

*Version 7.2, 10/2006*  
*Rev.1 07/2008*

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

## 1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Antiemetin 5 mg/5 ml syrup  
Антиеметин 5 mg/5 ml сироп

|  |
|--|
| <b>ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА</b>       |
| Кратка характеристика на продукта - Приложение 1 |
| Към РУ <u>П-4981, 25.05.09</u>                   |
| Одобрено: <u>33 / 11.03.09</u>                   |

## 2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

В 5 ml сироп се съдържа активното вещество метоклопрамидов хидрохлорид (metoclopramide hydrochloride) 5 mg.

Помощни вещества: глицерол, сорбитол, метил парахидроксibenзоат, пропил парахидроксibenзоат.  
За пълния списък на помощните вещества, вижте точка 6.1.

## 3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Сироп

Бистра, вискозна течност, с розово-жълт цвят, сладникаво-горчив вкус и специфичен мирис на шоколад.

## 4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

### 4.1 Терапевтични показания

#### Пациенти (над 20 години)

- Лечение на гастроезофагеална рефлуксна болест, която не се поддава на конвенционално лечение;
- Облекчаване на симптомите при остра и рецидивираща стомашна стаза при диабет, след ваготомия и абдоминална хирургия, прогресивна системна склероза, диспепсия от мотилитетен тип и др.
- Повръщане и гадене от различен произход при функционални и органични заболявания, както и профилактика на гаденето и повръщането при химиотерапия;
- Мигрена (метоклопрамид облекчава симптоми като гадене и повръщане при мигренозни пристъпи);
- В гастроинтестиналната диагностика - за усиляване перисталтиката при провеждане на рентгено-контрастни изследвания, както и за подпомагане на дуоденално сондиране.

#### Пациенти под 20 години и деца

Употребата на метоклопрамид се ограничава само при следните показания:

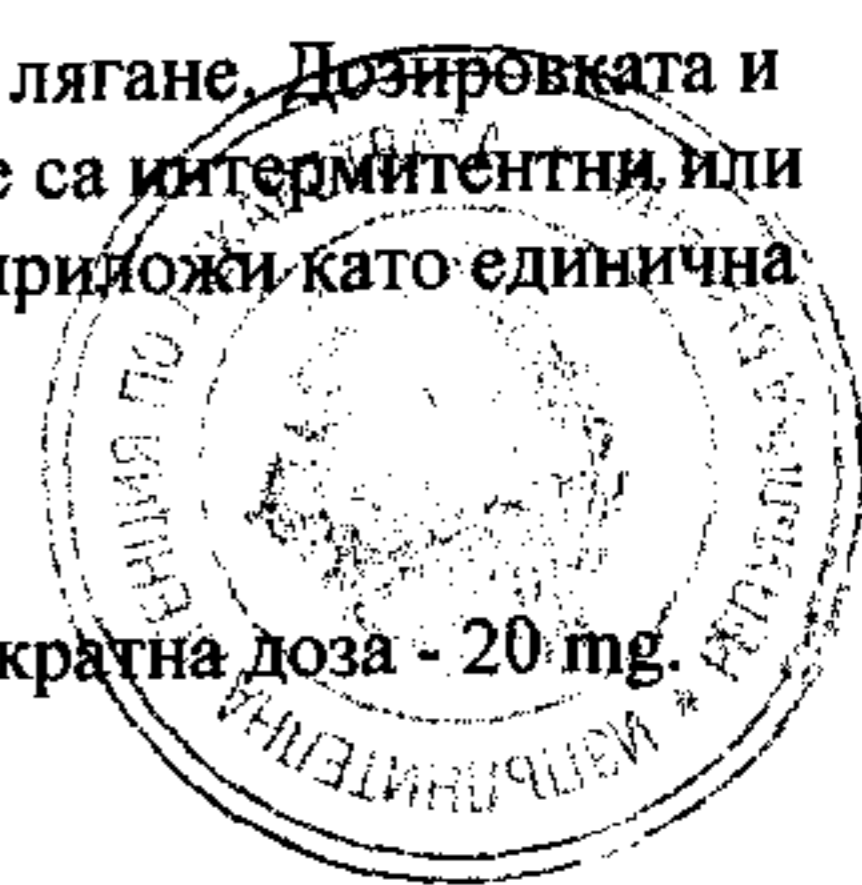
- Тежко, неподдаващо се на друга терапия повръщане;
- Повръщане при лъчетерапия и/или непоносимост към цитостатици;
- Помощно средство при интубация;
- Премедикация при хирургични интервенции.

### 4.2 Дозировка и начин на приложение

Сиропът се приема през устата 30 минути преди всяко хранене и вечер преди лягане. Дозировката и честотата на приема могат да се редуцират при състояния, когато симптомите са интермитентни или се появяват в специфично време. В такъв случай метоклопрамид може да се приложи като единична доза преди провокиращата ситуация.

#### При медицински показания

**Пациенти над 20 години:** по 10 mg (10 ml) 3 пъти дневно. Максимална еднократна доза - 20 mg.  
Максималната дневна доза е 60 mg.



**Пациенти под 20 години и деца над 1 година.** Лечението при тази група пациенти започва с най-ниската доза. Препоръчаната дозировка е в съответствие с телесното тегло на пациента. Максималната дневна доза не трябва да превишава 0,5 mg/kg телесно тегло:

**Пациенти под 20 години**

|                |                         |  |
|----------------|-------------------------|--|
| 15 – 19 години | над 60 kg<br>30 – 59 kg | По 10 mg (10 ml) 3 пъти дневно<br>по 5 mg (5 ml) 3 пъти дневно |
| <b>Деца</b>    |                         |  |
| 9 до 14 години | над 30 kg               | по 5 mg (5 ml) 3 пъти дневно                                   |
| 5 до 9 години  | 20-29 kg                | по 2,5 mg (2,5 ml) 3 пъти дневно                               |
| 3 до 5 години  | 15-19 kg                | по 2 mg (2 ml) 2 -3 пъти дневно                                |
| 1 до 3 години  | (10-14 kg):             | по 1 mg (1 ml) 2-3 пъти дневно                                 |

Антиеметин сироп не се препоръчва при деца под 1 година поради невъзможност за точно дозиране с приложените в опаковката мерителни чашка и лъжичка.

**Продължителност на лечението:** от 4 до 12 седмици.

**При диагностични процедури**

Антиеметин сироп се прилага еднократно 5-10 минути преди провеждане на процедурата.

Препоръчват се следните дози:

**Пациенти над 20 години:** 10-20 mg (10-20 ml);

**15 – 19 години:** 10 mg (10 ml);

**9 до 14 години:** 5 mg (5 ml);

**5 до 9 години:** по 2,5 mg (2,5 ml);

**3 до 5 години:** по 2 mg (2 ml);

**1 до 3 години:** по 1 mg (1 ml).

**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 ½ от препоръчаната доза за възрастни.

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

### 4.3 Противопоказания

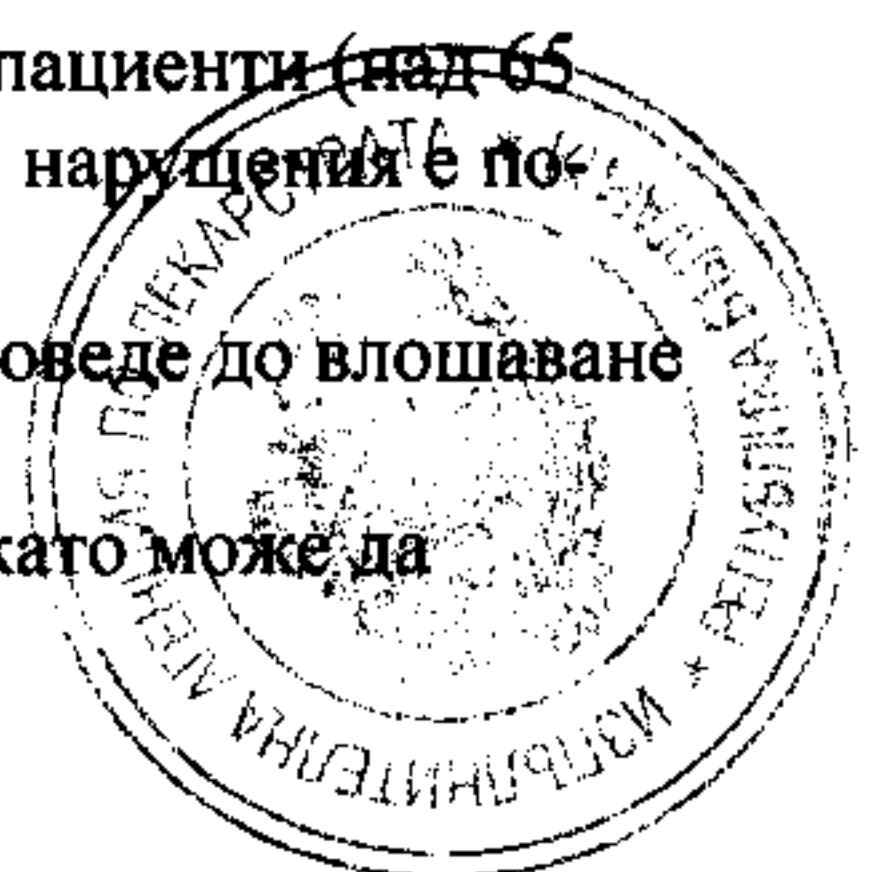
- Свръхчувствителност към активното вещество метоклопрамид или към някое от помощните вещества;
- Състояния, при които стимулирането на гастро-интестиналния мотилитет е опасно: кръвотечение от гастро-интестиналния тракт, перфорация на стомаха или червата, стеноза на пилора, механична чревна непроходимост;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

### 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 увеличи 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 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. 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.

Съдържащите се в лекарствения продукт метил парахидроксибензоат и пропил парахидроксибензоат могат да причинят алергични реакции (възможно е да са от забавен тип).

Този лекарствен продукт съдържа сорбитол. Пациенти с редки наследствени проблеми на непоносимост към фруктоза не трябва да приемат това лекарство.

Глицерол, който се съдържа в сиропа като помощно вещество, може да причини главоболие, стомашно дразнене, диария.

Продуктът съдържа оцветител Е110, който може да причини алергични реакции.

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

Ефектът на метоклопрамид върху гастроинтестиналния мотилитет може да бъде отслабен при едновременно приемане 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.

Метоклопрамид повишава резорбцията на тетрациклин, ампицилин, парацетамол, ацетилсалицилова киселина, леводопа.

Метоклопрамид потиска резорбцията на дигоксин и циметидин.

Метоклопрамид не трябва да се приема едновременно с невролептици, тъй като повишава риска от екстрапирамидни реакции и поява на невролептичен малигнен синдром.

#### **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 по време на приемането му трябва да се избягва шофиране и извършване на дейности, свързани с бързи психомоторни реакции и повишена концентрация на вниманието.

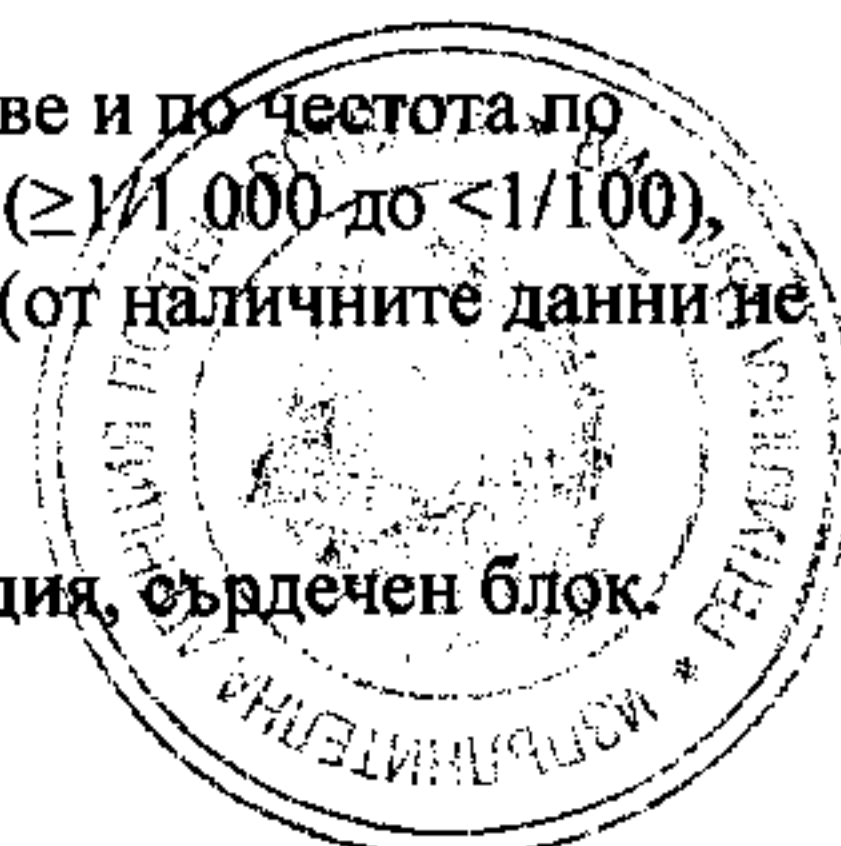
#### **4.8 Нежелани лекарствени реакции**

Нежеланите лекарствени реакции са представени по системно-органни класове и по честота по MedDRA конвенцията: много чести ( $\geq 1/10$ ), чести ( $\geq 1/100$  до  $< 1/10$ ), нечести ( $\geq 1/1\,000$  до  $< 1/100$ ), редки ( $\geq 1/10\,000$  до  $< 1/1\,000$ ), много редки ( $< 1/10\,000$ ), с неизвестна честота (от наличните данни не може да бъде направена оценка).

##### **Сърдечни нарушения**

**Редки** - хипотензия, хипертензия, суправентрикуларна тахикардия, брадикардия, сърдечен блок.

##### **Нарушения на кръвта и лимфната система**



*Много редки* - агранулоцитоза, метхемоглобинемия.

#### **Нарушения на нервната система**

*Редки* - в началото на лечението може да се наблюдава лесна уморемост, сънливост, главоболие, замаяност, възбудимост, раздразнителност, чувство на страх, безпокойство. Метоклопрамид, като допаминов антагонист, може да предизвика екстрапирамидни нарушения (остри дистонични реакции), които се изразяват с неволни движения на крайниците, тризмус, фациални спазми, ритмични протрузии на езика, булбарен тип говор, опистотонус. Наблюдават се по-често в юношеска и детска възраст при високи дози метоклопрамид (над 0,5 mg/kg/доза).

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

*Много редки* - невролептичен малигнен синдром. Характеризира се с хипертермия, нарушение на съзнанието, мускулна ригидност, от страна на автономната нервна система – аритмии, тахикардия, нестабилно артериално налягане.

#### **Стомашно-чревни нарушения**

*Много редки* – диария.

#### **Нарушения на бъбреците и пикочните пътища**

Ретенция на урината.

#### **Нарушения на ендокринната система**

*Много редки* – хиперпролактинемия, гинекомастия, галакторея, намалено либидо, нарушения на менструацията, временно повишаване плазмените нива на алдостерон.

#### **Нарушения на имунната система**

*Редки* - сърбеж, уртикария, бронхоспазъм, ангионевротичен оток.

#### **Хепато-билиарни нарушения**

Холестатична жълтеница.

#### **Психични нарушения**

*Много редки* - изолирани случаи на депресия, делириум, неконтролируем плач.

### **4.9 Предозиране**

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

**Лечение:** при необходимост лечението се провежда с холинолитици и антипаркинсонови лекарства.

## **5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА**

### **5.1 Фармакодинамични свойства**

Фармакотерапевтична група: лекарства за функционални гастро-интестинални нарушения, усилващи мотилитета, АТС код: A03F A01

Метоклопрамид е специфичен блокатор на допамин  $D_2$ -рецепторите и серотониновите рецептори с прокинетично и антиеметично действие. Нормализира дейността на гастро-интестиналния тракт – намалява двигателната активност на хранопровода, повишава тонуса на долния сфинктер на хранопровода, ускорява изпразването на стомаха, ускорява предвижването 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**

**Резорбция:** Бързо и почти напълно се резорбира в стомашно-чревния тракт след перорално приложение. Бионаличността му е около 80%. Максималната плазмена концентрация се достига средно между първия и втория час след приема.



**Разпределение:** Свързването на метоклопрамид с плазмените протеини е слабо - около 30%. Обемът му на разпределение е около 3,5 l/kg. Премахва 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. Времето на полуживот е 4-6 h. 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, превишаващи от 12 до 250 пъти 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**

Лимонена киселина, монохидрат; пропиленгликол, глицерол, сорбитол, метил парахидроксибензоат, пропил парахидроксибензоат, течна есенция „Шоколад“, оцветител Сънсет жълто 85 (E 110), пречистена вода.

### **6.2 Несъвместимости**

Неприложимо.

### **6.3 Срок на годност**

2 години.

Срок на годност след отваряне на бутилката – 1 месец.

### **6.4 Специални условия на съхранение**

Да се съхранява в оригиналната опаковка, за да се предпази от светлина.

Да се съхранява под 30°C.

Да се съхранява на място, недостъпно за деца!

### **6.5 Данни за опаковката**

Първична опаковка: 120 ml сироп в:

- тъмна стъклена бутилка с алуминиева или полиетиленова капачка;
- тъмна бутилка от полиетилен терефталат с полиетиленова капачка.

Вторична опаковка:

По 1 бутилка, заедно с мерителна чашка/лъжичка и листовка в картонена кутия.

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

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**

Февруари, 2009

