

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Метоклопрамид

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Метоклопрамид

Международное непатентованное или группировочное наименование: метоклопрамид

Лекарственная форма: раствор для внутривенного и внутримышечного введения

Состав

Одна ампула содержит:

Действующее вещество: метоклопрамида гидрохлорид моногидрат (в пересчете на метоклопрамида гидрохлорид) – 10 мг.

Вспомогательные вещества: натрия хлорид, натрия ацетата тригидрат, натрия сульфит (E221), динатрия эдетат, уксусная кислота ледяная, вода для инъекций.

Описание: прозрачная бесцветная жидкость.

Фармакотерапевтическая группа: средства для лечения функциональных нарушений желудочно-кишечного тракта; стимуляторы моторики желудочно-кишечного тракта.

Код АТХ: A03FA01.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Механизм действия

Противорвотное средство, является специфическим блокатором дофаминовых (D_2) и серотониновых рецепторов. Механизм действия основан как на центральном, так и на периферическом воздействии метоклопрамида. Противорвотное действие связано с блокадой дофаминовых рецепторов головного мозга, что обуславливает повышение порога раздражения рвотного центра.

Фармакодинамические эффекты

Оказывает противорвотное действие, устраняет тошноту и икоту. Снижает двигательную активность пищевода, повышает тонус нижнего сфинктера пищевода, ускоряет опорожнение желудка, а также ускоряет продвижение пищи по тонкой кишке, не вызывая диарею. Нормализует выделение желчи, уменьшает спазм сфинктера Одди, устраняет дискинезию желчного пузыря. Стимулирует секрецию пролактина.

Фармакокинетика

Распределение

Объем распределения составляет 2,2–3,4 л/кг. Легко проникает через гематоэнцефалический барьер.

Биотрансформация

Метаболизируется в печени.

Элиминация

Период полувыведения составляет от 3 до 5 ч, при нарушении функции почек может увеличиться до 14 часов. Выводится почками в течение первых 24 часов в неизменном виде и в виде метаболитов (около 80 % принятой дозы). Выделяется с грудным молоком.

Показания к применению

Препарат Метоклопрамид показан к применению у взрослых в возрасте от 18 лет:

- для профилактики послеоперационной тошноты и рвоты;
- для симптоматического лечения тошноты и рвоты, в том числе при острой мигрени;
- для профилактики тошноты и рвоты, вызванной лучевой терапией и химиотерапией;
- для усиления перистальтики при проведении рентгеноконтрастных исследований желудочно-кишечного тракта.

Препарат Метоклопрамид показан к применению у детей и подростков в возрасте от 1 года до 18 лет:

- в качестве второй линии лечения послеоперационной тошноты и рвоты;
- в качестве второй линии профилактики отсроченной тошноты и рвоты, вызванной химиотерапией;
- для усиления перистальтики при проведении рентгеноконтрастных исследований желудочно-кишечного тракта.

Противопоказания

- Гиперчувствительность 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 (см. раздел «Способ применения и дозы»);
- период грудного вскармливания (см. раздел «Применение при беременности и в период грудного вскармливания»).

С осторожностью

Препарат следует применять с осторожностью 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 (ЦНС); у пациентов с депрессией (в анамнезе); при почечной недостаточности средней и тяжелой степени тяжести (клиренс креатинина (КК) 15–60 мл/мин); при печеночной недостаточности тяжелой степени тяжести; при беременности.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Беременность

Многочисленные данные о применении у беременных женщин (более 1000 описанных случаев) указывают на отсутствие фетотоксичности и способности вызывать пороки

развития у плода. Метоклопрамид можно применять во время беременности (I–II триместры), только если потенциальная польза для матери превышает возможный 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).

Режим дозирования

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.

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

Особые группы пациентов

Лица пожилого возраста

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

Пациенты с почечной недостаточностью

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 (КК 15–60 мл/мин) доза должна быть снижена на 50 %.

Пациенты с печеночной недостаточностью

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

Дети

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

Дети в возрасте от 1 года до 18 лет

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.

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)

Дети в возрасте от 15 до 18 лет

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

Дети в возрасте от 1 года 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 часов.

Максимальный срок лечения для профилактики тошноты и рвоты, вызванных химиотерапией, составляет 5 дней.

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

Дети в возрасте до 1 года

Безопасность и эффективность препарата Метоклопрамид у детей в возрасте до 1 года не установлены. Данные отсутствуют.

Побочное действие

Наиболее часто при применении высоких доз препарата встречались следующие нежелательные реакции: часто – экстрапирамидные нарушения (острая дистония и дискинезия, синдром паркинсонизма, акатизия), нечасто – аллергические реакции, частота неизвестна – злокачественный нейролептический синдром.

Частота нежелательных реакций классифицирована следующим образом: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, но $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$, но $< 1/100$), редко ($\geq 1/10000$, но $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$), частота неизвестна (на основании имеющихся данных оценить невозможно).

Нарушения 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).

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

Эндокринные нарушения:* нечасто – аменорея, гиперпролактинемия; редко – галакторея; частота неизвестна – гинекомастия.

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

Психические нарушения: часто – депрессия; нечасто – галлюцинации; редко – спутанность сознания.

Нарушения со стороны нервной системы: очень часто – сонливость; часто – астения, экстрапирамидные нарушения (особенно у детей и подростков и / или при превышении рекомендованных доз препарата, даже после однократного введения), паркинсонизм, акатизия; нечасто – дистония (включая нарушение зрения и непроизвольное движение глаза – окулогирный криз), 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.

Нарушения 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».

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

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

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

Нарушения со стороны репродуктивной системы и молочных желез: частота неизвестна – сексуальная дисфункция, приапизм.

Дети

Экстрапирамидные симптомы: острая дистония и дискинезия, синдром паркинсонизма, акатизия развивались даже после применения однократной дозы препарата, особенно у детей и подростков (см. раздел «Особые указания»).

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 антихолинергические противопаркинсонические препараты у взрослых).

Требуется симптоматическое лечение и постоянный контроль сердечной и дыхательной функций в зависимости от клинического состояния пациента.

Специфического антидота не существует.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

Противопоказанные комбинации

Противопоказано одновременное применение метоклопрамида с леводопой или агонистами дофаминовых рецепторов в связи с имеющимся взаимным антагонизмом.

Комбинации, которые следует избегать

Алкоголь усиливает седативный эффект метоклопрамида.

Комбинации, требующие соблюдения осторожности

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

М-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.

Метоклопрамид несовместим с инфузионными растворами, имеющими щелочную среду.

Препарат несовместим с цефалотином натрия, хлорамфениколом натрия, бикарбонатом натрия.

Особые указания

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

Длительное лечение метоклопрамидом 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 отмечался нейролептический злокачественный синдром. Необходимо незамедлительно прекратить лечение препаратом Метоклопрамид при появлении симптомов нейролептического злокачественного синдрома и применить соответствующую терапию.

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

При применении препарата Метоклопрамид также могут отмечаться симптомы болезни Паркинсона.

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

Сообщалось о тяжелых сердечно-сосудистых побочных эффектах, включая сосудистую недостаточность, выраженную брадикардию, остановку сердца и удлинение интервала QT. Необходимо соблюдать осторожность при применении препарата Метоклопрамид у пожилых пациентов с сердечными нарушениями (включая удлинение интервала QT), пациентов с нарушением водно-электролитного баланса, брадикардией и у пациентов, принимающих другие 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»).

Дети

Со стороны нервной системы возможны экстрапирамидные нарушения, особенно у детей и подростков и / или при применении высоких доз, развивающиеся, как правило, в начале лечения и после однократного применения. Применение препарата Метоклопрамид 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).

Вспомогательные вещества

Препарат Метоклопрамид содержит натрия сульфит, который может изредка вызывать тяжелые реакции гиперчувствительности и бронхоспазм.

Данный лекарственный препарат содержит менее 1 ммоль (23 мг) натрия на одну ампулу, то есть, по сути, «не содержит натрия».

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

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

Форма выпуска

Раствор для внутривенного и внутримышечного введения, 5 мг/мл.

2 мл в ампулы бесцветного стекла тип I с цветным кольцом разлома или с цветной точкой и насечкой. На ампулы дополнительно наносят одно, два или три цветных кольца или без дополнительных цветных колец.

На каждую ампулу наклеивают самоклеящуюся этикетку.

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

1 или 2 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения

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

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

5 лет. Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Производитель / Фасовщик (первичная упаковка) / Упаковщик (вторичная упаковка)

Российская Федерация

ЗАО «ФармФирма «Сотекс»

Московская обл., г.о. Сергиево-Посадский, п. Беликово, д. 10

Выпускающий контроль качества

Российская Федерация

ЗАО «ФармФирма «Сотекс»

Московская обл., г.о. Сергиево-Посадский, п. Беликово, д. 11

Держатель регистрационного удостоверения / Организация, принимающая претензии потребителей

Российская Федерация

ЗАО «ФармФирма «Сотекс»

141345, Московская обл., г. Сергиев Посад, п. Беликово, д. 11

Тел.: +7 (495) 956-29-30

Электронная почта: pharmacovigilance@sotex.ru