МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ И СОЦИАЛЬНОГО РАЗВИТИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ
по применению лекарственного препарата для медицинского применения
ГАНАТОН

Регистрационный номер:

Торговое название препарата: Ганатон

Международное непатентованное название (МНН): итоприд
Химическое название: N-[4-[2-(диметиламино)этокси]бензил]-3,4-диметоксибензамина гидрохлорид.
Лекарственная форма: таблетки, покрытые оболочкой.
Состав: активное вещество – итоприда гидрохлорид 50 мг; вспомогательные компоненты (мг в 1 таблетке): лактоза – 34,975 (включая избыток вследствие потери в массе при производстве – 2,93%), крахмал кукурузный – 15,0, кармеллоза – 20,0, кислота кремневая безводная – 4,0, магния стеарат – 1,0, гипромеллоза – 4,4, макрогол 6000 – 0,4, титана диоксид – 0,2, воск карнауба – 0,025.

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 – A03FA.

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

Механизм действия
Итоприда гидрохлорид усиливает моторику ЖКТ за счет антагонизма D_2-допаминовых рецепторов и ингибирования ацетилхолинэстеразы. Итоприд активирует высвобождение ацетилхолина и подавляет его разрушение.

Фармакодинамика
Итоприда гидрохлорид дает также противорвотный эффект за счет взаимодействия с D_2-рецепторами, расположенными в триггерной зоне. Итоприд вызывал дозозависимое подавление рвоты, вызванной апоморфином.
Итоприда гидрохлорид активирует пропульсивную моторику желудка за счет антагонизма D_2-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 флавин-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

Итоприда гидрохлорид применяют для симптоматического лечения функциональной неязвенной диспепсии (хронического гастрита), в частности купирования вздутия живота, быстрого насыщения, боли или дискомфорта в верхней половине живота, анорексии, изжоги, тошноты и рвоты.

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 применяется
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.

Применение в период беременности и при кормлении грудью
Применять Ганатон во время беременности и лактации рекомендуется только в тех случаях, когда нет более безопасной альтернативы, а ожидаемая польза перевешивает возможный риск.

СПОСОБ ПРИМЕНЕНИЯ И ДОЗЫ

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

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 аспартатаминотрансферазы (АСТ), аланинаминотрансферазы (АЛТ), гаммаглютамилтранспептидазы, 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, диазепама, 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 кишечно-растворимой оболочкой.
Противоязвенные средства, такие как циметидин, ранитидин, тепренон и цетраксат, не влияют на прокинетическое действие итоприда.
Антихолинергические средства могут ослабить эффект итоприда.

ФОРМА ВЫПУСКА
Таблетки, покрытые оболочкой, 50 мг.
По 7, 10 или 14 таблеток в блистер из ПВХ/AL-фольги. 1, 2, 3, 4 или 5 блистеров с инструкцией по применению в картонной пачке.

УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ
Список Б. При температуре ниже 25°С, в сухом, защищенном от света месте. Препарат следует хранить в местах, недоступных для детей.

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

УСЛОВИЯ ОТПУСКА ИЗ АПТЕК
По рецепту

НАЗВАНИЕ И АДРЕС ПРОИЗВОДИТЕЛЯ
Для препарата упакованного Эбботт ГмбХ и Ко.КГ, Германия:
Эбботт ГмбХ и Ко.КГ [Германия],
произведено Эбботт Джапан Ко. Лтд, Япония
Аккредитованное представительство фирмы
«Эбботт Лэбораториз С.А.» в России
107031, Москва, Дмитровский пер. д. 9.
Тел. (495) 258 42 70

Для препарата упакованного Эбботт Джапан Ко. Лтд, Япония:
Эбботт Джапан Ко. Лтд, Япония
Abbott Japan Co. Ltd, Japan
Кацуяма Плант 2-1, Инокути 37, Кацуяма Фуки 911-8555, Япония
Katsuyama Plant 2-1, Inokuchi 37, Katsuyama Fukui 911-8555, Japan
Представительство в России
ООО Эбботт Лэбораториз,
141400 Московская область, г. Химки, ул. Ленинградская,
владение 39, стр.5, Химки Бизнес Парк
тел. (495) 258 42 70
факс (495) 258 42 71

RUS/GAN — January 13, 2006
CCDS03441004 — December 20, 2004

Специалист по регистрации
ООО «Эбботт Лэбораториз» Делакова А.В.