

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

РЕГЛАН 10 mg таблетки
REGLAN® 10 mg tablets

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВОТА	
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1	
Към Рег. №	200 50444
Разрешение №	9398 / 20. 04. 2010
Одобрение №	/

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всяка таблетка съдържа 10 mg метоклопрамидов хидрохлорид, под формата на монохидрат.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

* Таблетки

Таблетки са кръгли, бели, плоски таблетки с разделителна линия от едната страна. Таблетките могат да се разделят на две равни половини.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1. Терапевтични показания

Заболявания на храносмилателната система:

- Облекчаване на симптоми на стомашна малфункция (киселини в стомаха, диспепсия, гадене, повръщане, болки, метеоризъм, чувство на стомашно неразположение), свързани с пептична язва, кисел рефлукс в хранопровода, гастрит, хиатална херния и камъни в жлъчката;

- Диабетна гастропареза.

Постхирургическа стомашна стаза.

Следоперативно гадене и повръщане.

Диагностични процедури (улеснение на пасажа през стомаха и тънките черва при рентгенови изследвания, интубиране за биопсии).

4.2. Дозировка и начин на приложение

Медицински показания

Възрастни над 20 годишна възраст

10 mg три до четири пъти дневно, перорално 30 минути преди хранене или преди лягане.

При нужда дозата може да се повтори след всеки 6 часа.

Юноши (15-19 годишна възраст)

60 kg или повече: 10 mg, три пъти на ден;

30-59 kg: 5 kg, три пъти на ден.

Реглан таблетки не са подходящи за деца под 15 години.



Дозиране при бъбречна и чернодробна недостатъчност

При пациенти с клинично значима степен на бъбречна или чернодробна недостатъчност, лечението трябва да бъде с намалена дозировка.

Бъбречно увреждане (креатининов клирънс < 40 ml/min): администриране на половината от дозата.

Чернодробно увреждане: намаляване на дозата на около 50% се препоръчва в случаи на чернодробна цироза.

Диагностични процедури (еднократна доза може да се даде 30 минути преди процедурата)

Възрастни над 20 годишна възраст: 10 mg – 20 mg.

Юноши (15-19 годишна възраст): 10 mg.

4.3. Противопоказания

Свръхчувствителност към метоклопрамид или към някоя от съставките на лекарствения продукт.

Феохромоцитом (поради риск от хипертонични реакции; освен ако не се използва за провокационни и диагностични тестове).

Стомашно-чревни кръвоизливи, обструкция (механична) или перфорация.

Съпътстваща терапия с лекарства, които могат да предизвикат екстрапирамидни реакции.

Пациенти със съпътстваща анамнеза за късна дискинезия, предизвиквана от невролептици.

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки за употреба

Не е препоръчително това лекарство да се използва при пациенти с епилепсия, тъй като бензамидите понижават прага за припадък (риск от повишена честота и интензитет на кризите).

Особено внимание е необходимо при възрастни пациенти; в случаите на тежка бъбречна недостатъчност или при пациенти с болестта на Паркинсон (симптомите може да са изострени).

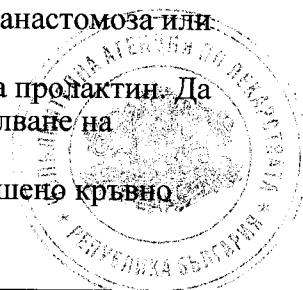
Лечението с метоклопрамид трябва да бъде преустановено, ако се появят екстрапирамидни симптоми. Честотата на нежеланите ефекти от страна на централната нервна система е особено висока при деца под 14 год. възраст (симптомите на интоксикация включват тревожност, раздразнителност, болка в шията и ригидност, екстрапирамидни симптоми и мускулна хипертония).

Нежеланите лекарствени реакции са спонтанни и напълно обратими след преустановяване на приема на лекарството или след прилагане на съответно симптоматично лечение (бензодиазепини при деца и/или антипаркинсонови антихолинергични средства при възрастни).

Метоклопрамид може да увеличи налягането по шевовете след чревна анастомоза или сляпо зашиване.

Метоклопрамид може да предизвика повишаване на серумното ниво на пролактин. Да се използва с внимание при пациенти с тумори на млечната жлеза (усилване на пролактина).

Метоклопрамид трябва да се прилага внимателно при пациенти с повишено кръвно налягане (усилване на циркулиращите катехоламини).



Да се използва с внимание при пациенти с история за депресия.

Рисковите фактори за възникване на тардивна дискинезия включват: възраст, женски пол, афективни разстройства, употреба на антихолинергични средства и доза/продължителност на лечение с невролептици.

Метоклопрамид не е предназначен за дълготрайна употреба.

Реглан съдържа лактоза. Пациенти с редки наследствени проблеми на галактозна непоносимост, Ларр лактазен дефицит или глюкозо-галактозна малабсорбция не трябва да приемат това лекарство.

4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Алкохол и препарати, потискащи централната нервна система – усилване на седативния ефект.

МАО инхибитори, невролептици, трициклични антидепресанти, симпатомиметици – увеличен риск от поява на екстрапирамидна симптоматика.

Антипаркинсонови средства (леводопа, антихолинергичи, бромокриптин), сънотворни, спазмолитици и антихолинергичи – понижават активността на метоклопрамид.

Циметидин, дигоксин – намалена ефективност.

Циклоспорин, мексилетин, парацетамол, салицилати, диазепам, литий, тетрациклини – метоклопрамид повишава тяхната абсорбция и токсичност.

Сукцинилхолин – пролонгирана нервномускулна блокада.

4.6 Бременност и кърмене

Изследванията върху репродуктивността при животни са показали, че метоклопрамид не повлиява фертилитета и не уврежда плода. Не е установено, че метоклопрамид увеличава честотата на уврежданията у новороденото при майки, получавали лекарството в различно време до 28-та седмица от бременността. Все пак няма проведени добре контролирани изследвания при бременни жени.

Поради това назначаването на метоклопрамид в периода на бременността е оправдано, само ако потенциалната полза от приложението му значително превишава потенциалния риск за новороденото.

Метоклопрамид се екскретира в майчиното мляко и кърменето трябва да се избягва по време на терапия с метоклопрамид.

4.7 Ефект върху способността за шофиране и работа с машини

Пациентите трябва да са предупредени, че метоклопрамид може да повлияе на психофизичните способности за управление на превозни средства и работа с машини поради появата на сънливост в периода на прием на лекарството.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Нежелани действия на метоклопрамид зависят от дозата и продължителността на лечението. Възможните нежелани лекарствени реакции, за които е съобщавано, са класифицирани съгласно MedDRA системно-органна класификация.



Нарушения на кръвта и лимфната система

Левкопения, неутропения, агранулоцитоза и метхемоглобинемия (у новородени).

Нарушения на имунната система

Алергична реакция - анафилактична реакция.

Нарушения на ендокринната система

Пролактинемия, напрежение в млечните жлези, гинекомастия, галакторея.

Нарушения на нервната система

Първичните нежелани действия върху централната нервна система са неврологични и психични и включват атетоидни движения, тремор, сънливост или депресия.

Най-честите нежелани ефекти са сънливост, умора, раздразнителност и се появяват при до 10% от лекуваните пациенти.

Екстрапирамидните реакции не са рядкост при терапия с метоклопрамид, а истински дистонични реакции се наблюдават при около 1% от лекуваните пациенти.

Екстрапирамидната симптоматика се появява по-често при жени, отколкото при мъже и по-често при деца, отколкото при възрастни. Тези реакции могат да включват тризмус, тортиколис, лицеви спазми, опистотонус, брадикинезия, очедвигателни кризи, дисфагия, задръжка на урината и тетаноподобни реакции. Екстрапирамидната симптоматика се появява обикновено в първите 36 часа на терапията и отзвучава до 24 часа след прекъсване на лечението. Повечето пациенти се повлияват от антихолинергични агенти от типа на бензтропин.

Късна дискинезия – съобщавано е за обратима и необратима дискинезия при продължителна употреба (месеци до години) на метоклопрамид. Рисковите фактори за развитие на късна дискинезия включват: възраст, женски пол, афективни разстройства, употреба на антихолинергични препарати и невролептици.

Рядко могат да възникнат безсъние, възбуда, главоболие, депресия, делир, мания и дисфория, както и малигнен невролептичен синдром.

Сърдечни нарушения

Аритмии (палпитации, брадикардия, суправентрикуларна аритмия, пълен сърдечен блок).

Съдови нарушения

Съобщавано е за хипотензия и хипертонични кризи.

Стомашно-чревни нарушения

Съобщавано е за диария при терапия с метоклопрамид. Рядко могат да възникнат запек или гадене.

Нарушения на бъбреците и пикочните пътища

Полиурия, инконтиненция.

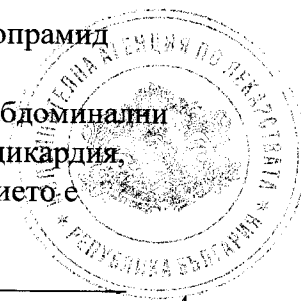
Нарушения на възпроизводителната система и гърдата

Сексуални разстройства и приапизъм.

4.9. Предозиране

Не са наблюдавани смъртни случаи след инцидентно поглъщане на метоклопрамид дори във високи дози с цел самоубийство.

При случаи на предозиране се съобщава за обърканост, раздразнителност, абдоминални крампи, сомнолентност, световъртеж, екстрапирамидна симптоматика, брадикардия, хипер/хипотензия, възбуденост, тризмус. Няма специфичен антидот. Лечението е



симптоматично (стомашна промивка, медицински въглен, антихолинергици, миорелаксанти).

Малигнен невролептичен синдром се овладява с дантролен и/или бромокриптин.

Метхемоглобинемията се овладява с толуидин или метиленово синьо.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: Пропулзив, АТС код: A03FA01

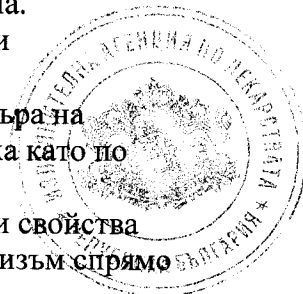
Метоклопрамид притежава, както холиномиметични, така и допаминергични свойства. Ефектите на метоклопрамид спрямо стомашно-чревния тракт включват: подобрен тонус в покой на езофагеалния сфинктер, подобрен стомашен тонус и перисталтика, отпускане на пилорния сфинктер и усилен дуоденална перисталтика. Комбинираният ефект на метоклопрамид спрямо стомашно-чревния тракт води до усиление на стомашното изпразване и намаляване на пасажното време през дуоденума, йеунума и илеума. Метоклопрамид няма ефект върху стомашната, панкреатичната и жлъчната секреция и притежава само минимален контрактилен ефект спрямо дебелото черво. Метоклопрамид повишава тъканната чувствителност към ацетилхолин. Метоклопрамид води до изразена координация на антралната и дуоденалната активност. Това става независимо от предшестващия тонус на червата в момента на приемане на лекарството. При пациенти със слаба антрална и силна дуоденална мускулна активност метоклопрамид е най-ефективен при подпомагане на стомашното изпразване, докато при пациенти с нормален стомашен пасаж метоклопрамид е относително неефективен. Тъй като в идеалния случай стомашният пасаж е свързан със силни контракции на антрума, метоклопрамид проявява максималния си ефект, когато е налице изразена дуоденална активност със слаби контракции на антрума.

Метоклопрамид усилюва контрактилната сила на перисталтиката в гладката мускулатура на хранопровода и предизвиква малки, но забележими промени в налягането, продължителността и скоростта на перисталтичната вълна. Метоклопрамид също е показал, че намалява дебита в езофагеалните варици и по този начин намалява налягането в тях. В едно изследване, в което са били включени болни от портална хипертензия (повишаване на кръвното налягане в порталните вени) и болни от езофагеални варици (варикозни вени на хранопровода); болните са лекувани с прилагане или на нитроглицерин (силнодействащ венозен дилататор) в съчетание с метоклопрамид или с прилагане само на нитроглицерин в големи дози. Комплексното лекуване е показало статистически значимо намаляване на налягането във вариците в сравнение с монотерапията, при която се е прилагал само нитроглицерин (SARYN & SARAYA, 1995).

Метоклопрамид е допаминов антагонист. Той преминава кръвно-мозъчната бариера и взаимодейства с допаминовите рецептори в хеморецепторната тригерна зона.

Метоклопрамид също повишава прага на хеморецепторната тригерна зона и предотвратява централното повръщане. Той понижава чувствителността на висцералните нерви, които предават стомашно-чревните импулси към центъра на повръщането. В допълнение метоклопрамид усилюва изпразването на стомаха като по този начин минимализира стазата, предшестваща повръщането.

Метоклопрамид притежава минимални антипсихотични и транквилизиращи свойства при хора, независимо че на животински модели е показал директен антагонизъм спрямо



централните допаминергични рецептори. Дискинезии, подобни на тези, предизвикани от фенотиазинови или бутирофенонови антипсихотични средства, предполагат, че метоклопрамид може да блокира централните допаминергични рецептори. Клинични изследвания разкриват, че приложението на метоклопрамид не изостря леводопамин-индуцираните дискинезии, нито паркинсоновите симптоми при болни с Паркинсонова болест.

Метоклопрамид блокира 5HT₃ рецепторите, разположени предимно в тригемино-съдовата система. Това би могло да обясни антимигренозните свойства на метоклопрамид.

5.2. Фармакокинетични свойства

Абсорбция

Бионаличност: 50% до 80%.

Наблюдавана е значително по-голяма средна перорална бионаличност у пациенти с чернодробна цироза в сравнение с пациенти с нормална чернодробна функция (82% спрямо 60%). Два часа след пероралния прием на 10 mg метоклопрамид се постига концентрация от 40 ng/ml.

Разпределение

Тотално протеиново свързване: 30% до 40%; метоклопрамид се свързва първично с алфа-1-кисел гликопротеин. Обемът на разпределение е 2.2 до 3.5 L/kg. Метоклопрамид лесно преминава кръвно-мозъчната и плацентарната бариера; екскретира се в майчиното мляко.

Метаболизъм

Метоклопрамид се метаболизира до неактивни метаболити

Екскреция

Метоклопрамид се екскретира 70-85% през бъбреците като непроменен и като метаболити за 24 часа. Елиминационният му полуживот е 2.5-6 часа. При бъбречна недостатъчност полуживотът се удължава до 19 часа.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Изследванията върху животни са показали широк терапевтичен спектър на метоклопрамид.

LD₅₀ при мишки е 100-1000 пъти по-висока от терапевтичната доза. Данните за субхронична и хронична токсичност показват добра поносимост към метоклопрамид. Метоклопрамид няма тератогенен ефект.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Силициев диоксид, колоиден безводен;
Целулоза, микрокристална;
Магнезиев стеарат;
Царевично нишесте;
Лактоза монохидрат.



6.2 Несъвместимости

Неприложимо.

6.3 Срок на годност

5 (пет) години.

6.4 Специални указания за съхранение

Този лекарствен продукт не изисква специални условия за съхранение.

6.5 Данни за опаковката

40 таблетки от 10 mg в PVC/Al блистер опаковка /4 блистера по 10 таблетки/, поставени в картонена кутия.

6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне и работа

Няма специални изисквания.

Неизползваният продукт или отпадъчните материали от него трябва да се изхвърлят в съответствие с местните изисквания.

7. ПРИТЕЖАТЕЛЯ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

"Алкалоид" ЕООД
ж.к. "Мотописта" 2,
ул."Рикардо Вакарини" № 2, ет.3, ап.10
гр.София 1404, Р. България
тел. +359 2 80 81 081
факс: +359 2 95 89 367
e-mail: office@alkaloid.bg

8. НОМЕР(А) НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

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

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

06/2009

