

**ПРИЛОЖЕНИЕ I**  
**КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА**

**1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ**

ANTIEMETIN 5 mg/ml solution for injection  
АНТИЕМЕТИН 5 mg/ml инжекционен разтвор

**2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ**

Всяка ампула от 2 ml съдържа активно вещество метоклопрамидов хидрохлорид (*metoclopramide hydrochloride*) 10 mg.  
Помощни вещества: натриев метабисулфит, натрий.  
За пълния списък на помощните вещества, виж т.б.1.

**3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА**

Инжекционен разтвор

**4. КЛИНИЧНИ ДАННИ**

**4.1 Терапевтични показания**

**Симптоматично лечение на:**

- нарушение в мотилитета на горната част на стомашно-чревния тракт;
- гадене и повръщане;
- диабетна гастропареза.

**В гастроинтестиналната диагностика** - за усилване перисталтиката при провеждане на рентгено-контрастни изследвания.

**4.2 Дозировка и начин на приложение**

**Начин на приложение:** интрамускулно или бавно интравенозно (за 1-2 минути).

**При медицински показания**

**Възрастни и подрастващи над 14 години:** по 10 mg 1-3 пъти дневно. Максималната еднократна доза е 20 mg. Максималната дневна доза е 60 mg.

**Деца от 2 до 14 години:** лечението при тази група пациенти започва с най-ниската доза.

Препоръчаната дозировка е в съответствие с телесното тегло на пациента -

0,1 mg/kg телесно тегло (0,02 ml/kg). Максималната дневна доза е 0,5 mg/kg телесно тегло:

- тегло до 50 kg – еднократна доза 5 mg (1 ml). Максимална дневна доза 25 mg.

- тегло над 30 kg – еднократна доза 3 mg (0,6 ml). Максимална дневна доза 15 mg.

- тегло над 20 kg – еднократна доза 2 mg (0,4 ml). Максимална дневна доза 10 mg.

**Продължителност на лечението:** метоклопрамид под формата на инжекционен разтвор се използва за краткотрайно лечение при пациенти, при които е невъзможно перорално лечение.

След стабилизиране състоянието на пациента се преминава към перорално лечение.

**При диагностични процедури**

Прилага се еднократно 5-10 минути преди провеждане на процедурата. Препоръчват се следните дози:

**Възрастни и подрастващи над 14 години:** по 10-20 mg (1-2 ампули) бавно венозно.

**Деца от 2 до 14 години:** по 0,1 mg/kg телесно тегло (0,02 ml/kg).

**Пациенти с нарушени бъбречни и чернодробни функции:** метоклопрамид се екскретира чрез бъбреците и при пациенти с увредена бъбречна функция нараства риска от нежелани реакции. При пациенти с креатининов клирънс < 40 ml/min лечението с метоклопрамид трябва да се провежда с 1/2 от препоръчаната доза за възрастни.

НАЦИОНАЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА  
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1  
Код PV 20050524, 23.11.2009  
Одобрено: 43/02.11.2009

П - 6278 / 23.11.2009



**Пациенти над 65 години:** при тях трябва да се назначават възможно най-ниските ефективни дози, тъй като съществува по-висок риск от поява на нежелани лекарствени реакции. При пациенти с възрастови изменения на бъбречната функция дозата трябва да се съобразява със стойностите на креатининовия клирънс.

#### 4.3 Противопоказания

- Свръхчувствителност към активното вещество метоклопрамид или някое от помощните вещества на продукта;
- Състояния, при които стимулирането на гастроинтестиналния мотилитет е опасно: кръвотечение от гастро-интестиналния тракт, перфорация на стомаха или червата, стеноза на пилора, механична чревна непроходимост;
- Феохромоцитом;
- Пролактинзависими тумори.

#### 4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

- Метоклопрамид трябва да се прилага с внимание при деца, младежи и възрастни пациенти (над 65 години), тъй като при тези възрастови групи рискът от поява на екстрапирамидни нарушения е по-висок.
- При пациенти с болест на Паркинсон приложението на метоклопрамид може да доведе до влошаване на заболяването.
- Метоклопрамид трябва да се прилага с внимание при пациенти с епилепсия, тъй като може да повиши честотата или интензивността на епилептичните пристъпи.
- Метоклопрамид може да провокира депресия. Трябва да се прилага с внимание при пациенти с анамнеза за депресии в миналото и само ако очаквания резултат превишава потенциалния риск.
- Метоклопрамид самостоятелно или в комбинация с невролептици може да предизвика появата на невролептичен малигнен синдром (виж т. 4.8).
- Метоклопрамид трябва да се прилага с внимание при пациенти с артериална хипертония, тъй като може да предизвика повишаване нивото на катехоламините в кръвта и да влоши състоянието им.
- Метоклопрамид предизвиква преходно повишаване на плазмените нива на алдостерон, което, особено при пациенти с нарушена функция на черния дроб или с конгестивна сърдечна недостатъчност, може да доведе до задържане на течност в организма.
- Съдържащият се в лекарствения продукт натриев метабисулфит може да предизвика алергичен тип реакции и бронхоспазъм, особено при пациенти с анамнеза за астма или алергии.
- Количеството на  $\text{Na}^+$  в лекарствения продукт на доза е в прагова стойност ( $<1$  mmol/доза).

#### 4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

- Ефектът на метоклопрамид върху гастроинтестиналния мотилитет може да бъде отслабен при едновременно прилагане с антихолинестеразни лекарства и наркотични аналгетици.
- Метоклопрамид потенцира действието на алкохол и лекарства, потискащи ЦНС (седативни, сънотворни, наркотици, транквилизатори). По време на лечението с метоклопрамид не трябва да се приема алкохол.
- Метоклопрамид не трябва да се прилага едновременно с MAO-инхибитори, тъй като е възможно засилване на нежеланите им ефекти (повишаване на артериалното налягане при хипертоници).
- Метоклопрамид не трябва да се приема едновременно с невролептици, тъй като повишава риска от екстрапирамидни реакции и поява на невролептичен малигнен синдром.
- Метоклопрамид засилва резорбцията на тетрациклин, ампицилин, парацетамол, ацетилсалицилова киселина, леводопа.



- Метоклопрамид потиска резорбцията на дигоксин и циметидин, в резултат на което се понижават плазмените им концентрации.

#### 4.6 Бременност и кърмене

**Бременност.** Проучвания върху репродуктивните функции на експериментални животни не показват нарушения във фертилитета или увреждания на фетуса при приложение на метоклопрамид в дози, значително превишаващи ефективните при човек. Не са провеждани контролирани клинични проучвания при бременни, поради което употребата на метоклопрамид не се препоръчва по време на бременност. Метоклопрамид може да се назначава на бременни само ако очакваната полза за майката превишава риска за плода.

**Кърмене.** Метоклопрамид се екскретира в кърмата, поради което при необходимост от лечение на кърмещи жени кърменето трябва да се прекрати.

#### 4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Метоклопрамид може да предизвика замаяване, виене на свят, депресия, поради което при приложение на Антиеметин трябва да се избягва шофиране и извършване на дейности, свързани с бързи психомоторни реакции и повишена концентрация на вниманието.

#### 4.8 Нежелани лекарствени реакции

Нежеланите лекарствени реакции са описани по-долу, класифицирани по органи и системи и по честота. Нежеланите реакции се класифицират по честота по следния начин: много чести ( $\geq 1/10$ ), чести ( $\geq 1/100$  и  $<1/10$ ), нечести ( $\geq 1/1\ 000$  и  $<1/100$ ), редки ( $\geq 1/10\ 000$  и  $<1/1\ 000$ ) и много редки ( $<1/10\ 000$ ), включително единични съобщения.

Възможните нежелани реакции при приложение на метоклопрамид са следните:

**Изследвания:** повишаване серумните нива на пролактин и в резултат нарушения на менструалния цикъл.

**Сърдечни нарушения:** много редки - брадикардия, сърдечен блок при интравенозно приложение.

**Нарушения на кръвта и лимфната система:** много редки - метхемоглобинемия.

**Нарушения на нервната система:** метоклопрамид, като допаминов антагонист, може да предизвика екстрапирамидни нарушения (остри дистонични реакции); редки - сънливост, чувство на страх, безпокойство, замаяност, възбудимост, раздразнителност, прилошаване; много редки - невролептичен малигнен синдром, който се характеризира с хипертермия, нарушение на съзнанието, мускулна ригидност; от страна на автономната нервна система – аритмии, тахикардия, нестабилно артериално налягане.

При продължителен прием при гериатрични пациенти може да се развие паркинсонизъм и тардивна дискинезия.

**Стомашно-чревни нарушения:** редки – диария; много редки – подуване на езика, запек.

**Нарушения на кожата и подкожната тъкан:** много редки – кожни обриви.

**Съдови нарушения:** много редки - хипотония.

**Нарушения на имунната система:** много редки – реакции на свръхчувствителност, включително анафилаксия.

**Нарушения на възпроизводителната система и гърдата:** съобщения за гинекомастия, галакторея.

**Психични нарушения:** много редки – безпокойство, депресия.

#### 4.9 Предозиране

**Симптоми:** сънливост, дезориентация, гърчове, екстрапирамидни разстройства.

**Лечение:** При необходимост лечението се провежда с холинолитици и антипаркинсонови лекарства. Хемодиализата е неефективна.



## 5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

### 5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: усилващи мотилитета лекарства, АТС код: А03F А01

Метоклопрамид е специфичен блокатор на допамин D<sub>2</sub>-рецепторите и серотониновите рецептори с прокинетино и антиеметично действие. Нормализира дейността на гастроинтестиналния тракт – намалява двигателната активност на хранопровода, повишава тонуса на долния сфинктер на хранопровода, ускорява изпразването на стомаха, ускорява придвижването на храната през тънките черва, без да предизвиква диария. Не повлиява стомашната, жлъчната и панкреатичната секреция. Метоклопрамид осъществява антиеметично действие чрез въздействие върху хеморецепторната тригер зона в продълговатия мозък. Метоклопрамид стимулира продукцията на пролактин и предизвиква преходно повишаване нивата на алдостерон в кръвта.

### 5.2 Фармакокинетични свойства

**Разпределение:** Бионаличността му е около 80%. Свързването на метоклопрамид с плазмените протеини е слабо - около 30%. Обемът на разпределение е около 3,5 l/kg. Преминава хематоенцефалната и плацентарната бариери.

**Метаболизъм:** Метаболизира се при първо преминаване през черния дроб (*first pass effect*) в много малка степен.

**Екскреция:** Около 85% от приетата доза се екскретира с урината в непроменен вид. Елиминационният му полуживот е 4-6 часа. Екскретира се в кърмата.

### 5.3 Предклинични данни за безопасност

Метоклопрамид проявява потенциални мутагенни и кластогенни ефекти. Генотоксичността му все още не е изяснена.

Репродуктивни изследвания върху мишки, плъхове и зайци при прилагане на метоклопрамид в дози от 12 до 250 пъти превишаващи терапевтичната доза при човек, показват липса на ефект върху фертилитета и нежелани ефекти върху фетуса.

Няма данни за мутагенно действие по Ames тест.

## 6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

### 6.1 Списък на помощните вещества

Натриев хлорид, натриев метабисулфит, динатриев едетат, натриев ацетат трихидрат, ледена оцетна киселина, вода за инжекции.

### 6.2 Несъвместимости

Не са известни.

### 6.3 Срок на годност

2 години

### 6.4 Специални условия на съхранение





Да се съхранява в оригиналната опаковка, на защитено от светлина място. Да се съхранява под 25° С.

#### **6.5 Данни за опаковката**

По 2 ml инжекционен разтвор в ампули от кафяво стъкло, с маркировка за отваряне на ампулата (цветна точка или пръстен).

По 10 ампули в блистер от PVC фолио, по 1 или 10 блистера в картонена кутия, заедно с листовка.

#### **6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне и работа**

Няма специални изисквания

### **7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА**

СОФАРМА АД  
ул. Илиенско шосе 16, 1220 София, България

### **8. НОМЕР(А) НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА**

### **9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ/ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА**

### **10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА**

Септември 2009

