

**КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА  
НА ПРОДУКТА**

**Gordox 100,000 KIU solution for injection**

**Гордокс инжекционен разтвор 100,000 KIU**

**1. ТЪРГОВСКО ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНОТО СРЕДСТВО**

Gordox 100,000 KIU solution for injection  
Гордокс инжекционен разтвор 100,000 KIU

**2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ**

Всяка ампула съдържа 10 000 KIU /ml aprotinin концентриран разтвор

**3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА**

Инжекционен разтвор: – бистър, безцветен, стерилен, воден разтвор

**4. КЛИНИЧНИ ДАННИ****4.1. Терапевтични показания**

За терапия на първична хиперфибринолитична хеморагия.

**4.1. Дозировка и начин на приложение**

Общи съображения:

Начин на приложение: чрез бавна интравенозна инжекция или инфузия

Дозировка:

Тест доза

Най-малко 10 минути преди началната доза трябва да бъде въведена интравенозно тест доза от 1 мл (напр. 10 000 KIU разтвор на аprotинин) за изпробване на свръхчувствителност към препарата (виж също 4.4. Специални предупреждения).

I. Лечение на първично хиперфибринолитично кървене

Възрастни

- Начална доза: 500 000 KIU аprotинин (т.е. 50 мл) се въвеждат като бавна интравенозна инфузия (максимална скорост на инфузията 5 мл/мин.) в легнало положение на пациента.

- По-нататъшна дозировка: 200 000 KIU аprotинин на всеки 4 часа като бавна инфузия.

Деца

- Дневна доза: 20 000 KIU аprotинин на кг телесно тегло дневно.

Пациенти в напреднала възраст: Не се изисква титриране на дозата при пациенти в напреднала възраст.

**4.3. Противопоказания**

Дисеминирана вътресъдова коагулация (DIC), свръхчувствителност към аprotинин или някое от помощните вещества, първите 3 месеца на бременността.

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

*Строго трябва да се вземат предвид нежеланите ефекти и оценката на съотношението полза и риск, когато се използва при следните пациенти:*

I. При пациенти с предшестваща терапия с аprotинин, тъй като повторното приложение на аprotинин увеличава риска от алергични реакции. Активната съставка на препаратите е с белтъчен произход и има полипептидна структура, поради което може да играе ролята на антиген и да причини анафилактичен шок. Пациенти, приемали аprotинин предварително между 15 дни и 6 месеца преди лечението, са изложени на повишен риск.

##### При тези пациенти

- трябва да се приложи 1 ml от тест дозата (виж 4.2. Дозировка) най-малко 10 минути преди въвеждането на терапевтичната доза,

- препоръчва се интравенозно приложение на H<sub>1</sub> антагонисти (антихистаминови средства) и H<sub>2</sub> антагонисти (напр. циметидин) непосредствено преди въвеждането на терапевтичната доза.

II. Пациенти, страдащи от алергична диатеза, могат да бъдат третирани с аprotинин само под стриктно наблюдение, тъй като е възможно да се появят псевдоалергични реакции.

##### При тези пациенти също

- трябва да се приложи 1 ml от тест дозата (виж 4.2. Дозировка) най-малко 10 минути преди въвеждането на терапевтичната доза,

- препоръчва се интравенозно приложение на H<sub>1</sub> антагонисти (антихистаминови средства) и H<sub>2</sub> антагонисти (напр. циметидин) непосредствено преди въвеждането на терапевтичната доза.

Терапевтичната доза може да предизвика реакции на свръхчувствителност (анафилактични), дори ако не е наблюдавана алергична реакция спрямо тест дозата. При поява на такива реакции приложението на аprotинин незабавно трябва да се спре и да се предприемат подходящи терапевтични мерки.

*За изпробване на чувствителността*, най-малко 10 мин. преди началната доза трябва да бъде въведена интравенозно тест доза от 1 ml (10 000 KIU аprotинин). При пациенти, реагиращи на тест дозата с каквито и да било алергични прояви, препаратът не може да се прилага, тъй като терапевтичната доза може да предизвика анафилактични реакции.

Парентерални продукти съдържащи бензилов алкохол не трябва да се използват при новородени, тъй като този консервант се свързва с фатален токсичен синдром при преждевременно родени деца.



#### 4.5. **Лекарствени и други взаимодействия**

В зависимост от дозата апротинин инхибира ефектите на антитромботичните средства като стрептокиназа, rt-PA (recombinant Tissue Plasminogen Activator) и урокиназа.

Лекарството не трябва да се прилага заедно с инфузионни разтвори, съдържащи декстран. (Те взаимно усилват алергичните си ефекти).

#### 4.6. **Бременност и кърмене**

Данните по време на *бременност и кърмене при човек* са ограничени и непълни за оценка на безопасността, поради това лекарството е противопоказано през първите 3 месеца на бременността. През второто и третото тримесечие на бременността, както и по време на кърмене, е необходима преценка на ползата спрямо възможния риск.

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

Няма налични данни дали Гордокс повлиява способността за шофиране и работа с машини.

#### 4.8. **Нежелани лекарствени реакции**

В курса на приложение е възможна появата на анафилактични или анафилактоидни реакции.

Анафилактични реакции с честота по-малко от 0.5% могат да се появят също така при повторно приложение. Дори ако пациентът понася втората доза, по-нататъшната терапия с апротинин може да доведе до тежка анафилаксия. Рискът от последната обаче е по-висок при пациенти, на които са прилагани повторни дози апротинин.

В някои случаи анафилактоидни реакции са наблюдавани дори при първата доза.

Симптомите на анафилактични/анафилактоидни реакции включват обриви, пруритус, диспнея, гадене и тахикардия, както и анафилактичен шок, съпроводен с циркулаторна недостатъчност, която в някои случаи може да доведе до смърт. В случай на поява на реакции на свръхчувствителност по време на инжектиране или инфузионно вливане приложението трябва да се прекрати незабавно. При необходимост трябва да се предприемат обичайните спешни мерки, включително прилагане на адреналин, кортикостероиди и заместителна терапия с течности.

#### 4.9. **Предозиране**

Няма специфичен антидот и се препоръчва симптоматично лечение.

### 5. **ФАРМАКОЛОГИЧНИ ДАННИ**

#### 5.1. **Фармакодинамични свойства**

АТС код: B02A B01

INN: aprotinin



Активната съставка на Гордокс е апротинин, който представлява ензим инхибиращ протеин, изолиран от тъканите на говежди бял дроб.

Той инхибира човешкия трипсин, плазмин, а така също и плазмения и тъканния каликреин посредством формиране на обратими ензим инхибиращи комплекси. Неговата активност се изразява в каликреин инактивиращи единици (КИУ). 1 КИУ е еквивалентна на 140 ng апротинин, т.е. 100,000 КИУ са еквивалентни на 14 mg апротинин.

## 5.2. Фармакокинетични свойства

Постоянната 24-часова интравенозна инфузия на апротинин в доза от 250,000 КИУ за час осигурява плазмена концентрация в условия на "steady-state" от порядъка на 40-50 КИУ/ml. Това се равнява на приблизително 1  $\mu\text{mol/l}$ , което е в същата степен както концентрацията на  $\alpha_2$ -антиплазмин в нормална плазма.

Елиминационният полуживот на апротинин в серума е приблизително 2 часа.

Апротинин се свързва с епителните клетки на проксималните бъбречни тубули и в по-малка степен, вследствие афинитета на алкалната апротининова молекула, с киселите гликопротеини, а също така и с хрущялната тъкан. Апротинин се метаболизира до късоверижни пептиди или аминокиселини вследствие лизозомната активност в бъбреците. Дори след приложение на доза от 1 000 000 КИУ апротинин не се екскретира в непроменен вид в урината.

При опити с животни, на които бъбречните съдове са лигирани, понижаването на концентрацията на апротинин в кръвта е значително удължено.

## 6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

### 6.1. Списък на помощните вещества

Sodium chloride, benzyl alcohol, water for injections

### 6.2. Несъвместимости

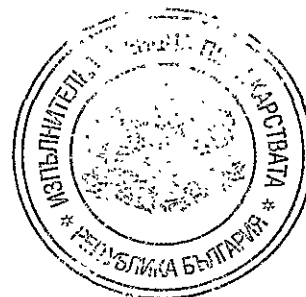
Апротинин трябва винаги да се разглежда като несъвместим с други лекарства. Той не трябва да се прилага в смесени инфузии. Ако е необходимо, може да бъде разреден с 0,9% разтвор на натриев хлорид или в най-малко 500 ml от 5% глюкозна инфузия. Последната трябва да бъде използвана в рамките на 4 часа.

Поради химическата несъвместимост, лекарственото средство не може да се прилага заедно с кортикостероиди и хранителни разтвори съдържащи аминокиселини или емулсии на мазнини.

### 6.3. Срок на годност

5 години

### 6.4. Специални препоръки за съхранение



Този продукт не изисква специални условия на съхранение.  
Ако съдържанието на флакона е мътно, лекарството не трябва да се прилага.  
След отваряне, флаконът трябва да се използва веднага.

- 6.5. Данни за опаковката**  
100,000 КIU/ 10 ml инжекционен разтвор: 10 ампули са опаковани в сгъваема картонена кутия или 25 ампули в пластмасова подложка поставена в кутия.
- 6.6. Препоръки при употреба/манипулиране**  
Няма специални изисквания.
- 7. ИМЕ И АДРЕС НА ПРИТЕЖАТЕЛЯ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА**  
Gedeon Richter Ltd.  
1103 Budapest X., Gyömrői út 19-21.  
Hungary
- 8. НОМЕР НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА**  
20010111
- 9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ/ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА**  
Подновяване: 17.01.2001
- 10. ДАТА НА (ЧАСТИЧНО) АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА**  
15 декември 2006

