

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. Търговско име на лекарствения продукт

Degan® разтвор за инжекции 10 mg/2 ml

2. Качествен и количествен състав

2 ml разтвор за инжекции съдържат 10 mg metoclopramide hydrochloride (като монохидрат).

1 ml разтвор за инжекции съдържа 5 mg metoclopramide hydrochloride (като монохидрат).
Помощни вещества Виж т. 6.1.

3. Лекарствена форма

Разтвор за инжекции, бистър, безцветен

4. Клинични данни

4. 1. Терапевтични показания

Показания:

Профилактика на следоперативно гадене и повръщане.

За улесняване на пасажа през стомаха и тънките черва при рентгенови изследвания.

Диабетна гастропареза.

4. 2. Дозировка и приложение

Degan разтвор за инжекции се прилага при възрастни и деца над 14 години мускулно или чрез бавно венозно (за 1-2 минути) инжектиране. Стандартната дозировка е 10 mg Degan три пъти дневно.

Дозировката при юноши и деца трябва да се намали както следва:

15 - 18 години	5 mg три пъти дневно (телесно тегло: 30 – 59 kg) или 10 mg три пъти дневно (телесно тегло над 60 kg)
2 - 14 години	1 mg - 5 mg два или три пъти дневно

Дневната доза не трябва да надвишава 0,5 mg/kg тегло.

Дозировка при пациенти с увреждане на функцията на бъбреците

Препоръчва се дозата на Degan® да се намали наполовина при пациенти с увредена функция на бъбреците, при които креатининовия клирънс е под 0,66 ml/sec (40 ml/min).

Дозировка при пациенти на хемодиализа

Не е необходимо допълнителна доза на лекарството след хемодиализа.

4. 3. Противопоказания

Degan® е противопоказан при деца под 2 години при пациенти с кръвоизливи в стомашно-чревния тракт, при механични обструкции или перфорации на стомашно-чревния тракт.

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО	
Приложение към разрешение за употреба № 11-10742/0405-0500	
673/26.07.05	<i>M. M. M.</i>



или в случай, когато стимулацията на моториката на стомашно чревния тракт може да бъде опасна.

Метоклопрамид е противопоказан при пациенти с порфирия или феохромоцитом (тъй като може да предизвика освобождаване на катехоламини от тумора и хипертензивна криза) или при пациенти с пролактин зависими тумори.

Degan® е противопоказан при пациенти свръхчувствителни към metoclopramide или към някои от помощните вещества, към сулфонамиди, при епилептици, при пациенти, лекувани с продукти, предизвикващи екстрапирамидни симптоми и при пациенти с предизвикана от невротропни тардивна дискинезия.

4. 4. Специални мерки за безопасност при употреба

Degan трябва да се прилага с изключително внимание при пациенти с анамнеза за депресия, особено при склонност към самоубийство.

Екстрапирамидни симптоми като дистонични реакции могат да се появят в приблизително 1 от 500 пациенти. Обикновено те се появяват в първите 24 - 48 часа след началото на лечението с metoclopramide и са по-често при младежи.

При проява на екстрапирамидни симптоми лечението трябва да се прекрати незабавно. При лечение с metoclopramide може да се появи и тардивна дискинезия. Въпреки, че този синдром по-често се проявява при пациенти в напреднала възраст, особено при жени и при пациенти приемащи антихолинергични лекарства, вероятността за развитието му при отделен пациент много трудно се прогнозира. Вероятността за проявата и честотата на синдрома нарастват с приемане на високи дози и при продължително приемане на лекарството.

Необходимо е внимание при прилагането на продукта при пациенти в напреднала възраст и при деца над 2 години.

Могат да се появят симптоми, подобни на тези на Паркинсонова болест, обикновено през първите 6 месеца на лечение с metoclopramide и рядко по-късно. Симптомите обикновено изчезват 2 до 3 месеца след прекъсване на лечението с metoclopramide. На болните от Паркинсонова болест не се препоръчва ползването на metoclopramide, а при необходимост с повишено внимание.

Специално внимание е необходимо и при пациенти с бъбречна недостатъчност.

Необходимо е внимание при пациенти с увреждане на функциите на черния дроб или при тези с чернодробна цироза, тъй като metoclopramide предизвиква увеличаване концентрацията на алдостерон в следствие на което се получава преходна ретенция на натрий.

Пациенти с хипертензия и тези, при които неотдавна е извършена чревна анастомоза, трябва да приемат metoclopramide много внимателно.

При лечение с metoclopramide пациентите не трябва да консумират алкохол, да не вземат MAO инхибитори, трициклични антидепресанти и симпатомиметични амини.

Метоклопрамид трябва да се прилага внимателно при пациенти с тумор на млечната жлеза поради опасност от покачване на концентрациите на пролактин.

Метоклопрамид не трябва да се прилага продължително време.

4. 5. Лекарствени взаимодействия

Едновременното приемане потенцира седативно действие на алкохол, седативни лекарства, хипнотици, наркотици или транквилизатори.

Degan не се дава на пациенти, които приемат инхибитори на моноаминооксидазата.

Тъй като Degap влияе върху времетраенето на храносмилането и абсорбцията на храната при пациенти диабетици е необходимо да се коригира дозата на пероралните антидиабетици или инсулина.

Има съобщения за взаимодействия при едновременно приемане на метоклопрамид и салицилати, парацетамол, опиати, дигоксин, литий, циметидин, тетрациклини, мексилетин, деконгестантни продукти за лечение на хрема, антиасматични лекарства, антидепресанти, антиепилептици, антипаркинсонови продукти, лекарства за лечение на шизофрения, антиму斯卡ринови продукти (използвани при абдоминални спазми, менструални болки или напикаване, като хиосцин и пропантелин).

4. 6. Бременност и кърмене

Бременност

Няма данни за употреба на metoclopramide при бременни. Не се препоръчва употребата при бременни, и особено през първите три месеци на бременността, освен в случай след внимателна преценка на риск/полза от страна на лекаря.

Кърмене

По време на лечението кърмещи жени трябва да прекъснат кърменето.

4. 7. Влияние върху способността за шофиране и работа с машини

Лекарството може да предизвика сънливост, умора и замаяност. Лекарят и фармацевта трябва да уведомят пациента, че лекарството намалява способността за участие в уличното движение и работа с машини, особено в комбинация с алкохол.

4. 8. Нежелани лекарствени реакции

Наблюдаваните нежелани лекарствени реакции зависят от прилаганата доза и продължителността на лечение.

Най-често се наблюдават умора, сънливост и възбуда при 10% от пациентите.

Кръвна картина

Съобщени са случаи на агранулоцитоза, левкопения, неутропения и метхемоглобинемия.

Ендокринни смущения

Метоклопрамид стимулира отделянето на пролактин (пролактинемия) и може да причини напрежение в гърдите, гинекомастия, галактороея. Съобщени са случаи на преходно покачване на концентрациите на алдостерон в плазмата.

ЦНС

Умора, сънливост и възбуда се наблюдават при 10% от пациентите. Съобщени са също и случаи на обърканост, главоболие, отпускане, тремор и депресия.

Екстрапирамидални реакции се срещат рядко (0,2%), най-често във вид на остра дистонична реакция, особено при млади жени, които приемат 30 - 40 mg metoclopramide на ден и при деца.

Обикновено те се наблюдават 36 часа след започване на лечението и изчезват 24 часа след преустановяването му. Възможността за проява на нежеланите лекарствени реакции може да се намали, ако дневната доза не надвишава 500 mcg/kg. При проява на тежка екстрапирамидна реакция се налага прекъсване приемането на metoclopramide.

Могат да се наблюдават дисфагия, опистотонус, схващане на мускулите на врата, брадикинезия, тризмус, спазъм на мускулите на лицето, окулогирични кризи.

Съобщени са също случаи на тетаничноподобни реакции и задържане в урината. Възможни са поява на симптоми на паркинсонизъм или симптоми на паркинсонична дискинезия, особено при прилагане на по-големи дози или при пациенти в напреднала възраст.



Рядко се проявяват мания, делириум, инсомния, малигнен невролептичен синдром и астения.

Кардиоваскуларна система

Възможна е поява на хипотензия или хипертензия, както и хипотензина или хипертензивна кризи. Съобщени са случаи на аритмия (пълна AV блокада, брадикардия, сърцебиене и суправентрикуларна аритмия).

Стомашно-чревен тракт

Могат да се проявят стомашно-чревни смущения (гадене, повръщане, диария, запек, сухота в устата).

Реакции на свръхчувствителност

Възможни са кожни реакции на свръхчувствителност, анафилаксия, уртикария и макулопапуларни обриви.

Пикочни пътища

Възможна е проява на полакиурия.

Репродуктивна система

Възможна е проява увреждане в либидото и болезнена полова възбуда.

4. 9. Предозиране

Симптомите на предозиране се проявяват като сънливост, слаба ориентация, гърчове и екстрапирамидни реакции – предимно неволеви движения. При необходимост екстрапирамидалните симптоми могат да се овладяват с антихолинергични продукти (напр. бентзотропин) или антипаркинсонови или антихитаминнови лекарства с антихолинергично действие. Симптомите обикновено изчезват след 24 часа. Хемодиализата не е ефективна.

Ако пациентът наскоро е взел свръхдоза от Degan® и е в съзнание, трябва да се предизвика повръщане и да се направи консултация с лекар.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ ДАННИ

5. 1. Фармакологични свойства на продукта

Фармакологична група: Усилващо перисталтиката, metoclopramide

АТС код: A03FA01

Metoclopramide действа холиномиметично и допаминергично.

Metoclopramide действа антиеметично и усилва моториката на горната част от стомашно-чревния тракт. Увеличава амплитудата и продължителността на езофагеалните контракции, увеличава тонуса на долния езофагеален сфинктер като предотвратява връщането на храна от стомаха, увеличава и амплитудата на стомашните контракции и тонуса на стомашната мускулатура. Така подсилва изпразването на стомаха, релаксира пилорния сфинктер и усилва перисталтиката на тънкото черво, ускорявайки преминаването на храната.

Metoclopramide преминава през кръвно-мозъчната бариера и блокира допаминовите рецептори в рефлексогенната зона.

Metoclopramide премахва затрудненията, причинени от смущения в стомашно-чревния тракт: гадене, повръщане, чувството на тежест в стомаха, газове и хълцане. Не притежава парасимпатиколитично, антихистаминно, антисеротонинергично, или ганглиоплегично действие, не влияе върху артериалното налягане, дишането и други. Не повлиява тонуса на дебелото черво и жлъчния мехур, както и върху отделянето на жлъчни, стомашни или панкреатични сокове.

5. 2. Фармакологични свойства на лекарството

Разпределение

Повърхността под кривата на концентрация линейно расте с дозата от 20 до 100 mg. Максималната концентрация нараства линейно с дозата; времето, необходимо за достигане на максималната концентрация остава същото; общият клирънс остава непроменен; и степента на отделянето остава същата. Приблизително 30 % от приложената доза метоклопрамид се свързва с плазмените протеини. Общият обем на разпределение е висок (3,5 l/kg), което осигурява отличното разпределение на метоклопрамид в тъканите.

Метаболизъм и отнеждане

Приблизително 85 % от приложената перорално доза се излъчва с урината за 72 часа. Половината е свободен или конюгиран metoclopramide. Елиминационният полуживот при хора с нормална функция на бъбреците е 5 до 6 часа.

Намалената функция на бъбреците влияе върху клирънса на metoclopramide; намаление на креатининовия клирънс е свързано с намаляване на плазмения и бъбречния клирънс, небъбречния клирънс и увеличаване на елиминационния полуживот. Намаляването на клирънса при намалена функция на бъбреците доказва, че дозата трябва да се коригира, за да се избегне кумулацията на лекарството.

5. 3. Предклинични данни за безопасност

Metoclopramide повишава концентрацията на пролактина и то се запазва и при продължителна употреба на лекарството. Експериментални изследвания върху тъканните култури показват, че приблизително една трета от карциномите на млечната жлеза зависи от пролактина. Този факт е от голямо значение, когато се решава да се предприеме metoclopramide на пациентка с доказан карцином на млечната жлеза. Въпреки че, при употреба на лекарства, които повишават концентрацията на пролактин в серума, могат да се появяват смущения като галакторея, аменорея, гинекомастия и импотентност, при повечето болни няма данни за значително клинично повишаване на пролактин в серума. След продължително използване на metoclopramide или на лекарства, стимулиращи излъчването на пролактин, при гризачи се наблюдава увеличаване честотата на неоплазмите. Както при клинични, така и при епидемиологични проучвания досега не беше потвърдена връзка между продължителното използване на тези лекарства и развитие на тумори на млечните жлези; досегашните доказателства не са достатъчни, за да се направят заключения.

Остра токсичност

Стойностите на LD₅₀ при мишки са 100-1000 пъти по-високи от терапевтичните дози прилагани при човек.

Мутагенност

Резултатите от in vitro теста на Еймс за мутагенност направен с metoclopramide е отрицателен.

Тератогенност

Метоклопрамид няма тератогенно действие.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНА ЧАСТ

6. 1. Списък на помощните вещества

Hydrochloric acid (за коригиране на pH стойността), Water for injection.



6. 2. Несъвместимост

Неприложими при тази лекарствена форма.

6. 3. Срок на годност

5 години

Лекарството не трябва да се употребява след срока на годност.

6. 4. Специални условията за съхранение

Да се съхранява при температура под 25° С на защитено от пряка светлина място.

Да се съхранява в оригиналната картонена опаковка.

Да се съхранява на места недостъпни за деца.

6. 5. Опаковка

Ампули от безцветно стъкло, хидролитичен клас I в картонена опаковка по 50 бр.

6. 6. Указания за приготвяне

Няма

7. Име и адрес на притежателя на разрешението за употреба

LEK, Pharmaceutical d.d., Verovskova 57, Ljubljana, Slovenia

8. Регистрационен номер**9. Дата на регистрация****10. Дата на актуализация на текста**

Януари 2004 г.