АСТ, АЛТ, ГГТ, лужної фосфатази, білірубину.

Термін придатності.

5 років.

Умови зберігання.

Зберігати в недоступному для дітей місці. Не потрібні спеціальні умови зберігання.

Упаковка.

По 15 таблеток у блістері, по 1 блістеру у картонній коробці.

По 20 таблеток у блістері, по 2 або 5 блістерів у картонній коробці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник.

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

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

Телчска 377/1, Міхле, Прага 4, 140 00, Чеська Республіка

(Telcska 377/1, Michle, Praha 4, 140 00, Czech Republic).