

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО

Приложение към 11-4133; 11-4134; 11-4135,
разрешение за употреба № 11-4136; 11-4137

609/05.06.01

Димитров

28.09
2001

1. Наименование на лекарствения продукт:

Methylprednisolon Sopharma

2. Качествен и количествен състав на активното вещество

Съдържание в една ампула:

	<u>6,31mg</u>	<u>15,78mg</u>
Methylprednisolone Sodium succinate	8,4 mg	20,92mg
екв. на Methylprednisolone	6,31 mg	15,78 mg

	<u>40 mg</u>	<u>125 mg</u>	<u>250mg</u>
Methylprednisolon Sodium succinate	53,03	165,74	331,4
екв. на Methylprednisolone	40 mg	125 mg	250 mg

3. Лекарствена форма

Прах за инжекционен разтвор

4. Клинични данни

4.1. Показания

- ендокринни нарушения - остра адренкортикална инсуфициенция;
- колагенози - по време на обостряне или за поддържаща терапия при системен lupus erythematodes;
- дерматологични заболявания - пемфигус, тежък мултиформен еритем (синдром на Stevens-Johnson), ексфолиативен дерматит, генерализиран невродермит, тежък псориазис, тежки себореини дерматити;
- алергични заболявания - тежки или неподдаващи се на стандартно лечение заболявания: бронхиална астма, atopични дерматити, серумна



болест, лекарствена свръхчувствителност, едем на Quinke, уртикария, анафилаксия;

- гастро-интестинални заболявания - улцерозен колит в остър стадий;
- мозъчен оток - за лечение на мозъчен оток, свързан с мозъчни тумори, травми на главата, черепни операции;
- органни трансплантации - за предотвратяване отхвърлянето на трансплантирания орган;
- остър ревматичен пристъп;
- тежък шок - хеморагичен, травматичен, алергичен, септичен - инфекции с тежка интоксикация;
- псевдокруп;
- за намаляване опасността от образуване на стриктура на хранопровода след изгаряне с корозивни вещества;
- хематологични заболявания – придобита автоимунна хемолитична анемия, конгенитална хипопластична анемия, еритробластопения (RBC анемия), идиопатична тромбоцитопенична пурпура при възрастни, вторична тромбоцитопения при възрастни;
- за палиативно лечение при следните неопластични заболявания: остра или хронична левкемия и лимфоми (ходжкинови и неходжкинови) при възрастни, остра левкемия в детска възраст.

4.2. *Начин на приложение и дозировка*

Продуктът се прилага интрамускулно или интравенозно.

При шок - 125 mg на всеки 2-6 часа или 250 mg на всеки 4-6 часа.

Може да се прилага също по 30 mg/kg телесно тегло на всеки 24 часа.



Прилага се и интравенозно в инфузия за не по-кратко от 10 до 30 минути. Високите дози не трябва да се прилагат повече от 48 до 72 часа при положение, че състоянието на болния не се подобри.

За имunosупресия - за предотвратяване на органното отхвърляне при органни трансплантации (особено бъбречни) метилпреднизолон се прилага в дози от 0,5 g до 2 g интравенозно на всеки 24-48 часа.

При мозъчен едем - по 40-125 mg на всеки 4 до 6 часа интравенозно или интрамускулно в продължение на 4 до 7 дни (до стабилизиране състоянието на болния).

При други състояния началната доза може да варира от 10 до 40 mg в зависимост от клиничната картина. Големи дози обикновено се прилагат за кратко време.

Метилпреднизолон се използва като допълнителна терапия към лечението на болни с улцерозен колит, като дози от 20 до 40 mg се прилагат в продължителна инфузия 3 до 7 пъти седмично за период от 2 или повече седмици.

При деца лечебните дози са 0,8-1,5 mg/kg телесно тегло дневно.

Приготвяне на инжекционен разтвор: разтворителят се прибавя към сухата ампула и полученият разтвор се смесва с различно количество инфузионен разтвор - 5 % декстроза, изотоничен физиологичен разтвор или 5 % декстроза в изотоничен физиологичен разтвор.

Намаляването на дозите и прекратяването на лечението с продукта трябва да се извършва винаги постепенно.

Посочените дозировки трябва винаги да бъдат строго индивидуализирани. Продуктът не трябва да се смесва с лекарства в една спринцовка.



4.3. Противопоказания

Метилпреднизолон е абсолютно противопоказан при свръхчувствителност към някоя от съставките на продукта, при болни с латентна или активна туберкулоза, остри психози, херпес симплекс, кератити.

Относителни противопоказания са: активна или латентна пептична язва, синдром на Къшинг, дивертикули, пресни интестинални анастомози, остеопороза, тромбоемболични инциденти, бъбречна недостатъчност, захарен диабет, хипертония, глаукома, локални или системни инфекции (включително след ваксиниране против варицела), микози и други екзантематозни заболявания, имunosупресивни състояния (СПИН, варицела).

Бременността е относително противопоказание, особено в първите 3 месеца.

4.4. Специални указания и предупреждения

Кортикостероидите могат да причинят повишаване на кръвното налягане (редовно да се проследява), задръжка на соли и вода и повишена екскреция на калий и калций. Въпреки че синтетичните глюкокортикоиди имат по-слаба минералкортикоидна активност, по време на лечението с тях е необходима диета с ограничаване на солта и добавяне на калий и калций.

Когато кортикостероидите се употребяват за лечение на мозъчен оток, поради опасността от гастроинтестинално кървене е необходимо ежедневно проследяване на фекалиите. Възможно е кортикоидната терапия да маскира мозъчни кръвоизливи.



Продължителната кортикостероидна терапия може да доведе до повишаване ацидитета в стомаха и поява на пептични язви. Пролонгираната хормонална терапия често води до намаляване активността и размера на надбъбречната кора.

Когато Метилпреднизолон се прилага при хирургични интервенции е възможно забавяне на оздравителния процес на раните.

При болни с глаукома е необходимо да се мониторира вътреочното налягане.

Болните трябва внимателно да се проследяват евентуално за развитие на депресивна симптоматика.

Подобно на другите глюкокортикоиди Метилпреднизолон може да утежни развитието на захарен диабет, поради нарастване нуждите от инсулин.

Употребата на Метилпреднизолон при миастения гравис може да влоши основното заболяване, поради което трябва да се прилага с голямо внимание. Наблюдаваната мускулна слабост при кортикоидната терапия може да се дължи на нарушеното разпределение на калия при мускулния метаболизъм.

Наблюдавано е забавяне в растежа при деца, получаващи кортикостероиди в продължение на 6 и повече месеци, което е пропорционално на дозата. Тези деца изискват ежемесечно проследяване на растежа. След прекъсване на терапията растежът се възстановява.

При парентерално приложение на Метилпреднизолон много рядко са възможни анафилактични реакции.

При дози, по-високи от 0,5 g, приложени бързо венозно съществува опасност от кардиоваскуларен колапс.

Да се избягва инжектирането на продукта в делтоидния мускул, поради високия процент на подкожна атрофия.

След прекъсване на терапията е необходимо продължително проследяване на болните, поради риск от внезапна поява на тежки симптоми на болестта.

4.5. Лекарствени взаимодействия

При едновременно приложение на Метилпреднизолон със сърдечни глюкозиди може да се засили токсичността им (увеличено излъчване на калий). Съвместната употреба със салидиуретици може да засили хипокалиемията. Намалява ефекта на оралните антидиабетични средства и кумариновите антикоагуланти. Действието на Метилпреднизолон се намалява при успоредно приложение с барбитурати, рифампицин и фенитоин, тъй като тези средства засилват неговия метаболизъм.

При едновременен прием на салицилати или други нестероидни противовъзпалителни средства се увеличава риска от гастроинтестинални усложнения.

Приложението на Метилпреднизолон заедно с живи вирусни ваксини или други имунизации води до засилване репликацията на вируса.

4.6. Бременност и кърмене

Няма данни за влиянието на продукта върху човешката репродуктивност. По време на бременност, кърмене и при жени в термин за раждане е необходима внимателна преценка на съотношението полза/риск. По време на първите три месеца на



бременността трябва да се избягва употребата му, освен при изключителни индикации.

4.7. Влияние върху активното внимание, способността за шофиране и работа с машини

Няма данни за неблагоприятни ефекти при водачи на моторни превозни средства и работещи с машини.

4.8. Нежелани лекарствени реакции

Нежелани реакции могат да се наблюдават от страна на:

- Сърдечно-съдова система – артериална хипертония, повишен риск от тромбози и тромбоемболии, васкулит.

- Нервна система – депресия, страх, раздразнителност, безсъние, еуфория, гърчове при деца, психопатии.

- Храносмилателна система – улцерозен ефект (язви на стомаха и дванадесетопръстника, улцерозен колит), изостряне на язвената болест, панкреатит.

- Ендокринна система – намален глюкозен толеранс, хипергликемия с глюкозурия (стероиден диабет), надбъбречна атрофия, Къшингоиден синдром, аменорея, хирзутизъм, импотентност, хипопаратиреоидизъм, потискане на растежа.

- Отделителна система – протеинурия, хематурия, нарушен креатининов клирънс.

- Кожа и лигавици – петехии, уртикария, контактен дерматит, екхимози, стероидно акне, стрии по корема, хипопигментация, хипертрихоза, забавено зарастване на рани.

- Кръв – лимфопения, скъсяване времето на кръвосъсирване.



- Други – повишено вътреочно налягане, катаракта, луновидно лице, отоци, засилено излъчване на калий, мускулна слабост, остеопороза, асептични костни некрози.

4.9. Предозиране

Симптомите на предозиране с кортикостероидите почти винаги се дължат на приложението им във високи дози при нормални физиологични изисквания. Те трябва да се третират симптоматично и когато е възможно дозата се намалява или бавно се спира.

5. Фармакологични данни

5.1. Фармакодинамика

Представява синтетично производно на преднизолон. Притежава мощно противовъзпалително, противоалергично и имunosупресивно действие. Оказва по-силно изразени глюкокортикоидни ефекти от преднизолон и слабо повлиява минералния обмен. Проявява по-слабо изразени катаболно и психотропно действие, както и въздействие върху ендокринната система.

От молекулните механизми на фармакологичните ефекти на продукта по-важните са: стимулиране продукцията на протеини, които потискат фосфолипаза А2, респективно освобождаването на арахидонова киселина и синтезата на редица медиатори на възпалителния процес; потискане механизма на прилепване на неутрофилните клетки към ендотела; инхибиране на пролиферацията на макрофагите, лимфоцитите и на антиген-представящите клетки.



блокиране продукцията на интерлевкин 2; потискане синтеза на инхибиторния фактор на левкоцитната миграция и др.

5.2. Фармакокинетика

Натриевата сол на Метилпреднизолон хидрогенсукцинат се разтваря лесно във вода, резорбира се добре и има бърз и продължителен ефект. С плазмените протеини се свързва в около 95 %. Плазменият му полуживот е около 100 минути, а продължителността на действието - 12-36 часа. Метаболизира се главно в черния дроб. Неговите метаболити (кето- и хидроксисъединения) са хормонално неактивни и се екскретират предимно през бъбреците. Около 85% от приложената доза се екскретира с урината за 24 часа и около 10% с фекалиите.

5.3. Предклинични данни за безопасност

При опити с животни след венозно приложение метилпреднизолон показва ниска токсичност. Острата ЛД₅₀ инравенозно при плъхове и мишки е 650, респективно 770 mg/kg телесно тегло.

Изследването на тератогенният ефект при плъхове показват, че високите дози кортикостероиди предизвикват фетални уродства, но метилпреднизолон показва минимален тератогенен риск.



6. Фармацевтични данни

6.1. Списък на помощните вещества и техните количества

Съдържание на една ампула в mg:

	6,31 mg	15,78 mg	40mg	125mg	250mg
Disodium phosphate dihydrate	3,55	3,55	3,55	3,55	3,55
Monosodium phosphate monohydrate	3,50	3,50	3,50	3,50	3,50
Water for injections	1 ml	1 ml	1 ml	2 ml	5 ml

6.2. Физико-химични несъвместимости

Продуктът не трябва да се смесва с други лекарства в една спринцовка.

6.3. Срок на годност

Пет години от датата на производство.

6.4. Условия на съхранение

В оригинални опаковки на защитено от светлина място при температура под 25⁰ C. Да не се замразява!

6.5. Данни за опаковката

Продуктът се пълни в ампули от безцветно стъкло заедно с ампули разтворител, които се поставят в картонена кутия заедно с листовка с указания за употреба.



Methylprednisolon	6.31mg	15.78mg	40mg	125mg	250mg
-------------------	--------	---------	------	-------	-------

	<u>прах за инжекционен разтвор</u>				
брой ампули	5; 10 (2ml)	5; 10 (2ml)	10 (2ml)	5 (5ml)	5 (10ml)

	<u>разтворител</u>				
брой ампули	5; 10 (1ml)	5; 10 (1ml)	10 (1ml)	5 (2ml)	5 (5ml)

6.6. Начин на отпускане

По лекарско предписание.

7. Име и адрес на производителя

СОФАРМА АД, България

София, ул. " Илиенско шосе " N 16

