

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению лекарственного препарата

ДОМПЕРИДОН

Регистрационный номер: ЛП-003751

Торговое наименование: Домперидон

Международное непатентованное наименование: домперидон

Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Состав на одну таблетку:

Действующее вещество: домперидон - 10,00 мг.

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат -

53,10 мг, крахмал кукурузный - 20,00 мг, целлюлоза микро-

кристаллическая (МКЦ-101) - 10,00 мг, повидон-K25 - 3,00 мг,

магния стеарат - 0,70 мг, натрия лаурилсульфат - 0,20 мг.

Состав оболочки: гипромеллоза - 1,15 мг, макрогол-4000 -

0,30 мг, титана диоксид - 0,55 мг.

Описание: круглые, двояковыпуклые таблетки, покрытые

пленочной оболочкой белого или почти белого цвета. На

поперечном разрезе таблетки видны два слоя: ядро почти

белого цвета и пленочная оболочка.

Фармакотерапевтическая группа: противорвотное средство

- дофаминовых рецепторов блокатор центральный.

Код АТХ: A03FA03

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Домперидон - антагонист дофамина, обладающий про-

тиворвотными свойствами.

Домперидон плохо проникает через гематоэнцефалический

барьер. Применение домперидона редко сопровождается

экстрапирамидными побочными действиями, особенно

у взрослых, но домперидон стимулирует выделение

пролактина из гипофиза. Его противорвотное действие

может быть обусловлено сочетанием периферического

(гастрокинетического) действия и антагонизма к рецеп-

торам дофамина в хеморецепторной триггерной зоне,

которая находится за пределами гематоэнцефалического

барьера. Исследования на животных и низкие концен-

трации препарата, выявляемые в головном мозге, сви-

детельствуют о преимущественно периферическом дей-

ствии домперидона на дофаминовые рецепторы.

При применении внутрь домперидон увеличивает продол-

жительность антральных и дуоденальных сокращений,

ускоряет опорожнение желудка и повышает давление

сфинктера нижнего отдела пищевода. Домперидон не ока-

зывает действия на желудочную секрецию.

Фармакокинетика

При приеме натощак домперидон быстро абсорбируется

после приема внутрь, пиковые плазменные концентрации

достигаются в течение 30-60 минут.

Низкая абсолютная биодоступность домперидона при

приеме внутрь (примерно 15%) связана с интенсивным

метаболизмом в кишечной стенке и печени. Домперидон

следует принимать за 15-30 минут до еды. Снижение кис-

лотности в желудке приводит к ухудшению всасывания

домперидона.

Биодоступность при приеме внутрь снижается при пред-

варительном приеме циметидина и натрия бикарбоната.

При приеме препарата после еды для достижения макси-

мальной абсорбции требуется больше времени, а площа-

дь под фармакокинетической кривой (AUC) несколько

увеличивается.

При приеме внутрь домперидон не накапливается и не

индуцирует собственный метаболизм; пиковый плазмен-

ный уровень 21 нг/мл через 90 минут после 2 недель

приема внутрь в дозе 30 мг в сутки был практически таким

же, как уровень 18 нг/мл после приема первой дозы.

Домперидон подвергается быстрому и интенсивному мета-

болизму путем гидроксимирирования и N-деалкилирования.

Исследования метаболизма in vitro с диагностическими

ингибиторами показали, что изофермент CYP3A4 явля-

ется основной формой цитохрома P450, участвующей в

N-деалкилировании домперидона, в то время как изо-

ферменты CYP3A4, CYP1A2 и CYP2E1 участвуют в аром-

атическом гидроксимирировании домперидона.

Выведение через почки и через кишечник составляет 31%

и 66% от дозы при приеме внутрь, соответственно. Доля

домперидона, выделяющегося в неизменном виде,

является небольшой (10% - выводится кишечником и

приблизительно 1% - почками).

Плазменный период полувыведения после однократного

приема внутрь составляет 7-9 часов у здоровых добро-

вольцев, но повышается у пациентов с тяжелой почечной

недостаточностью. У таких пациентов (сывороточный кре-

атинин > 6 мг/100 мл, т.е. > 0,6 ммоль/л) период полувы-

ведения домперидона увеличивается с 7,4 до 20,8 часов,

но концентрации домперидона в плазме крови ниже, чем

у пациентов с нормальной функцией почек. Малое коли-

чество неизмененного препарата (около 1%) выводится

почками.

У пациентов с нарушением функции печени средней

степени тяжести (7-9 баллов по шкале Чайлд-Пью) AUC

(площадь под кривой «концентрация-время») и макси-

С_{max} и AUC, без изменений связывания с белками или

периода полувыведения. Пациенты с тяжелым нарушением

функции печени не изучались.

Показания к применению

Для облегчения симптомов тошноты и рвоты.

Противопоказания

Гиперчувствительность к домперидону или любому дру-

гую компоненту препарата;

Непереносимость лактозы, дефицит лактазы, глюкозо-

галактозная мальабсорбция;

Пролактинома;

Одновременный прием пероральных форм кетоконазола,

эритромицина или других сильных ингибиторов изофер-

мента CYP3A4, вызывающих удлинение интервала QT

(в т.ч. кларитромицин, итраконазол, флуконазол, позако-

назол, вориконазол, ритонавир, саквинавир, амиодарон,

телитромицин, теллапревир) (см. разделы «Взаимодей-

ствие с другими лекарственными препаратами», «Особые

указания»);

Выраженные электролитные нарушения или заболевания

сердца, такие как хроническая сердечная недостаточность;

Кровотечения из желудочно-кишечного тракта, механиче-

ская кишечная непроходимость, перфорация желудка или

кишечника;

Печеночная недостаточность средней и тяжелой степени

тяжести;

Масса тела менее 35 кг, детский возраст до 12 лет;

Беременность и период грудного вскармливания.

С осторожностью: детский возраст; нарушения функции

почек.

Применение при беременности и в период грудного

вскармливания

Применение препарата Домперидон при беременности и

в период грудного вскармливания противопоказано.

Способ применения и дозы

Внутри.

Рекомендуется принимать таблетки, покрытые пленочной

оболочкой за 15-30 минут до еды, в случае их приема

после еды абсорбция домперидона может замедляться.

Взрослые и дети старше 12 лет с массой тела 35 кг и

более: 1 таблетка (10 мг) 3 раза в сутки. Максимальная

суточная доза составляет 3 таблетки (30 мг).

Обычно продолжительность курса лечения не превышает

одну неделю.

Дети до 12 лет и с массой тела 35 кг и более

По 1 таблетке (10 мг) 3 раза в сутки. Максимальная суточ-

ная доза составляет 3 таблетки (30 мг). В детской практике

в основном следует использовать домперидон в другой

лекарственной форме.

Непрерывный прием домперидона без консультации вра-

ча не должен по продолжительности превышать 7 дней.

При необходимости врач может продлить курс лечения.

Применение у пациентов с почечной недостаточностью

Поскольку период полувыведения домперидона при тяже-

лой почечной недостаточности (при уровне креатинина

в сыворотке крови > 6 мг/100 мл, т.е. > 0,6 ммоль/л) увели-

чивается, частоту приема следует снизить до 1 или 2 раз

в сутки, в зависимости от степени тяжести недостаточности.

Необходимо проводить регулярное обследование пациен-

тов с тяжелой почечной недостаточностью (см. раздел

«Фармакологические свойства»).

Применение у пациентов с печеночной недостаточностью

У пациентов с печеночной недостаточностью легкой сте-

пени тяжести коррекция дозы не требуется (см. раздел

«Фармакологические свойства»). Препарат противопока-

зан пациентам с печеночной недостаточностью средней и

тяжелой степени тяжести (см. раздел «Противопоказания»).

Побочное действие

По данным клинических исследований

Нежелательные реакции, наблюдавшиеся у ≥ 1% пациен-

тов, принимавших домперидон: депрессия, тревога, сни-

жение или отсутствие либидо, головная боль, сонливость,

акатизия, диарея, сыпь, зуд, увеличение молочных желез/

гинекомастия, боль и чувствительность в области молоч-

ных желез, галакторея, нарушения менструального цикла

и аменорея, нарушение лактации, астения.

Нежелательные реакции, наблюдавшиеся у < 1% пациен-

тов, принимавших домперидон: гиперчувствительность,

крапивница, отек молочных желез, выделения из молоч-

ных желез.

Частота нежелательных реакций, приведенных ниже, опре-

делялась соответственно следующему (классификация

Всемирной организации здравоохранения):

очень часто (≥ 1/10), часто (≥ 1/100 и < 1/10), нечасто

(≥ 1/1000 и < 1/100), редко (≥ 1/10000 и < 1/10000), очень

редко (< 1/10000), включая отдельные сообщения, частота

неизвестна (не может быть оценена на основании име-

ющихся данных).

По данным спонтанных сообщений о нежелательных

явлениях

Нарушения со стороны иммунной системы: очень редко -

анафилактические реакции, включая анафилактический

шок.

Нарушения психики: очень редко - повышенная возбуди-

мость, нервозность, раздражительность.

мидные расстройства и судороги.

Нарушения со стороны сердечно-сосудистой системы: частота неизвестна - желудочковая аритмия*, желудочковая тахикардия по типу «пируэт», внезапная коронарная смерть*.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: очень редко - крапивница, ангионевротический отек.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей: очень редко - задержка мочи.

Лабораторные и инструментальные данные: очень редко - отклонение лабораторных показателей функции печени, гиперпролактинемия.

*В некоторых эпидемиологических исследованиях было показано, что применение домперидона может быть связано с повышением риска развития серьезных желудочковых аритмий или внезапной смерти. Риск возникновения данных явлений более вероятен у пациентов старше 60 лет и у пациентов, принимающих препарат в суточной дозе более 30 мг. Рекомендовано применение домперидона в наименьшей эффективной дозе у взрослых и детей. **Нежелательные реакции, выявленные в ходе пострегистрационных клинических исследований**

Нарушения со стороны иммунной системы: частота неизвестна - анафилактические реакции, включая анафилактический шок.

Нарушения психики: нечасто - повышенная возбудимость, нервозность.

Нарушения со стороны нервной системы: часто - головокружение; редко: судороги; частота неизвестна - экстрапирамидные расстройства.

Нарушения со стороны сердечно-сосудистой системы: частота неизвестна - желудочковая аритмия*, желудочковая тахикардия по типу «пируэт», внезапная коронарная смерть*.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: частота неизвестна - сухость во рту.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей: нечасто - задержка мочи.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: частота неизвестна - ангионевротический отек.

Передозировка

Симптомы передозировки встречаются чаще всего у младенцев и детей. Признаками передозировки служат агитация, измененное сознание, судороги, дезориентация, сонливость и экстрапирамидные реакции.

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

Взаимодействия с другими лекарственными средствами

Взаимодействие со следующими препаратами может повысить риск увеличения интервала QT:

Противопоказанные комбинации

Препараты, удлиняющие интервал QT: антиаритмические препараты класса IA (например, дизопирамид, гидрохинидин, хинидин), антиаритмические препараты класса III (например, амиодарон, дофетилид, дронадарон, ибутилид, соталол), антипсихотические средства (например, галоперидол, пимозид, сертиндол), антидепрессанты (например, циталопрам, эсциталопрам), антибиотики (эритромицин, левофлоксацин, моксифлоксацин, спирамицин), противогрибковые препараты (например, пентамидин), антималярийные препараты (в частности, галофантрин, лумефантрин), желудочно-кишечные препараты (например, цизаприд, доласетрон, пруклоприд), антигистаминные препараты (например, мекхитазин, мизоластин), противоопухолевые препараты (например, торемифен, вандетаниб, винкамин), другие препараты (например, бепридил, дифеманила метилсульфат, метадон), мощные ингибиторы изофермента CYP3A4 (ингибиторы протеазы, противогрибковые средства азолового ряда, некоторые антибиотики из группы макролидов (эритромицин, кларитромицин, телитромицин)).

Нерекомендованные комбинации

Умеренные ингибиторы изофермента CYP3A4 (дилтиазем, верапамил, некоторые антибиотики из группы макролидов).

Комбинации, которые следует применять с осторожностью

Препараты, вызывающие брадикардию и гипокалиемию, а также азитромицин и рокситромицин. Циметидин, натрия гидрокарбонат, другие антацидные и антисекреторные лекарственные средства снижают биодоступность домперидона. Повышают концентрацию домперидона в плазме крови: противогрибковые средства азолового ряда, антибиотики из группы макролидов, ингибиторы ВИЧ-протеазы, нефазодон. Совместим с приемом антипсихотических лекарственных средств (нейролептиков), агонистами дофаминергических рецепторов (бромкриптин, леводопа).

Одновременное применение с парацетамолом и дигоксинном не оказывает влияния на концентрацию этих лекарственных средств в крови.

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

Домперидон не рекомендуется применять для профилактики тошноты и рвоты после наркоза. При длительной терапии препаратом пациенты должны находиться под регулярным наблюдением врача.

Домперидон может вызывать удлинение интервала QT на

ЭКГ. В период пострегистрационного наблюдения у пациентов, принимающих домперидон, в редких случаях отмечалось удлинение интервала QT и возникновение желудочковой тахикардии типа «пируэт». Данные нежелательные реакции были отмечены в основном у пациентов с факторами риска, с выраженными электролитными нарушениями или одновременно принимающих препараты, удлиняющие интервал QT.

В некоторых исследованиях было показано, что применение домперидона 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 изофермента CYP3A4).

Домперидон противопоказан при совместном приеме с лекарственными средствами, удлиняющими интервал QT, за исключением апоморфина. 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, упомянутые в инструкции по медицинскому применению апоморфина.

Применение домперидона и других препаратов, способных вызвать удлинение интервала QT противопоказано, у пациентов с выраженными электролитными нарушениями (гипо- и гиперкалиемия, гипомagneзиемия) или у пациентов с заболеваниями сердца, такими как хроническая сердечная недостаточность

Было показано, что наличие у пациента электролитных нарушений (гипо- и гиперкалиемия, гипомagneзиемия) и брадикардия может увеличивать риск развития аритмии. Прием домперидона следует прекратить при возникновении любых симптомов, которые могут быть ассоциированы с нарушением ритма сердца. В этом случае необходимо проконсультироваться с врачом. При одновременном применении домперидон усиливает действие нейролептиков. При одновременном применении домперидона с агонистами дофаминергических рецепторов (бромкриптин, леводопа) домперидон угнетает нежелательные периферические эффекты последних, такие как нарушение пищеварения, тошнота и рвота, не влияя при этом на их центральные эффекты. Препарат рекомендуется принимать в минимальной эффективной дозе. Если лекарственное средство пришло в негодность или истек срок годности - не выбрасывайте его в сточные воды и на улицу! Поместите лекарственное средство в пакет и положите в мусорный контейнер. Эти меры помогут защитить окружающую среду!

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятиями 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, 30, 50 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

Или по 10, 30, 50 таблеток в контурную ячейковую упаковку из материала комбинированного на основе фольги (трехслойный материал, включающий алюминиевую фольгу, пленку из ориентированного полиамида, поливинилхлоридную пленку) и фольги алюминиевой печатной лакированной.

1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 или 10 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по медицинскому применению помещают в картонную упаковку (пачку).

Условия хранения

При температуре не выше 25 °C в картонной упаковке (пачке).

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Держатель регистрационного удостоверения:

ООО «Атолл»

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

Производитель: ООО «Озон»

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

Организация, принимающая претензии: ООО «Озон»

Россия, 445351, Самарская обл., г. Жигулевск, г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.
Тел.: +79874599991; +79874599992

E-mail: ozon@ozon-pharm.ru

Либо

Производитель: ООО «Озон Фарм»

Россия, Самарская обл., г. Тольятти, тер. ОЭЗ ППТ, магистраль 3-я, зд. 11, стр. 1.

Организация, принимающая претензии:

ООО «Озон Фарм»
Россия, 445043, Самарская обл., г. Тольятти, тер. ОЭЗ ППТ, магистраль 3-я, зд. 11, стр. 1.

Тел.: +79874599993; +79874599994

E-mail: ozonpharm@ozon-pharm.ru