

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**

Актиприд Солюшн Таблетс, 50 мг, таблетки диспергируемые.

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: итоприд.

Каждая таблетка диспергируемая содержит 50 мг итоприда (в виде гидрохлорида).

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: аспартам (см. раздел 4.4).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки диспергируемые.

Круглые двояковыпуклые таблетки белого или почти белого цвета с характерным запахом.

Допускается незначительная шероховатость поверхности.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ**4.1. Показания к применению**

Препарат Актиприд Солюшн Таблетс показан к применению у взрослых и детей в возрасте от 16 до 18 лет по показаниям:

- для лечения желудочно-кишечных симптомов, связанных с нарушением моторики желудка или его замедленным опорожнением, таких как вздутие живота, быстрое насыщение, чувство переполнения в желудке после приема пищи, боль или дискомфорт в эпигастральной области, снижение аппетита, изжога, тошнота и рвота;
- функциональная (неязвенная) диспепсия или хронический гастрит.

4.2. Режим дозирования и способ применения**Режим дозирования**

Рекомендуемый режим дозирования у взрослых по 50 мг (1 таблетка) препарата 3 раза в сутки.

Рекомендуемая суточная доза составляет 150 мг. Указанная доза может быть снижена с учетом возраста и симптомов пациента.

В клинических исследованиях продолжительность лечения составляла до 8 недель.

Дети

Режим дозирования для детей от 16 до 18 лет не отличается от режима дозирования для взрослых.

Безопасность и эффективность итоприда у детей в возрасте от 0 до 16 лет на данный момент не установлены. Данные отсутствуют.

Способ применения

Внутрь, до еды.

Растворить таблетку, как минимум, в 50 мл (1/4 стакана) воды, тщательно перемешать до получения однородной суспензии и выпить полученную суспензию сразу после приготовления.

4.3. Противопоказания

- гиперчувствительность к итоприду и/или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1;
- пациенты с желудочно-кишечным кровотечением, механической обструкцией или перфорацией;

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

Итоприд усиливает действие ацетилхолина, что может вызывать холинергические побочные реакции. Препарат следует назначать с осторожностью категории пациентов, для которых появление таких реакций может усугубить течение основного заболевания.

Пациентам пожилого возраста итоприд следует назначать с осторожностью, учитывая более высокую частоту снижения функции печени и почек, наличие сопутствующих заболеваний или другое лечение.

Данные о длительном применении препарата отсутствуют.

Вспомогательные вещества

Препарат Актиприд Солюшн Таблетс содержит аспартам, источник фенилаланина, который может оказаться вредным для людей с фенилкетонурией.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Метаболическое взаимодействие не ожидается, так как итоприд первично метаболизируется под действием флавиновой монооксигеназы, а не с участием системы цитохрома CYP450.

При одновременном применении варфарина, диазепама, диклофенака натрия, тиклопидина

гидрохлорида, нифедипина и никардипина гидрохлорида изменений связывания с белками не наблюдалось.

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

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

Антихолинергические средства могут ослабить эффект итоприда.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

На данный момент имеется ограниченное количество данных (менее 300 исходов беременности) по применению итоприда у беременных женщин. Исследования на животных не выявили признаков прямого или непрямого отрицательного влияния итоприда, указывающих на репродуктивную токсичность. В целях предосторожности следует избегать применения итоприда при беременности.

Лактация

Итоприд выделяется с молоком у животных, однако на данный момент отсутствует достаточное количество данных о выделении итоприда с грудным молоком у человека. При кормлении грудью нельзя исключать риск влияния препарата на ребенка. Решение о прекращении грудного вскармливания или отмене/перерыве в приеме препарата следует принимать, основываясь на оценке пользы грудного вскармливания и пользы препарата для матери.

Фертильность

Данные о влиянии итоприда на фертильность у человека отсутствуют. Тем не менее исследования на животных не выявили признаков отрицательного влияния препарата на фертильность.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

Исследований относительно влияния итоприда на способность к управлению автомобилем и механизмами не проводилось.

Однако в период лечения препаратом следует соблюдать осторожность при выполнении потенциально опасных видов деятельности, требующих повышенной концентрации

внимания и быстроты психомоторных реакций (управление транспортными средствами, работа с движущимися механизмами, работа диспетчера и оператора), так как применение препарата может вызвать головокружение.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме нежелательных реакций

Следующие побочные эффекты наблюдались у 998 пациентов при применении итоприда в стандартной суточной дозе 150 мг или ниже в ходе 4 плацебо-контролируемых, 4 сравнительных и 13 неконтролируемых интервенционных клинических исследованиях с частотой *часто* ($\geq 1/100$ до $< 1/10$) и *нечасто* ($\geq 1/1000$ до $< 1/100$). В категориях с частотой *очень часто* ($\geq 1/10$), *редко* ($\geq 1/10\,000$ до $< 1/1000$) или *очень редко* ($< 1/10\,000$) нежелательных реакций не наблюдалось.

Система органов по классификации медицинского словаря для нормативно-правовой деятельности (MedDRA)	Частота	Нежелательные эффекты
<i>Нарушения со стороны нервной системы</i>	Нечасто	Головокружение, головная боль.
<i>Желудочно-кишечные нарушения</i>	Часто Нечасто	Боль в животе, диарея. Повышенное слюноотделение.
<i>Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей</i>	Нечасто	Сыпь.
<i>Лабораторные и инструментальные данные</i>	Нечасто	Повышение активности аланинаминотрансферазы (АЛТ), снижение количества лейкоцитов.

Следующие побочные эффекты были выявлены в ходе пострегистрационного применения, исходя из имеющихся данных, оценить их частоту не представляется возможным.

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы

Частота неизвестна: лейкопения и тромбоцитопения.

Нарушения со стороны иммунной системы

Частота неизвестна: реакции гиперчувствительности, включая анафилактическую реакцию.

Эндокринные нарушения

Частота неизвестна: повышение уровня пролактина в крови.

Нарушения со стороны нервной системы

Частота неизвестна: головокружение, головная боль, тремор.

Желудочно-кишечные нарушения

Частота неизвестна: диарея, запор, боль в животе, повышенное слюноотделение и тошнота.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей

Частота неизвестна: желтуха.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей

Частота неизвестна: сыпь, эритема и зуд.

Нарушения со стороны репродуктивной системы и молочных желез

Частота неизвестна: гинекомастия.

Лабораторные и инструментальные данные

Частота неизвестна: повышение активности аспартатаминотрансферазы (АСТ), АЛТ, гамма-глутамилтранспептидазы, щелочной фосфатазы и уровня билирубина.

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации лекарственного препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза – риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств – членов Евразийского экономического союза.

Российская Федерация

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения (Росздравнадзор)

109012, г. Москва, Славянская площадь, д. 4, стр. 1

Телефон: +7 (800) 550-99-03

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»:

<https://www.roszdravnadzor.gov.ru/>

4.9. Передозировка

При передозировке показаны промывание желудка и симптоматическая терапия.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: препараты для лечения функциональных расстройств

желудочно-кишечного тракта; стимуляторы моторики желудочно-кишечного тракта.

Код АТХ: A03FA07

Механизм действия и фармакодинамические эффекты

Итоприда гидрохлорид – это гастропрокинетики для приема внутрь.

Итоприд характеризуется двойным механизмом действия: антагонизм к D₂-дофаминовым рецепторам и ингибирование ацетилхолинэстеразы. В результате действия итоприда увеличивается концентрация ацетилхолина, что приводит к усилению моторики желудка, повышению тонуса нижнего пищеводного сфинктера (НПС), ускорению процесса опорожнения желудка и улучшению гастродуоденальной координации.

Итоприда гидрохлорид также оказывает противорвотный эффект за счет взаимодействия с D₂-дофаминовыми рецепторами, расположенными в хеморецепторной триггерной зоне продолговатого мозга. Итоприд вызывает дозозависимое подавление рвоты, вызванной апоморфином.

Действие препарата у пациентов с функциональной диспепсией приводит к снижению выраженности симптомов (общая оценка пациентом, постпрандиальная тяжесть в животе, раннее насыщение). Применение итоприда пациентами с диабетическим гастропарезом способствовало ускорению эвакуации из желудка жидкой и твердой пищи. У пациентов с гастроэзофагеальной рефлюксной болезнью итоприд уменьшает количество переходящих расслаблений НПС и уменьшает продолжительность времени с высокой кислотностью в пищеводе (pH < 4).

При совместном применении итоприда гидрохлорида с альфа-липоевой кислотой наблюдалось ускорение процесса опорожнения желудка и снижение уровня гастрина и мотилина в сравнении с монотерапией итопридом.

Итоприда гидрохлорид оказывает высокоспецифичное действие на верхний отдел ЖКТ, ускоряет опорожнение желудка.

Не влияет на сывороточные уровни гастрина.

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

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

При повторном приеме итоприда гидрохлорида внутрь в дозе 50-200 мг 3 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 крови, в основном с альбумином. Связывание с альфа-1-кислым гликопротеином составляет менее 15 % от общего связывания.

Итоприд активно распределяется в ткани (объем распределения $Vd_B = 6,1$ 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.

Биотрансформация

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 третичной amino-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 триметиламинурия (синдром рыбного запаха).

По данным фармакокинетических исследований CYP-опосредованных реакций *in vivo* итоприд не оказывает ингибирующего или индуцирующего действия на изоферменты CYP2C19 и CYP2E1. Терапия итопридом не влияет на CYP или активность уридиндифосфат-глюкуронилтрансферазы.

Элиминация

Итоприда гидрохлорид и его метаболиты выводятся в основном с мочой. Почечная экскреция итоприда и его N-оксида после однократного приема препарата внутрь в терапевтической дозе (50 мг) у здоровых людей составляла 3,7 и 75,4 %, соответственно. Период полувыведения итоприда гидрохлорида составляет около 6 часов.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Целлюлоза микрокристаллическая (МКЦ-102)

Маннитол

Кросповидон

Аспартам

Карбоксиметилкрахмал натрия тип А

Кремния диоксид коллоидный

Ароматизатор вишневый

Магния стеарат

6.2. Несовместимость

Не применимо.

6.3. Срок годности (срок хранения)

3 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Хранить при температуре не выше 25 °С.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

По 10 или 20 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной/поливинилиденхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной или из пленки поливинилхлоридной/поливинилиденхлоридной/поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной или из материала комбинированного на основе фольги (трехслойный материал, включающий алюминиевую фольгу, пленку из ориентированного полиамида, поливинилхлоридную пленку) и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 1, 2, 3, 4, 5, 7 и 10 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по медицинскому применению (листок-вкладыш) помещают в картонную упаковку (пачку).

6.6. Особые меры предосторожности при уничтожении использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата и другие манипуляции с препаратом

Особые требования отсутствуют.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Россия

ООО «Атолл»

445351, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Россия

ООО «Озон»

445351, Самарская обл., г.о. Жигулевск, г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.

Тел.: +79874599991, +79874599992

E-mail: ozon@ozon-pharm.ru

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

Дата первой регистрации:

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата Актиприд Солюшн Таблетс доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-коммуникационной сети «Интернет» <http://ees.eaeunion.org/>.