

ИНСТРУКЦИЯ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ПРЕПАРАТА МОТОРИКС

Состав: действующее вещество: domperidone; 1 таблетка содержит домперидона 10 мг; **вспомогательные вещества:** лактоза, моногидрат; крахмал прежелатинизированный, натрия кроскармеллоза; целлюлоза микрокристаллическая; натрия лаурилсульфат; повидон; магния стеарат; оболочка: смесь для пленочного покрытия Opadry II White (гипромеллоза (гидроксипропилметилцеллюлоза); лактоза, моногидрат; полиэтиленгликоль; титана диоксид (E 171); триацетин).

Лекарственная форма. Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Основные физико-химические свойства: таблетки, покрытые пленочной оболочкой, белого цвета, с двояковыпуклой поверхностью, с риской.

Фармакотерапевтическая группа. Стимуляторы перистальтики.

Код АТХ A03F A03.

Фармакологические свойства.

Фармакодинамика. Домперидон – антагонист дофамина с противорвотными свойствами. Домперидон в незначительной степени проникает сквозь гематоэнцефалический барьер. Применение домперидона очень редко сопровождается экстропирамидными побочными реакциями, особенно у взрослых, но домперидон стимулирует выделение пролактина из гипофиза. Его противорвотное действие, возможно, обусловлено сочетанием периферического (гастрокинетического) действия и антагонизма к рецепторам дофамина в триггерной зоне хеморецепторов, которая находится за гематоэнцефалическим барьером в заднем участке (area postrema). Низкие концентрации домперидона, которые определяются в мозге, указывают на периферическое действие лекарственного средства на рецепторы дофамина. При применении внутрь домперидон повышает давление в нижних отделах пищевода, улучшает антродуоденальную моторику и ускоряет освобождение желудка. Домперидон не влияет на желудочную секрецию.

Фармакокинетика. Домперидон быстро абсорбируется при пероральном приеме натощак, максимальная концентрация в плазме крови достигается приблизительно через 30-60 минут. Низкая абсолютная биодоступность перорального домперидона (приблизительно 15 %) обусловлена экстенсивным метаболизмом первого прохождения в стенке кишечника и в печени. Хотя у здоровых людей биодоступность домперидона увеличивается при приеме после еды, больным с жалобами желудочно-кишечного характера следует принимать домперидон за 15-30 минут до еды. Сниженная кислотность желудка уменьшает абсорбцию домперидона. При пероральном приеме лекарственного средства после еды максимальная абсорбция несколько замедляется. При пероральном приеме домперидон не кумулируется и не индуцирует собственный обмен. Домперидон на 91-93 % связывается с белками плазмы крови. Исследования распределения домперидона показали его значительное распределение в тканях, но низкую концентрацию в мозге. У животных небольшие количества лекарственного средства проникают сквозь плаценту. Домперидон быстро и экстенсивно метаболизируется в печени путем гидроксирования и N-деалкилирования. Выведение с мочой и калом составляет соответственно 31 % и 66 % от пероральной дозы. Выделение лекарственного

средства в неизмененном виде составляет небольшой процент (10 % с калом и приблизительно 1 % с мочой). Период полувыведения из плазмы крови после приема разовой дозы составляет 7-9 часов у здоровых добровольцев, но удлинен у больных с тяжелой почечной недостаточностью. Клинические характеристики.

Показания. Для облегчения симптомов тошноты и рвоты, продолжающихся менее 48 часов.

Противопоказания. Моторикс противопоказан: - больным с установленной повышенной чувствительностью к лекарственному средству или вспомогательным веществам; - больным с пролактин-секреторной опухолью гипофиза (пролактиномой); - больным с тяжелыми или умеренными нарушениями функции печени и/или почек; - больным с известной пролонгацией интервала QT, лежащего в основе нарушений или заболеваний со стороны сердца; - больным с печеночной недостаточностью. Не следует применять Моторикс, если стимуляция двигательной функции желудка может быть опасной, например при желудочно-кишечном кровотечении, механической непроходимости или перфорации. Противопоказано одновременное применение кетоконазола, эритромицина или других сильнодействующих ингибиторов СYP3A4, лекарственных средств, удлиняющих интервал QT, таких как флуконазол, эритромицин, итраконазол, пероральный кетоконазол, посаконазол, ритонавир, саквинавир, теллапревир, вориконазол, кларитромицин, амиодарон, телитромицин (см. разделы «Особенности применения» и «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий. Антихолинергические лекарственные средства могут нейтрализовать антидиспептическое действие Моторикса. Не следует принимать антацидные и антисекреторные лекарственные средства одновременно с Моториксом, поскольку они снижают его биодоступность после приема внутрь (см. раздел «Особенности применения»). Домперидон метаболизируется преимущественно с помощью СYP3A4. Согласно данным исследований *in vitro* сопутствующее применение лекарственных средств, значительно угнетающих этот фермент, может привести к повышению уровня домперидона в плазме крови. При применении домперидона совместно с мощными ингибиторами СYP3A4, способными удлинять интервал QT, наблюдались клинически значимые изменения интервала QT. Поэтому сопутствующее применение домперидона с определенными лекарственными средствами противопоказано (см. раздел «Противопоказания»). Следует с осторожностью применять домперидон совместно с мощными ингибиторами СYP3A4, которые не демонстрировали способность удлинять интервал QT, или лекарственными средствами, способными вызывать удлинение интервала QT (см. раздел «Особенности применения»). Теоретически, поскольку Моторикс оказывает прокинетическое действие на желудок, это может влиять на всасывание пероральных лекарственных средств, применяющихся совместно, в частности на лекарственные формы пролонгированного высвобождения или кишечнорастворимые. Однако у пациентов, состояние которых уже стабилизировалось, сопутствующее применение домперидона на фоне применения дигоксина или парацетамола не влияло на уровни этих лекарственных средств в крови. В отдельных исследованиях фармакокинетического/фармакодинамического взаимодействия *in vivo* при одновременном пероральном применении кетоконазола или эритромицина у здоровых добровольцев было подтверждено, что данные лекарственные средства значительно угнетают пресистемный метаболизм домперидона, опосредованный СYP3A4. Примерами сильных ингибиторов СYP3A4, с которыми не рекомендуется применять Моторикс, являются: - азольные противогрибковые лекарственные средства, такие как флуконазол*, итраконазол, кетоконазол* и вориконазол*; - макролидные антибиотики, такие как кларитромицин* и эритромицин*; - ингибиторы ВИЧ-протеазы, такие как ампренавир, атазанавир, фосампренавир, индинавир, нелфинавир,

ритонавир и саквинавир; - антагонисты кальция, такие как дилтиазем и верапамил; - амиодарон*; - амрепитант; - нефазодон; - телитромицин*. *продолжают интервал QTc. Моторикс можно сочетать с: - нейрорептиками, действие которых он усиливает; - дофаминергическими агонистами (бромкриптином, L-допой), нежелательные периферические действия которых (такие как нарушение пищеварения, тошнота, рвота) он угнетает без нейтрализации основных свойств. Возможные взаимодействия с другими лекарственными средствами Основной метаболический путь домперидона опосредуется CYP3A4. Известно, что сопутствующее применение лекарственных средств, которые значительным образом угнетают этот фермент, может привести к увеличению уровней домперидона в плазме крови. Сопутствующее применение домперидона с мощными ингибиторами CYP3A4, способными вызывать удлинение интервала QT, противопоказано (см. раздел «Противопоказания»). Следует с осторожностью применять домперидон совместно с мощными ингибиторами CYP3A4, которые не вызывали удлинений интервала QT, такими как индинавир; за пациентами следует пристально наблюдать на случай появления признаков или симптомов нежелательных реакций. Следует с осторожностью применять домперидон с лекарственными средствами, удлиняющими интервал QT; за пациентами следует пристально наблюдать на случай появления признаков или симптомов нежелательных реакций со стороны сердечно-сосудистой системы. К таким лекарственным средствам относятся, например: - антиаритмические лекарственные средства класса IA - антиаритмические лекарственные средства класса III - некоторые нейрорептические лекарственные средства - некоторые антидепрессанты - некоторые антибиотики - некоторые противогрибковые лекарственные средства - некоторые противомаларийные лекарственные средства - некоторые желудочно-кишечные лекарственные средства - некоторые лекарственные средства, применяющиеся при онкологических заболеваниях - некоторые другие лекарственные средства. Вышеприведенный перечень является репрезентативным, но не является исчерпывающим.

Особенности применения. Антацидные или антисекреторные лекарственные средства не следует принимать одновременно с лекарственным средством Моторикс, поскольку они снижают пероральную биодоступность домперидона (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»). При совместном применении лекарственное средство Моторикс следует принимать перед едой, антацидные или антисекреторные лекарственные средства - после еды. Пациентам, у которых тошнота и рвота продолжаются более 48 часов, необходимо обратиться к врачу. Применение с кетоконазолом. В исследованиях взаимодействия домперидона с пероральной формой кетоконазола отмечалось удлинение QT-интервала, потому следует выбрать альтернативное лечение, если показана противогрибковая терапия кетоконазолом (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»). Домперидон следует с осторожностью применять пациентам с факторами риска пролонгации интервала QT, включая гипокалиемию, тяжелую гипомagneмию, органические заболевания сердца, и пациентам с легкими нарушениями функции печени и/или почек. Установлено, что удлинение интервала QT, которое наблюдается при применении домперидона, согласно рекомендуемому режиму дозирования в обычных терапевтических дозах (по 10 мг или 20 мг 4 раза в сутки), не имеет клинического значения. Из-за повышенного риска желудочковой аритмии Моторикс не рекомендуется применять пациентам с удлинением интервалов сердечной проводимости, в частности QTc, пациентам со значительными нарушениями баланса электролитов (гипокалиемией, гиперкалиемией, гипомagneмией) или брадикардией, или пациентам с фоновыми болезнями сердца, такими как застойная сердечная недостаточность. Известно, что нарушения баланса электролитов (гипокалиемия, гиперкалиемия, гипомagneмия) или брадикардия являются состояниями, повышающими проаритмогенный риск. В случае появления признаков или симптомов, которые могут быть связаны с сердечной аритмией, применение лекарственного средства Моторикс необходимо прекратить, а пациенту следует

немедленно проконсультироваться с врачом. Таблетки Моторикс содержат лактозу, поэтому лекарственное средство не следует применять пациентам с непереносимостью лактозы, галактоземией и мальабсорбцией глюкозы/галактозы. Следует учитывать следующую информацию относительно риска развития осложнений сердечно-сосудистых заболеваний, обусловленных лекарственными средствами, содержащими домперидон: • некоторые эпидемиологические исследования показали, что домперидон может ассоциироваться с повышенным риском серьезных желудочковых аритмий или внезапной сердечной смерти; • риск серьезных желудочковых аритмий или внезапной сердечной смерти может быть выше у пациентов с 60 лет или при пероральном применении доз лекарственного средства более 30 мг в сутки. Поэтому следует с осторожностью применять Моторикс пациентам пожилого возраста. Пациентам с 60 лет перед применением лекарственного средства Моторикс следует проконсультироваться с врачом; • домперидон следует назначать взрослым и детям в самой низкой эффективной дозе. Соотношение риска и пользы домперидона остается благоприятным.

Применение в период беременности или кормления грудью. Данные относительно применения домперидона беременным женщинам ограничены. Поэтому Моторикс в период беременности следует назначать только тогда, когда, по мнению врача, ожидаемый положительный эффект для матери превышает потенциальный риск для плода. Количество домперидона, которое может попасть в организм младенца через грудное молоко, чрезвычайно низкое. Максимальная относительная доза для младенцев (%) оценивается на уровне около 0,1 % от дозы для матери с поправкой на массу тела. Неизвестно, вредит ли он младенцу, поэтому матерям, принимающим Моторикс, следует воздержаться от кормления грудью.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или другими механизмами. Учитывая побочное действие со стороны нервной системы, пациентам необходимо быть внимательными при управлении автотранспортом или работе с другими механизмами.

Способ применения и дозы. Для облегчения симптомов тошноты и рвоты, продолжающихся менее 48 часов. Взрослые и дети с 12 лет и с массой тела не менее 35 кг: по 1 таблетке (10 мг) 3 раза в сутки. Максимальная суточная доза – 3 таблетки (30 мг в сутки). Максимальная длительность лечения – 48 часов без консультации врача. Рекомендуется применять лекарственное средство Моторикс перед приемом пищи. Всасывание лекарственного средства несколько задерживается, если его применять после приема пищи. Длительность лечения не должна превышать 1 неделю.

Дети. Лекарственное средство применять для лечения детей с 12 лет и с массой тела не менее 35 кг. Домперидон следует назначать детям в самой низкой эффективной дозе.

Передозировка. Симптомы. Симптомами передозировки могут быть агитация, нарушение сознания, судороги, дезориентация, сонливость и экстрапирамидные реакции. **Лечение.** Специфического антидота домперидона нет, но в случае значительной передозировки рекомендуется промывание желудка в течение 1 часа после приема лекарственного средства и применение активированного угля, а также тщательное наблюдение за пациентом и поддерживающая терапия. Антихолинергические лекарственные средства, средства для лечения болезни Паркинсона могут быть эффективными для контроля экстрапирамидных реакций.

Побочные реакции. При условии соблюдения рекомендаций по дозированию и длительности лечения домперидон, как правило, переносится хорошо, и нежелательные явления возникают нечасто. Со стороны иммунной системы: аллергические реакции, включая анафилаксию, анафилактический шок, гиперчувствительность. Со стороны эндокринной системы: повышение

уровня пролактина. Психические расстройства: нервозность, раздражительность, возбуждение, депрессия, тревожность, снижение или отсутствие либидо. Со стороны нервной системы: бессонница; головокружение, жажда, судороги, вялость, головная боль, сонливость, акатизия, экстрапирамидальные расстройства. Со стороны сердечно-сосудистой системы: отек, ощущение сердцебиения, нарушение частоты и ритма сердечных сокращений, удлинение интервала QT; серьезные желудочковые аритмии, внезапная сердечная смерть. Со стороны желудочно-кишечного тракта: гастроинтестинальные расстройства, включая абдоминальную боль, регургитацию, изменение аппетита, тошноту, изжогу, запор; сухость во рту, кратковременные кишечные спазмы, диарея. Со стороны кожи и подкожных тканей: зуд, сыпь; крапивница, ангионевротический отек. Со стороны репродуктивной системы и молочных желез: галакторея, увеличение молочных желез/гинекомастия, чувствительность молочных желез, выделения из молочных желез, аменорея, отек молочных желез, боль в области молочных желез, нарушение лактации, нерегулярный менструальный цикл. Со стороны опорно-двигательной системы и соединительной ткани: боль в ногах. Со стороны мочевыделительной системы: задержка мочи, дизурия, частое мочеиспускание. Общие расстройства: астения. Другое: конъюнктивит, стоматит. Изменения лабораторных показателей: повышение уровня АЛТ, АСТ и холестерина; отклонения от нормы показателей функциональных тестов печени; повышение уровня пролактина в крови. Поскольку гипофиз находится за гематоэнцефалическим барьером, домперидон может вызвать повышение уровня пролактина. В единичных случаях такая гиперпролактинемия может приводить к нейроэндокринным побочным эффектам, таким как галакторея, гинекомастия и аменорея. В период постмаркетингового применения лекарственного средства отличий в профиле безопасности его применения у взрослых и детей отмечено не было, за исключением экстрапирамидальных расстройств и других явлений, судорог и возбуждения, связанных с центральной нервной системой, которые наблюдались преимущественно у детей.

Срок годности. 3 года.

Условия хранения. Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка. По 10 таблеток в блистере; по 1 или 3 блистера в пачке.

Категория отпуска. Без рецепта.

Производитель. АО «КИЕВСКИЙ ВИТАМИННЫЙ ЗАВОД».

Местонахождение производителя и адрес места осуществления его деятельности. 04073, Украина, г. Киев, ул. Копыловская, 38.

Web-сайт: www.vitamin.com.ua.

Дата последнего пересмотра. 27.04.2018

