

ИНСТРУКЦИЯ
по применению лекарственного препарата для медицинского применения
ГАНАТОН®

Регистрационный номер: ЛС-002513

Торговое название препарата: Ганатон®

Международное непатентованное название (МНН): итоприд

Химическое название: N-[4-[2-(диметиламино)этокси]бензил]-3,4-диметоксибензамида гидрохлорид.

Лекарственная форма: таблетки покрытые пленочной оболочкой.

Состав

1 таблетка покрытая пленочной оболочкой содержит:

Активное вещество: итоприда гидрохлорид 50 мг;

Вспомогательные вещества: лактоза – 34,975 мг (включая избыток вследствие потери в массе при производстве – 2,93%), крахмал кукурузный – 15 мг, кармеллоза – 20 мг, кислота кремневая безводная (кремния диоксид) – 4 мг, магния стеарат – 1 мг; *Состав пленочной оболочки:* гидроксипропилметилцеллюлоза 2910 (гипромеллоза) – 4,4 мг, макрогол 6000 – 0,4 мг, титана диоксид – 0,2 мг, воск карнауба – 0,025 мг.

Описание: белые круглые таблетки, покрытые пленочной оболочкой, с риской на одной стороне и гравировкой «НС 803» на другой.

Фармакотерапевтическая группа – моторики ЖКТ стимулятор – ацетилхолина выброса стимулятор.

Код АТХ – А03FA.

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

Механизм действия

Итоприда гидрохлорид усиливает моторику ЖКТ за счет антагонизма D₂-допаминовых рецепторов и ингибирования ацетилхолинэстеразы. Итоприд активирует высвобождение ацетилхолина и подавляет его разрушение.

Фармакодинамика

Итоприда гидрохлорид дает также противорвотный эффект за счет взаимодействия с D₂-рецепторами, расположенными в триггерной зоне. Итоприд вызывал дозозависимое подавление рвоты, вызванной апоморфином.

Итоприда гидрохлорид активирует пропульсивную моторику желудка за счет антагонизма D₂-рецепторов и дозозависимого ингибирования активности ацетилхолинэстеразы.

Итоприда гидрохлорид оказывает специфическое действие на верхний отдел ЖКТ, ускоряет транзит по желудку и улучшает его опорожнение.

Итоприда гидрохлорид не влияет на сывороточные уровни гастрина.

Фармакокинетика

Всасывание

Итоприда гидрохлорид быстро и практически полностью всасывается в ЖКТ. Относительная биодоступность его составляет 60%, что связано с метаболизмом при первом прохождении через печень. Пища не оказывает влияния на биодоступность. Максимальная концентрация в плазме (C_{\max}) 0,28 мкг/мл достигается через 0,5-0,75 ч после приема 50 мг итоприда гидрохлорида.

При повторном приеме итоприда гидрохлорида внутрь в дозе 50-200 мг три раза в сутки в течение 7 дней фармакокинетика препарата и его метаболитов была линейной, а кумуляция оказалась минимальной.

Распределение

Итоприда гидрохлорид на 96% связывается с белками плазмы, в основном с альбумином. Связывание с альфа1-кислым гликопротеином составляет менее 15% от общего связывания.

Итоприд активно распределяется в ткани (объем распределения 6,1 л/кг) и обнаруживается в высоких концентрациях в почках, тонком кишечнике, печени, надпочечниках и желудке. Проникновение в головной и спинной мозг минимальное. Итоприд проникает в грудное молоко.

Метаболизм

Итоприд подвергается активной биотрансформации в печени у человека. Идентифицированы 3 метаболита, только один из которых проявляет небольшую активность, которая не имеет фармакологического значения (примерно 2-3% от таковой итоприда). Первичным метаболитом у человека является N-оксид, который образуется в результате окисления четвертичной амино-N-диметильной группы.

Итоприд метаболизируется под действием флаavin-зависимой монооксигеназы (FMO3). Количество и эффективность изоферментов FMO у человека может отличаться в зависимости от генетического полиморфизма, который в редких случаях приводит к развитию аутосомно-рецессивного состояния, известного под названием триметиламинурии (синдром "запаха рыбы"). У больных с триметиламинурией период полуэлиминации итоприда увеличивается.

По данным фармакокинетических исследований *in vivo*, итоприд не оказывает ингибирующего или индуцирующего действия на CYP2C19 и CYP2E1. Терапия итопридом не влияет на CYP или активность уридиндифосфатглюкуронизилтрансферазы.

Выведение

Итоприда гидрохлорид и его метаболиты выводятся в основном с мочой. Почечная экскреция итоприда и его N-оксида после однократного приема препарата внутрь в терапевтических дозах у здоровых людей составляла 3,7 и 75,4% соответственно. Терминальный период полуэлиминации итоприда гидрохлорида равняется около 6 ч.

ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ

Применяют для лечения желудочно-кишечных симптомов, связанных с замедленной моторикой желудка и функциональной неязвенной диспепсией (хроническим гастритом), таких как: вздутие живота, быстрое насыщение, чувство переполнения в желудке после приема пищи, боль или дискомфорт в эпигастриальной области, анорексия, изжога, тошнота и рвота.

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

- повышенная чувствительность к итоприду или любому вспомогательному компоненту препарата;
- пациенты с желудочно-кишечным кровотечением, механической обструкцией или перфорацией;

- детский возраст (до 16 лет);
- беременность и период лактации.

С ОСТОРОЖНОСТЬЮ

Вследствие усиления итопридом действия ацетилхолина, следует назначать с осторожностью из-за возможного развития холинэргических побочных реакций у категории пациентов, для которых их появление может усугубить течение основного заболевания.

Итоприд следует назначать с осторожностью пациентам пожилого возраста в связи с частым снижением функции печени и почек, наличием сопутствующих заболеваний или другого лечения.

ПРИМЕНЕНИЕ ПРИ БЕРЕМЕННОСТИ И В ПЕРИОД ГРУДНОГО ВСКАРМЛИВАНИЯ

Беременность

Нет достаточных данных применения итоприда гидрохлорида беременными. Применение во время беременности возможно только в случае, когда отсутствует альтернативная терапия, а потенциальная польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

Период грудного вскармливания

Существует потенциальный риск развития побочных реакций у грудного ребенка, также имеются данные о выделении итоприда с молоком у крыс. При необходимости приема в период лактации, грудное вскармливание необходимо прекратить.

СПОСОБ ПРИМЕНЕНИЯ И ДОЗЫ

Обычно взрослым назначают внутрь по 1 таблетке препарата Ганатон® 50 мг 3 раза в сутки до еды. Рекомендуемая суточная доза составляет 150 мг. Указанная доза может быть снижена с учетом возраста и симптомов больного.

В клинических исследованиях продолжительность лечения препаратом Ганатон® была до 8 недель.

ПОБОЧНОЕ ДЕЙСТВИЕ

Со стороны крови и лимфатической системы: лейкопения, тромбоцитопения.

Аллергические реакции: гиперемия кожи, кожный зуд, сыпь, анафилаксия.

Эндокринные нарушения: повышение уровня пролактина, гинекомастия.

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

Со стороны ЖКТ: диарея, запор, боль в животе, повышенное слюноотделение, тошнота, желтуха.

Изменения лабораторных показателей: повышение активности аспаратаминотрансферазы (АСТ), аланинаминотрансферазы (АЛТ), гаммаглутамилтранспептидазы, щелочной фосфатазы и уровня билирубина.

ПЕРЕДОЗИРОВКА

Случаи передозировки у человека не описаны. При передозировке показаны промывание желудка и симптоматическая терапия.

ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ С ДРУГИМИ ЛЕКАРСТВЕННЫМИ СРЕДСТВАМИ

Метаболическое взаимодействие вряд ли возможно, так как итоприд метаболизируется под действием флавиновой монооксигеназы, а не CYP450.

При одновременном применении варфарина, диазелама, диклофенака натрия, тиклопидина гидрохлорида, нифедипина и никардипина гидрохлорида изменений связывания с белками не наблюдали.

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

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

Антихолинергические средства могут ослабить эффект итоприда.

ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ

Итоприд усиливает действие ацетилхолина и может вызвать холинэргические побочные реакции.

ФОРМА ВЫПУСКА

Таблетки покрытые пленочной оболочкой, 50 мг.

По 7, 10 или 14 таблеток в блистере из ПВХ/Al-фольги. По 1, 2, 3, 4 или 5 блистеров вместе с инструкцией по применению в картонной пачке.

УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ

Хранить при температуре не выше 25 °С, в сухом, защищенном от света месте.

Хранить в недоступном для детей месте!

СРОК ГОДНОСТИ

5 лет. Не применять после истечения срока годности, указанного на упаковке.

УСЛОВИЯ ОТПУСКА

По рецепту

ПРОИЗВОДИТЕЛЬ

Майлан ЕПД Г.К., Кацуяма Планта

2-1, Инокучи 37,

Кацуяма, Фукуй 911-8555, Япония

Организация, уполномоченная производителем на принятие претензий от потребителей:

ООО «Эбботт Лэбораториз»

125171, Москва, Ленинградское шоссе,

дом 16а, стр. 1.

Тел.: +7 (495) 258 42 80

Факс: +7 (495) 258 42 81

abbott-russia@abbott.com