

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

Мотилак®

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Мотилак®

Международное непатентованное наименование (МНН): домперидон

Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Состав

Одна таблетка содержит:

Домперидон - 10 мг

Крахмал картофельный - 36,3 мг

Лактозы моногидрат (сахар молочный) - 57,0 мг

Целлюлоза микрокристаллическая – 6,0 мг

Кремния диоксид коллоидный (аэросил) - 1,2 мг

Повидон (поливинилпирролидон) - 4,7 мг

Магния стеарат - 1,2 мг

Карбоксиметилкрахмал натрия (примогель) - 3,6 мг

Оболочка:

Гипромеллоза (метилоксипропилцеллюлоза) - 1,45 мг

Повидон (поливинилпирролидон) - 0,91 мг

Полисорбат (твин-80) - 0,91 мг

Титана диоксид- 0,31 мг

Тальк - 0,42 мг

Описание

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, белого или почти белого цвета, круглые, двояковыпуклые. На изломе таблетки белого или белого с желтоватым оттенком цвета.

Фармакотерапевтическая группа: противорвотное средство - дофаминовых рецепторов блокатор центральный.

Код АТХ: А03FA03

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Увеличивает продолжительность перистальтических сокращений антрального отдела желудка и двенадцатиперстной кишки, ускоряет опорожнение желудка в случае замедления этого процесса, повышает тонус нижнего пищеводного сфинктера, устраняет развитие тошноты и рвоты.

Противорвотное действие домперидона, возможно, обусловлено сочетанием периферического (гастрокинетического) действия и антагонизма к рецепторам дофамина в триггерной зоне хеморецепторов. Применение домперидона редко сопровождается экстрапирамидными побочными эффектами, особенно у взрослых. Домперидон стимулирует выделение пролактина из гипофиза. Домперидон не оказывает действия на желудочную секрецию.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема препарата внутрь домперидон быстро всасывается. Обладает низкой биодоступностью (около 15 %). Пониженная кислотность желудочного содержимого уменьшает абсорбцию домперидона. Максимальная концентрация в плазме достигается через 1 ч.

Распределение

Домперидон широко распределяется в различных тканях, в тканях мозга его концентрация невелика. Связывание с белками плазмы составляет 91-93 %. Плохо проникает через гематоэнцефалический барьер.

Метаболизм

Подвергается интенсивному метаболизму в стенке кишечника и печени.

Выведение

Выводится через кишечник (66 %) и почками (33 %), в неизменном виде выводится, соответственно, 10 % и 1 % от величины дозы. Период полувыведения составляет 7-9 ч, при выраженной почечной недостаточности он удлиняется. У больных тяжелой почечной недостаточностью (сывороточный креатинин >6 мг/100 мл, т.е. >0,6 ммоль/л) период полувыведения домперидона увеличивался с 7,4 до 20,8 часов.

Показания

- Комплекс диспепсических симптомов, часто ассоциирующийся с замедленным опорожнением желудка (чувство переполнения в эпигастрии, ощущение вздутия живота, боль в верхней части живота, отрыжка, метеоризм, изжога с забросом или без заброса

содержимого желудка в полость рта), в том числе обусловленных поражением органов пищеварительной системы:

- язвенная болезнь желудка или 12-перстной кишки
- гастроэзофагеальная рефлюксная болезнь
- заболевания билиарного тракта
- панкреатит

•Рвота и тошнота различного генеза, в т.ч. на фоне функциональных и органических заболеваний; инфекций; вызванные радиотерапией; нарушением диеты и лекарственной терапией (прием морфина, апоморфина, леводопы и бромокриптина).

Противопоказания

- повышенная чувствительность к домперидону или любому другому компоненту препарата;
- непереносимость лактозы, дефицит лактазы, глюкозо-галактозная мальабсорбция;
- выраженные электролитные нарушения или заболевания сердца, такие как хроническая сердечная недостаточность;
- печеночная недостаточность средней и тяжелой степени тяжести;
- желудочно-кишечное кровотечение, механическая кишечная непроходимость, перфорация желудка или кишечника;
- пролактин-секретирующая опухоль гипофиза (пролактинома);
- одновременное применение пероральных форм кетоконазола, эритромицина или мощных ингибиторов изофермента CYP3A4, таких как флуконазол, вориконазол, кларитромицин, амиодарон, телитромицин и др.;
- одновременное применение с препаратами, удлиняющими интервал QT, за исключением апоморфина (см. разделы «Взаимодействие с другими лекарственными средствами» и «Особые указания»);
- детский возраст до 12 лет с массой тела менее 35 кг;
- беременность;
- период грудного вскармливания.

С осторожностью

Почечная недостаточность.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Беременность

Применение препарата Мотилак® противопоказано во время беременности.

Период грудного вскармливания

Грудное вскармливание должно быть прекращено при необходимости применения препарата в период грудного вскармливания.

Способ применения и дозы

Внутрь, до еды, не разжевывая, запивая достаточным количеством воды.

Взрослым и детям старше 12 лет с массой тела более 35 кг: по одной таблетке (10 мг) 3 раза в сутки, за 15-30 мин до еды и, в случае необходимости, перед сном. Максимальная суточная доза составляет 30 мг.

Препарат рекомендуется принимать в минимально эффективной дозе; регулярно в определенное время. При пропуске одного приема следует принять следующую таблетку как можно скорее. Если подходит время приема следующей дозы препарата, не следует принимать дополнительную дозу препарата для компенсации пропущенного приема. Не следует принимать одновременно две дозы препарата. Обычно продолжительность курса не превышает одну неделю.

У пациентов с печеночной недостаточностью легкой степени тяжести коррекция дозы не требуется. Препарат противопоказан у пациентов с печеночной недостаточностью средней и тяжелой степени тяжести.

У пациентов с почечной недостаточностью коррекция разовой дозы не требуется. Однако при многократном применении рекомендуется снизить дозу, а также снизить частоту применения до 1-2 раз в сутки в зависимости от степени тяжести почечной недостаточности.

Побочное действие

Ниже перечислены побочные эффекты по частоте их развития (по классификации ВОЗ): очень часто >1/10, часто от >1/100 до <1/10, нечасто от >1/1000 до <1/100, редко от >1/10000 до <1/1000, очень редко от <1/10000, включая отдельные сообщения.

Со стороны желудочно-кишечного тракта: часто – сухость слизистой оболочки полости рта; редко – проходящие спазмы кишечника; очень редко – диарея.

Со стороны нервной системы: очень редко – экстрапирамидные явления (у детей и лиц с повышенной проницаемостью гематоэнцефалического барьера). Эти явления полностью обратимы и спонтанно исчезают после прекращения лечения.

Очень редко – судороги, повышенная возбудимость и раздражительность, сонливость, головная боль, синдром беспокойных ног, непроизвольное движение глаз.

Аллергические реакции: очень редко – кожная сыпь, зуд кожных покровов, крапивница, анафилаксия, анафилактический шок, ангионевротический отек.

Со стороны эндокринной системы: редко – гиперпролактинемия (галакторея, гинекомастия), аменорея.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: очень редко – удлинение QT интервала, желудочковая аритмия, желудочковая тахикардия по типу «пируэт», внезапная коронарная смерть.

Лабораторные и инструментальные данные: очень редко – изменение показателей функциональных проб печени.

Передозировка

Симптомы: сонливость, дезориентация, экстрапирамидные реакции, особенно у детей.

Лечение симптоматическое, специфического антидота нет. Промывание желудка, прием активированного угля, при возникновении экстрапирамидных реакций – антихолинергические, противопаркинсонические средства. Из-за возможного увеличения интервала QT следует мониторировать электрокардиограмму (ЭКГ).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Взаимодействие со следующими препаратами может повышать риск увеличения интервала QT:

Противопоказанные комбинации:

препараты, увеличивающие интервал QT:

- антиаритмические препараты класса IA (в т.ч., дизопирамид, гидрохинидин, хинидин);
- антиаритмические препараты класса III (в т.ч., амиодарон, дофетилид, дронедазон, ибутилид, соталол);
- антипсихотические средства (в т.ч., галоперидол, пимозид, сертиндол);
- антидепрессанты (в т.ч., циталопрам, эсциталопрам);
- антибиотики (эритромицин, левофлоксацин, моксифлоксацин, спирамицин);
- противогрибковые препараты (в т.ч., пентамидин);

- антималярийные препараты (в т.ч., галофантрин, лумефантрин);
- желудочно-кишечные препараты (в т.ч., цизаприд, доласетрон, прукалоприд);
- антигистаминные препараты (в т.ч., мехитазин, мизоластин);
- противоопухолевые препараты (в т.ч., торемифен, вандетаниб, винкамин);
- другие препараты (в т.ч., бепридил, дифеманила метилсульфат, метадон);
- мощные ингибиторы СYP3A4 (ингибиторы протеазы, противогрибковые средства азолового ряда, некоторые антибиотики из группы макролидов (эритромицин, кларитромицин, телитромицин)).

Нерекомендованные комбинации:

умеренные ингибиторы СYP3A4 (дилтиазем, верапамил, некоторые антибиотики из группы макролидов).

Комбинации, которые следует применять с осторожностью: препараты, вызывающие брадикардию и гипокалиемию, а также азитромицин и рокситромицин.

Повышают концентрацию домперидона в плазме крови: противогрибковые средства азолового ряда, антибиотики из группы макролидов, ингибиторы ВИЧ-протеаз.

При одновременном применении с леводопой приводит к увеличению ее плазменной концентрации (максимум на 30-40 %).

Отдельные фармакокинетические/фармакодинамические исследования взаимодействия *in vivo* у здоровых добровольцев при пероральном применении кетоконазола и эритромицина подтвердили значимое ингибирование этими лекарственными средствами, опосредованного СYP3A4 метаболизма домперидона при «первичном» прохождении. При пероральном применении домперидона в дозе 10 мг 4 раза в день совместно с кетоконазолом в дозе 200 мг 2 раза в день, удлинение интервала QTc в течение периода наблюдения в среднем составило 9.8 мсек, с варьированием в отдельных временных точках в диапазоне от 1.2 до 17.5 мсек. При пероральном применении домперидона в дозе 10 мг 4 раза в день совместно с эритромицином в дозе 500 мг 3 раза в день, удлинение интервала QTc в течение периода наблюдения в среднем составило 9.9 мсек, с варьированием в отдельных временных точках в диапазоне от 1.6 до 14.3 мсек. Как *Stax*, так и AUC домперидона в равновесном состоянии повышались примерно в 3 раза в этих двух исследованиях взаимодействия. Монотерапия домперидоном в дозе 10 мг 4 раза в день перорально в этих исследованиях приводила к повышению интервала QTc в среднем на 1.6 мсек (в исследовании с кетоконазолом) и на 2.5 мсек (в исследовании с эритромицином), в то время, как монотерапия кетоконазолом (в дозе 200 мг 2 раза в день) и монотерапия эритромицином (в дозе 500 мг 3 раза в день) приводила за наблюдаемый период к удлинению интервала QTc на 3.8 и 4.9 мсек соответственно.

Применение совместно с апоморфином возможно только в том случае, если преимущество совместного применения превышает риски, и только если строго соблюдены рекомендуемые меры предосторожности для совместного применения препаратов.

Особые указания

Препарат рекомендуется принимать в минимально эффективной дозе. При длительной терапии препаратом пациенты должны находиться под регулярным наблюдением врача.

Применение препарата Мотилак® может привести к увеличению риска желудочковой аритмии или внезапной коронарной смерти (в особенности у пациентов старше 60 лет или при применении разовой дозы более 30 мг, а также у пациентов, одновременно принимающих препараты, увеличивающие интервал QT, или ингибиторы СYP3A4).

Применение препарата Мотилак® и других препаратов, способных вызвать удлинение интервала QT, противопоказано у пациентов, у которых отмечается удлинение интервалов сердечной проводимости, особенно интервала QT, у пациентов с выраженными электролитными нарушениями (гипо- и гиперкалиемия, гипомагниемия) или у пациентов с заболеваниями сердца, такими как хроническая сердечная недостаточность. Домперидон противопоказан при совместном приеме с лекарственными средствами, удлиняющими интервал QT, за исключением апоформина. Применение совместно с апоморфином возможно только в том случае, если преимущество совместного применения домперидона с апоморфином превышает риски, и только если строго соблюдаются рекомендуемые меры предосторожности для совместного применения препаратов, упомянутых в инструкции по медицинскому применению апоморфина.

Прием препарата следует прекратить при возникновении любых симптомов, которые могут быть ассоциированы с нарушением ритма сердца. В этом случае необходимо проконсультироваться с врачом.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятиях другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций в связи с риском развития побочных реакций, которые могут влиять на указанные способности.

Форма выпуска

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 10 мг.

По 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 30 таблеток в банку полимерную.

Каждую банку или 1, 3 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по применению в пачку из картона.

По 2 кг или 2,5 кг таблеток в контейнер из полимерных материалов, снабженный крышкой (для поставки на экспорт).

Срок годности

5 лет.

Не применять по истечении срока годности.

Условия хранения

При температуре не выше 30 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Условия отпуска

По рецепту.

Производитель: АО «ВЕРОФАРМ»

Юридический адрес: Россия, 107023, г. Москва, Барабанный пер., д. 3.

Адрес производства и принятия претензий: Россия, 308013, г. Белгород, ул. Рабочая, д. 14.

Тел.: (4722) 21-32-26; факс: (4722) 21-34-71.