

ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

МЕТОКЛОПРАМИД ВЕЛФАРМ

Регистрационный номер: ЛП-005602

Торговое наименование: Метоклопрамид Велфарм

Международное непатентованное или группировочное наименование: метоклопрамид

Лекарственная форма: раствор для внутривенного и внутримышечного введения

Состав на 1 мл:

Действующее вещество: метоклопрамида гидрохлорида моногидрат (в пересчете на метоклопрамида гидрохлорид) – 5,0 мг

Вспомогательные вещества: натрия сульфит безводный, натрия хлорид, динатрия эдетата дигидрат (соль динатриевая этилендиамин-N,N,N',N'-тетрауксусной кислоты 2-водная, (трилон Б)), вода для инъекций.

Описание: прозрачный бесцветный раствор

Фармакотерапевтическая группа: противорвотное средство – дофаминовых рецепторов блокатор центральный

Код АТХ: A03FA01

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Специфический блокатор дофаминовых (D₂) и серотониновых (5-HT₃) рецепторов, угнетает хеморецепторы триггерной зоны ствола головного мозга, ослабляет чувствительность висцеральных нервов, передающих импульсы от привратника желудка и двенадцатиперстной кишки к рвотному центру. Через гипоталамус и парасимпатическую нервную систему (иннервация желудочно-кишечного тракта) оказывает регулирующее и координирующее влияние на тонус и двигательную активность верхнего отдела желудочно-кишечного тракта (в том числе тонус нижнего сфинктера пищевода). Повышает тонус желудка и кишечника, ускоряет опорожнение желудка, уменьшает гиперацидный стаз, препятствует пилорическому и эзофагеальному рефлюксу, стимулирует перистальтику кишечника. Нормализует отделение желчи, уменьшает спазм сфинктера Одди. Не изменяя его тонуса, устраняет дискинезию желчного пузыря. Не влияет на тонус кровеносных сосудов мозга, артериальное давление, функцию дыхания, а также почек и печени, на кроветворение, секрецию желудка и поджелудочной железы. Стимулирует секрецию пролактина. Увеличивает чувствительность тканей к ацетилхолину (действие не зависит от вагусной иннервации, но устраняется холиноблокаторами). Стимулирует

секрецию альдостерона, усиливает задержку ионов натрия и выведение ионов калия.

Начало действия на желудочно-кишечный тракт отмечается через 1-3 мин после внутривенного введения, 10-15 мин – после внутримышечного введения и проявляется ускорением эвакуации содержимого желудка (примерно от 0,5-6 ч в зависимости от пути введения) и противорвотным эффектом (продолжается 12 ч).

Фармакокинетика

Связь с белками плазмы – примерно 30 %. Подвергается метаболизму в печени. Период полувыведения составляет 4-6 ч, при нарушении функции почек – до 14 ч. Выведение препарата происходит в основном через почки в течение 24-72 ч в неизменном виде и в виде конъюгатов. Проходит через плацентарный и гематоэнцефалический барьеры и проникает в материнское молоко.

Показания к применению

Взрослые

Профилактика послеоперационной тошноты и рвоты.

Симптоматическое лечение тошноты и рвоты, в том числе при острой мигрени.

Профилактика тошноты и рвоты, вызванной лучевой терапией и химиотерапией.

Для усиления перистальтики при проведении рентгеноконтрастных исследований желудочно-кишечного тракта.

Дети

Вторая линия лечения послеоперационной тошноты и рвоты.

Вторая линия профилактики отсроченной тошноты и рвоты, вызванной химиотерапией.

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к метоклопрамиду и компонентам препарата;
- желудочно-кишечное кровотечение, механическая кишечная непроходимость или перфорация стенки желудка и кишечника, состояния, при которых стимуляция перистальтики желудочно-кишечного тракта представляет риск;
- подтвержденная или подозреваемая феохромоцитома в связи с риском развития тяжелой артериальной гипертензии;
- поздняя дискинезия, которая развилась после лечения нейролептиками или метоклопрамидом в анамнезе;
- эпилепсия (увеличение частоты и тяжести припадков);
- болезнь Паркинсона;
- одновременное применение с леводопой и агонистами дофаминовых рецепторов;
- метгемоглобинемия вследствие приема метоклопрамида или дефицита никотинамидадениндинуклеотида (НАДН) цитохрома-b5 в анамнезе;

- пролактинома или пролактинзависимая опухоль;
- детский возраст до 1 года;
- период грудного вскармливания.

С осторожностью

При применении у пожилых пациентов; у пациентов с нарушением сердечной проводимости (включая удлинение интервала QT), нарушением водно-электролитного баланса, брадикардией, принимающих другие препараты, удлиняющие интервал QT, артериальной гипертензией; у пациентов с сопутствующими неврологическими заболеваниями; у пациентов, принимающих препараты, воздействующие на центральную нервную систему, депрессией (в анамнезе); при почечной недостаточности средней и тяжелой степени тяжести (КК 15-60 мл/мин), в терминальной стадии (КК менее 15 мл/мин); при печеночной недостаточности тяжелой степени тяжести; при беременности.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Беременность

Метоклопрамид можно применять во время беременности (I-II триместры) только, если потенциальная польза для матери превышает потенциальный риск для плода. В связи с фармакологическими особенностями (подобно другим нейролептикам), при применении метоклопрамида в конце беременности нельзя исключить вероятность развития экстрапирамидных симптомов у новорожденного. Метоклопрамид не следует применять в конце беременности (во время III триместра). При применении метоклопрамида следует следить за состоянием новорожденного.

Период грудного вскармливания

Метоклопрамид в небольшом количестве выделяется с грудным молоком. Нельзя исключать возможность развития побочных реакций у ребенка. Применение метоклопрамида в период грудного вскармливания противопоказано. При необходимости применения препарата в период лактации следует прекратить грудное вскармливание.

Способ применения и дозы

Внутривенно или внутримышечно.

Внутривенные инъекции следует вводить болюсно медленно (не менее 3 мин).

Взрослые

Профилактика послеоперационной тошноты и рвоты

Рекомендуемая однократная доза 10 мг (1 ампула).

Вторая линия лечения послеоперационной тошноты и рвоты. Вторая линия профилактики отсроченной тошноты и рвоты, вызванной химиотерапией

Рекомендуемая однократная доза 10 мг (1 ампула) вводится до трех раз в сутки.

Для усиления перистальтики при проведении рентгеноконтрастных исследований желудочно-кишечного тракта. В качестве средства, облегчающего дуоденальное зондирование (для ускорения опорожнения желудка и продвижения пищи по тонкой кишке) Рекомендовано внутривенное болюсное медленное (не менее 3 мин) введение 10-20 мг (1-2 ампулы) за 10 мин до начала исследования.

Максимальная рекомендуемая суточная доза составляет 30 мг или 0,5 мг/кг.

Период введения препарата в виде инъекции должен быть максимально коротким с последующим переходом на лекарственную форму для приема внутрь или ректальную форму.

Дети в возрасте от 1 года до 18 лет

Вторая линия лечения послеоперационной тошноты и рвоты. Вторая линия профилактики отсроченной тошноты и рвоты, вызванной химиотерапией

Рекомендовано внутривенное болюсное медленное (не менее 3 мин) введение 0,1-0,15 мг/кг до 3 раз в сутки.

Максимальная суточная доза 0,5 мг/кг/сутки.

Режим дозирования

Возраст (лет)	Масса тела (кг)	Доза (мг)	Частота
1-3	10-14	1	До 3 раз в сутки
3-5	15-19	2	До 3 раз в сутки
5-9	20-29	2,5	До 3 раз в сутки
9-18	30-60	5	До 3 раз в сутки
15-18	Более 60	10	До 3 раз в сутки

Для усиления перистальтики при проведении рентгеноконтрастных исследований желудочно-кишечного тракта. В качестве средства, облегчающего дуоденальное зондирование (для ускорения опорожнения желудка и продвижения пищи по тонкой кишке)

У детей старше 15 лет

Рекомендовано внутривенное болюсное медленное (не менее 3 мин) введение 10-20 мг (1-2 ампулы) за 10 мин до начала исследования.

У детей в возрасте от 1 до 15 лет

Рекомендовано внутривенное болюсное медленное (не менее 3 мин) введение из расчета 0,1 мг/кг за 10 мин до начала исследования.

Максимальная продолжительность лечения для профилактики послеоперационной тошноты и рвоты составляет 48 ч.

Максимальный срок лечения для профилактики тошноты и рвоты, вызванных

химиотерапией, составляет 5 дней.

Во избежание передозировки необходимо соблюдать минимальный интервал между применением 6 ч, даже в случае рвоты.

Пожилые пациенты

У пожилых пациентов может потребоваться снижение дозы в связи со снижением функции почек и печени.

Почечная недостаточность

У пациентов с терминальной стадией почечной недостаточности (КК менее 15 мл/мин) суточная доза должна быть снижена на 75 %.

У пациентов с почечной недостаточностью средней или тяжелой степени тяжести (КК 15-60 мл/мин) доза должна быть снижена на 50 %.

Нарушение функции печени

У пациентов с печеночной недостаточностью тяжелой степени тяжести доза должна быть снижена на 50 %.

Побочное действие

Частота проявления неблагоприятных побочных реакций приведена в соответствии с классификацией ВОЗ: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100 - < 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000 - < 1/100$), редко ($\geq 1/10000 - < 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$).

Со стороны крови и лимфатической системы: частота неизвестна – метгемоглобинемия, вероятно связанная с дефицитом фермента НАДН-зависимой цитохром-b5 редуктазы (особенно у новорожденных), сульфгемоглобинемия (чаще всего при одновременном применении высоких доз серосодержащих препаратов), лейкопения, нейтропения, агранулоцитоз.

Со стороны иммунной системы: нечасто – гиперчувствительность; частота неизвестна – анафилактические реакции (в том числе анафилактический шок), аллергические реакции (крапивница, макулопапулезная сыпь).

Со стороны эндокринной системы: нечасто – аменорея, гиперпролактинемия; редко – галакторея; частота неизвестна – гинекомастия.

Эндокринные нарушения во время продолжительного лечения связаны с гиперпролактинемией (аменорея, галакторея, гинекомастия).

Нарушение психики: часто – депрессия; нечасто – галлюцинации; редко – спутанность сознания.

Со стороны нервной системы: очень часто – сонливость; часто – астения, экстрапирамидные нарушения (особенно у детей и молодых пациентов и/или при превышении рекомендованных доз препарата, даже после однократного введения);

паркинсонизм, акатизия; нечасто – дистония, дискинезия, нарушение сознания; редко – судороги (особенно у пациентов с эпилепсией); частота неизвестна – поздняя дискинезия, иногда персистирующая, во время или после длительного лечения (особенно у пожилых пациентов), нейролептический злокачественный синдром.

Со стороны сердца: нечасто – брадикардия; частота неизвестна – остановка сердца, которая может быть вызвана брадикардией, атриовентрикулярная блокада, блокада синусного узла, удлинение интервала QT на электрокардиограмме, аритмия типа «пируэт».

Со стороны сосудов: часто – понижение артериального давления; частота неизвестна – кардиогенный шок, острое повышение артериального давления у пациентов с феохромоцитомой.

Со стороны желудочно-кишечного тракта: часто – запор, диарея, тошнота.

Со стороны почек и мочевыводящих путей: частота неизвестна – полиурия, недержание мочи.

Со стороны половых органов и молочной железы: частота неизвестна – сексуальная дисфункция, приапизм.

Нежелательные реакции, наиболее часто встречающиеся при применении высоких доз препарата: экстрапирамидные симптомы: острая дистония и дискинезия, синдром паркинсонизма, акатизия развивались даже после применения однократной дозы препарата, особенно у детей и молодых пациентов (см. раздел «Особые указания»); сонливость, снижение уровня сознания, спутанность сознания, галлюцинации.

Передозировка

Симптомы

Экстрапирамидные нарушения, сонливость, снижение уровня сознания, спутанность сознания, галлюцинации, раздражительность, головокружение, брадикардия, изменения артериального давления, остановка сердца и дыхания, боль в животе.

Лечение

В случае развития экстрапирамидных симптомов, вызванных передозировкой или по другой причине, лечение носит исключительно симптоматический характер (бензодиазепины у детей и/или антихолинэргические противопаркинсонические препараты у взрослых).

Требуется симптоматическое лечение и постоянный контроль сердечно-сосудистой и дыхательной функций в зависимости от клинического состояния пациента.

Специфического антидота не существует.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Противопоказано одновременное применение метоклопрамида с леводопой или

агонистами дофаминовых рецепторов, в связи с имеющимся взаимным антагонизмом.

Алкоголь усиливает седативный эффект метоклопрамида.

Комбинации, требующие соблюдения осторожности

В связи с прокинетическим эффектом метоклопрамида всасывание некоторых препаратов может нарушаться.

M-холиноблокаторы и производные морфина обладают взаимным антагонизмом с метоклопрамидом в отношении влияния на перистальтику желудочно-кишечного тракта.

Лекарственные препараты, угнетающие ЦНС (производные морфина, транквилизаторы, блокаторы H₁-гистаминовых рецепторов, антидепрессанты с седативным эффектом, барбитураты, клонидин и прочие препараты этих групп) могут усиливать седативный эффект под влиянием метоклопрамида.

Метоклопрамид усиливает действие нейролептиков в отношении экстрапирамидных симптомов.

При сопутствующем применении внутрь метоклопрамида и тетрабеназина существует вероятность возникновения дефицита дофамина, что может сопровождаться повышением жесткости мышц или их спазмом, трудностями в речи или при глотании, беспокойством, тремором, непроизвольными движениями мышц, в том числе мышц лица.

Применение метоклопрамида с серотонинергическими препаратами, например, с селективными ингибиторами обратного захвата серотонина, повышает риск развития серотонинового синдрома (серотониновая интоксикация).

Метоклопрамид снижает биодоступность дигоксина. Следует контролировать концентрацию дигоксина в плазме крови.

Метоклопрамид повышает биодоступность циклоспорина (C_{\max} на 46 % и экспозицию на 22 %). Необходимо тщательно контролировать концентрацию циклоспорина в плазме крови. Клинические последствия такого взаимодействия не установлены.

Экспозиция метоклопрамида увеличивается при одновременном применении с мощными ингибиторами изофермента CYP2D6, например, флуоксетином и пароксетином. Хотя клиническая значимость такого взаимодействия не установлена, необходимо следить за появлением у пациентов побочных реакций.

При сопутствующем применении метоклопрамида с атовахоном значительно снижается концентрация атовахона в плазме крови (около 50 %). Сопутствующее применение метоклопрамида с атовахоном не рекомендуется.

При сопутствующем применении метоклопрамида с бромокриптином повышается концентрация бромокриптина в плазме крови.

Метоклопрамид усиливает всасывание тетрациклина из тонкого кишечника.

Метоклопрамид усиливает всасывание мексилетина и лития.

Метоклопрамид уменьшает всасывание циметидина.

Особые указания

Следует соблюдать осторожность при применении метоклопрамида у пожилых пациентов.

Со стороны нервной системы могут наблюдаться экстрапирамидные нарушения, особенно у детей и молодых пациентов и/или при применении высоких доз, развивающиеся, как правило, в начале лечения или после однократного применения. Применение препарата необходимо незамедлительно прекратить в случае появления экстрапирамидных симптомов. Реакции полностью обратимы после прекращения лечения, однако могут потребовать симптоматической терапии (бензодиазепины у детей и/или антихолинергические противопаркинсонические препараты у взрослых).

Во избежание передозировки препарата необходимо соблюдать минимальный интервал 6 ч между введениями препарата, даже в случае рвоты.

Длительное лечение препаратом может привести к развитию поздней дискинезии, потенциально необратимой, особенно у пожилых пациентов. Продолжительность лечения не должна превышать 3 месяца в связи с риском развития поздней дискинезии. При наличии признаков поздней дискинезии лечение необходимо прекратить.

При применении метоклопрамида одновременно с нейролептиками, а также при монотерапии метоклопрамидом отмечается нейролептический злокачественный синдром. Необходимо незамедлительно прекратить лечение препаратом при появлении симптомов нейролептического злокачественного синдрома и применить сопутствующую терапию.

Необходимо соблюдать осторожность при применении у пациентов с сопутствующими неврологическими заболеваниями и у пациентов, принимающих препараты, воздействующие на центральную нервную систему.

При применении препарата также могут отмечаться симптомы болезни Паркинсона.

Сообщалось о случаях возникновения метгемоглобинемии, которая могла быть вызвана дефицитом фермента НАДН-зависимой цитохром-b5 редуктазы. В этом случае применение препарата необходимо незамедлительно и полностью прекратить и предпринять соответствующие меры.

Сообщалось о случаях тяжелых сердечно-сосудистых побочных эффектах, включая сосудистую недостаточность, выраженную брадикардию, остановку сердца и удлинение интервала QT.

Необходимо соблюдать осторожность при применении препарата у пожилых пациентов, пациентов с сердечными нарушениями (включая удлинение интервала QT), пациентов с нарушением водно-электролитного баланса, брадикардией и у пациентов, принимающих

препараты, удлиняющие интервал QT.

При почечной недостаточности средней и тяжелой степени тяжести и печеночной недостаточности тяжелой степени тяжести рекомендуется снижение дозы (см. раздел «Способ применения и дозы»).

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при управлении автомобилем и занятии потенциально опасными видами деятельности, требующими концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций, т.к. применение препарата может вызывать сонливость и дискинезию.

Форма выпуска

Раствор для внутривенного и внутримышечного введения 5 мг/мл.

По 2 мл препарата в ампулы нейтрального бесцветного стекла.

5 ампул помещают в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и пленки полимерной или без пленки полимерной.

1, 2 контурные ячейковые упаковки помещают в пачку из картона.

В каждую пачку вкладывают инструкцию по применению и скарификатор ампульный.

Скарификатор ампульный не вкладывают при использовании ампул с кольцом излома или с надрезом и точкой.

Условия хранения

В защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в местах, недоступных для детей.

Срок годности

3 года.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Юридическое лицо, на имя которого выдано регистрационное удостоверение

Общество с ограниченной ответственностью «Велфарм» (ООО «Велфарм»), Россия
125362, г. Москва, ул. Водников, д. 2, офис 31

Производитель/Организация, принимающая претензии

Общество с ограниченной ответственностью «Велфарм» (ООО «Велфарм»), Россия
Курганская обл., г. Курган, проспект Конституции, д. 11

Тел./факс: (3522) 48-60-00

e-mail: fsk@velpharm.ru