

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Галантамин, 1 мг/мл, раствор для внутривенного и подкожного введения.

Галантамин, 5 мг/мл, раствор для внутривенного и подкожного введения.

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: галантамин.

Галантамин, 1 мг/мл, раствор для внутривенного и подкожного введения

Каждый 1 мл раствора для внутривенного и подкожного введения содержит 1 мг галантамина гидробромида в пересчете на сухое вещество.

Каждая ампула 1 мл содержит 1 мг галантамина гидробромида в пересчете на сухое вещество.

Галантамин, 5 мг/мл, раствор для внутривенного и подкожного введения

Каждый 1 мл раствора для внутривенного и подкожного введения содержит 5 мг галантамина гидробромида в пересчете на сухое вещество.

Каждая ампула 1 мл содержит 5 мг галантамина гидробромида в пересчете на сухое вещество.

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Раствор для внутривенного и подкожного введения.

Бесцветная прозрачная жидкость.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1. Показания к применению

Галантамин применяют у взрослых и детей от 1 года до 18 лет по следующим показаниям:

В неврологии:

- заболевания периферической нервной системы (неврит, полиневрит, полиневропатия);
- состояния, связанные с повреждениями передних рогов спинного мозга (после полиомиелита, миелита, спинальной мышечной атрофии);
- церебральный паралич (остаточные явления перенесенного инсульта, детский церебральный паралич (спастические формы));
- нарушения нервно-мышечного проведения (миастения *gravis*).

В анестезиологии и хирургии:

- в качестве антагониста недеполяризующих миорелаксантов;
- для лечения послеоперационных парезов тонкого кишечника и мочевого пузыря.

В физиотерапии:

– для ионофореза при неврологических заболеваниях периферической нервной системы.

В токсикологии:

– при отравлении ингибиторами холинэстеразы.

4.2. Режим дозирования и способ применения

Режим дозирования

Доза и продолжительность лечения галантамином устанавливаются врачом в зависимости от степени выраженности симптомов заболевания и индивидуальной реакции пациента к проводимому лечению.

В неврологии по заявленным показаниям (см. раздел 4.1., подраздел «В неврологии») галантамин в виде раствора для внутривенного и подкожного введения применяется для краткосрочного лечения в случае невозможности приема препарата внутрь. При первой возможности переходят на прием препарата внутрь.

Взрослым галантамин вводят подкожно обычно в дозе 0,03-0,28 мг/кг.

Лечение начинают с минимальных доз, которые постепенно увеличивают. Начальная доза – 2,5 мг в сутки. При необходимости возможно увеличение суточной дозы каждые 3-4 дня на 2,5 мг до максимальной суточной дозы 20 мг в 2-3 приема в равных дозах. Максимальная разовая доза для взрослых составляет 10 мг, максимальная суточная доза – 20 мг.

Детям галантамин назначают подкожно согласно расчету на кг массы тела в следующих суточных дозах:

от 1 года до 2 лет – 0,25-1,0 мг (0,02-0,08 мг/кг);

старше 3-летнего возраста галантамин назначают в дозе 0,03-0,28 мг/кг или:

от 3 до 5 лет – 0,5-5,0 мг;

от 6 до 8 лет – 0,75-7,5 мг;

от 9 до 11 лет – 1,0-10,0 мг;

от 12 до 15 лет – 1,25-12,5 мг;

старше 15 лет – 1,25-15,0 мг.

В анестезиологии, хирургии и токсикологии галантамин назначают:

– при передозировке периферическими недеполяризующими миорелаксантами внутривенно в дозе 10-20 мг в сутки;

– при послеоперационных парезах желудочно-кишечного тракта и мочевого пузыря подкожно или внутривенно в дозах, согласно возрасту, распределенных на 2-3 введения в сутки.

Взрослым лечение начинают с минимальных доз, которые постепенно увеличивают. Начальная доза – 2,5 мг в сутки. При необходимости возможно увеличение суточной дозы каждые 3-4 дня на 2,5 мг до максимальной суточной дозы 20 мг в 2-3 приема в равных дозах. Максимальная разовая доза для взрослых составляет 10 мг, максимальная суточная доза – 20 мг.

Детям галантамин назначают подкожно согласно расчету на кг массы тела в следующих суточных дозах:

от 1 года до 2 лет – 0,25-1,0 мг (0,03-0,08 мг/кг);

старше 3-летнего возраста галантамин назначают в дозе 0,03-0,28 мг/кг или:

от 3 до 5 лет – 0,5-5,0 мг;

от 6 до 8 лет – 0,75-7,5 мг;

от 9 до 11 лет – 1,0-10,0 мг;

от 12 до 15 лет – 1,25-12,5 мг;

старше 15 лет и взрослые – 1,25-15,0 мг.

В физиотерапии галантамин вводят методом ионофореза в дозе от 2,5 до 5 мг при величине электрического тока от 1 до 2 мА в течение 10 минут на протяжении 10-15 дней.

Особые группы пациентов

Пациенты с нарушением функции печени

У пациентов с умеренным нарушением функции печени (7-9 баллов по шкале Чайлд-Пью) возможно повышение концентрации галантамина в плазме крови, поэтому рекомендуется снизить суточную дозу до 15 мг. У пациентов с тяжелым нарушением функции печени (более 9 баллов по шкале Чайлд-Пью) применение препарата противопоказано.

Пациенты с нарушением функции почек

У пациентов с умеренным нарушением функции почек суточная доза препарата не должна превышать 15 мг. У пациентов с тяжелым нарушением функции почек (клиренс креатинина менее 10 мл/мин) применение препарата противопоказано.

Способ применения

Внутривенно, подкожно.

4.3. Противопоказания

- гиперчувствительность к действующему веществу или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1;
- бронхиальная астма;
- тяжелая сердечная недостаточность (III-IV группа по NYHA);
- брадикардия;
- стенокардия;
- атриовентрикулярная блокада;
- артериальная гипертензия;
- хроническая обструктивная болезнь легких;
- эпилепсия;
- гиперкинезы;
- тяжелые нарушения функции печени (более 9 баллов по шкале Чайлд-Пью);
- механическая кишечная непроходимость;
- почечная недостаточность (клиренс креатинина менее 9 мл/мин);
- механические нарушения проходимости мочевыводящих путей;
- недавно перенесенное оперативное вмешательство на мочевыводящих путях или предстательной железе;

- беременность и период грудного вскармливания (см. раздел 4.6.);
- детский возраст до 1 года.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

Особые указания

Ваготоническое влияние на синоатриальный узел может способствовать возникновению брадикардии и АВ-блокады. Такое действие имеет повышенную значимость для пациентов с наджелудочковыми нарушениями ритма и пациентов, принимающих лекарственные препараты, вызывающие снижение частоты сердечных сокращений. Однако, по результатам пострегистрационных наблюдений, замедление сердечного ритма наблюдалось и у пациентов без заболеваний сердца. Поэтому все пациенты находятся в группе риска по нарушению внутрисердечного проведения.

Холиномиметики могут повышать желудочную секрецию, поэтому необходимо установить наблюдение за пациентами, находящимися в группе риска, на предмет возникновения язвенных поражений желудочно-кишечного тракта, а также желудочно-кишечных кровотечений.

Холиномиметики могут вызывать нарушение оттока мочи.

Галантамин необходимо назначать с осторожностью пациентам с хронической обструктивной болезнью легких. Холиномиметики могут потенцировать эффект нервно-мышечной блокады миорелаксантов деполяризующего типа во время проведения анестезии. Необходимо контролировать вес пациента, так как при терапии галантамином может наблюдаться снижение массы тела. Парасимпатомиметики могут вызывать судороги. Повышенная судорожная активность наблюдалась у пациентов с болезнью Альцгеймера. В редких случаях парасимпатомиметики могут повышать холинергический тонус и вызывать ухудшение симптомов паркинсонизма. Галантамин следует назначать с осторожностью у пациентов с почечной недостаточностью и снижать дозу препарата в соответствии со значением клиренса креатинина.

Лечение необходимо проводить в комплексе с физиотерапевтическими процедурами (массаж, лечебная гимнастика), которые следует начинать через 1-2 часа после введения препарата.

В период лечения галантамином недопустимо применение этанола и седативных лекарственных средств.

С осторожностью

Печеночная и почечная недостаточность, нарушение мочеиспускания, оперативные вмешательства с применением общей анестезии (наркоза).

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Является слабым антагонистом морфина и его структурных аналогов.

Галантамин не только не ослабляет, но напротив, усиливает действие миорелаксантов деполяризующего типа (суксаметония йодида и др.). Одновременное применение ряда антиаритмиков (хинидин), антидепрессантов (пароксетин, флуоксетин, амитриптилин), противогрибковых (кетоконазол), противовирусных (зидовудин), антибактериальных (эритромицин) средств, которые подавляют изоферменты CYP2D6 и CYP3A4 цитохрома P450, участвующие в метаболизме галантамина, может привести к увеличению его концентрации в сыворотке крови, в результате чего может повышаться частота

холинергических побочных эффектов (главным образом тошноты и рвоты). АУС галантамина увеличивается на 30-40 % при одновременном применении его с кетоконазолом и пароксетином, соответственно. При одновременном применении с эритромицином АУС галантамина возрастает на 10 %. Ингибиторы изофермента CYP2D6 (амитриптилин, флуоксетин, флувоксамин, хинидин) снижают клиренс галантамина на 25-33 %. В этом случае, в зависимости от переносимости терапии конкретным пациентом, может понадобиться снижение поддерживающей дозы галантамина.

Между галантамином и м-холиноблокаторами (атропин, гоматропин), ганглиоблокаторами (гексаметония бензолсульфонат, азаметония бромид, пахикарпина гидройодид), недеполяризующими миорелаксантами (тубокурарина хлорид и др.), хинином и прокаинамидом возможен антагонизм. Аминогликозидные антибиотики (гентамицин, амикацин) могут снижать терапевтический эффект галантамина.

При комбинации галантамина с лекарственными средствами, снижающими частоту сердечных сокращений (β -адреноблокаторы, дигоксин) возрастает риск усугубления брадикардии.

Циметидин может повышать биодоступность галантамина.

Галантамин усиливает угнетающее действие на центральную нервную систему этанола и седативных средств.

При одновременном применении галантамина с другими холиномиметиками (такими, как донепизил, неостигмин, пиридостигмин, пилокарпин) может наблюдаться усиление холиномиметического действия, поэтому не рекомендуется их одновременное применение. Галантамин не оказывает влияния на фармакокинетику варфарина.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

Нет достаточных клинических данных по безопасности применения галантамина во время беременности, поэтому применение препарата противопоказано.

Лактация

Данных о секреции галантамина с грудным молоком нет, поэтому применение препарата противопоказано в период кормления грудью.

Фертильность

Экспериментальные данные у животных не показали прямого или косвенного неблагоприятного действия галантамина на течение беременности, эмбриональное, фетальное и постнатальное развитие потомства.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

Во время лечения галантамином необходимо воздерживаться от управления транспортными средствами и занятий другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций, так как применение галантамина может вызывать сонливость, головокружение, нарушение зрения.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме нежелательных реакций

Частота возникновения нежелательных реакций определена в соответствии с классификацией Всемирной организации здравоохранения (ВОЗ): 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).

Наиболее распространенные нежелательные реакции связаны с фармакодинамическими эффектами галантамина и опосредованы никотиновыми и мускариновыми эффектами, характерными для ингибиторов холинэстеразы.

Нарушения метаболизма и питания:

Часто: потеря аппетита, анорексия;

Нечасто: дегидратация.

Психические нарушения:

Часто: галлюцинации, депрессия;

Нечасто: зрительные и слуховые галлюцинации.

Нарушения со стороны нервной системы:

Часто: головокружение, сонливость, обморок, тремор, головная боль, вялость, летаргия;

Нечасто: парестезии, дисгевзия, гиперсомния.

Нарушения со стороны органа зрения:

Нечасто: нарушение зрения.

Нарушения со стороны уха и лабиринта:

Нечасто: шум в ушах.

Нарушения со стороны сердца:

Часто: брадикардия;

Нечасто: суправентрикулярная экстрасистолия, атриовентрикулярная блокада, синусовая брадикардия, ощущение сердцебиения.

Нарушения со стороны сосудов:

Часто: повышение артериального давления;

Нечасто: снижение артериального давления, приливы.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта:

Очень часто: тошнота, рвота;

Часто: боль в животе, диарея, диспепсия, дискомфорт в желудке и кишечнике;

Нечасто: рвота;

Неизвестная частота: усиление перистальтики.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей:

Редко: гепатит.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей:

Часто: повышенная потливость.

Нарушения со стороны скелетно-мышечной и соединительной ткани:

Часто: мышечные спазмы;

Нечасто: мышечная слабость.

Общие расстройства и нарушения в месте введения:

Часто: астения, повышенная утомляемость, слабость;

Частота неизвестна: боли в месте инъекции, возможны местные реакции при парентеральном введении.

Лабораторные и инструментальные данные:

Часто: снижение веса;

Нечасто: повышение активности «печеночных» трансаминаз.

Травмы, интоксикации и осложнения манипуляций:

Часто: падения.

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза – риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств – членов Евразийского экономического союза.

Российская Федерация

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения

Адрес: 109012, г. Москва, Славянская площадь, д. 4, стр. 1

Телефоны: +7 (800) 550-99-03

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»: <https://roszdravnadzor.gov.ru/>

4.9. Передозировка

Симптомы при передозировке галантамином: тошнота, рвота, коликообразные боли (спазмы) в животе, диарея, усиленное слюноотделение, слезотечение, недержание мочи и кала, сильная потливость, снижение артериального давления, удлинение интервала QT, брадикардия, бронхоспазм, мышечная слабость, в более тяжелых случаях – судороги и кома. Выраженная мышечная слабость в сочетании с гиперсекрецией слизистой оболочки трахеи и бронхоспазмом может привести к полной блокаде дыхательных путей.

Лечение: симптоматическая терапия, контроль функции дыхательной и сердечно-сосудистой систем. В качестве антидота можно использовать атропин в дозе 0,5-1,0 мг внутривенно; дозу можно ввести повторно в зависимости от клинической картины.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: Психоаналептики; средства для лечения деменции; антихолинэстеразные средства.

Код АТХ: N06DA04

Механизм действия и фармакодинамические эффекты

Обратимый ингибитор холинэстеразы. Облегчает проведение нервных импульсов в области нервно-мышечных синапсов; усиливает процессы возбуждения в рефлекторных зонах спинного и головного мозга, хорошо проникает через гематоэнцефалический барьер.

Повышает тонус и стимулирует сокращение гладкой и скелетной мускулатуры, секрецию пищеварительных и потовых желез, восстанавливает нервно-мышечную проводимость, блокированную недеполяризирующими миорелаксантами. Вызывает миоз, спазм аккомодации, снижает внутриглазное давление при закрытоугольной глаукоме.

5.2 Фармакокинетические свойства

Абсорбция

Галантамин быстро всасывается после подкожного введения. Терапевтическая концентрация в плазме крови достигается через 30 минут. Не обнаружено статистически значимой разницы величины площади под кривой «концентрация-время» (AUC) после однократного применения дозы 10 мг, введенной внутрь или парентерально. Максимальная концентрация в плазме крови после однократного применения дозы 10 мг, введенной внутрь и парентерально, равна 1,20 мг/мл и достигается в течение 2 часов.

Распределение

Период полураспределения галантамина (10 минут) при парентеральном введении более длительный по сравнению с периодом полураспределения неостигмина метилсульфата и пиридостигмина бромида (0,54-3,5 минуты и соответственно 5,0-6,6 минуты), поэтому он начинает действовать позже других ингибиторов холинэстеразы.

Объем распределения галантамина составляет 175 л, а связывание с белками плазмы не превышает 18 %; около 53 % галантамина находится в форменных элементах крови.

Биотрансформация

Метаболизм не отличается интенсивностью и происходит с участием изоферментов цитохрома P450 (изоферменты CYP2D6 и CYP3A4) в основном путем N- и O-деметилирования (порядка 5-6 % препарата), а также глюкуронирования, N-окисления и эпимеризации. Метаболиты галантамина – эпигалантамин и галантаминон обнаруживаются в плазме и моче.

Элиминация

Период полувыведения у галантамина двухфазный и занимает 7-8 часов. Галантамин на 90-97 % выводится почками (18-22 % в неизменном виде) посредством гломерулярной фильтрации, 2,2-6,3 % – кишечником, около 0,2 % с желчью. Почечный клиренс составляет 65-100 мл/мин (20-25 % от плазменного клиренса), что близко к клиренсу инулина. Установлено, что у пациентов с болезнью Альцгеймера концентрация галантамина в плазме крови на 30-40 % выше, чем у здоровых добровольцев.

Печеночная недостаточность

При печеночной недостаточности средней степени элиминация галантамина замедляется на 25 %.

Почечная недостаточность

При хронической почечной недостаточности средней степени (клиренс креатинина 52-104 мл/мин) его плазменная концентрация увеличивается на 38 %, при тяжелой (клиренс креатинина 9-51 мл/мин) – на 67 %.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Вода для инъекций.

6.2. Несовместимость

Не описано.

6.3. Срок годности (срок хранения)

4 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

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

6.5. Характер и содержание упаковки

По 1 мл в ампулы из нейтрального стекла.

По 5 ампул помещают в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной с фольгой алюминиевой печатной лакированной или бумагой упаковочной с полиэтиленовым покрытием (или без фольги или бумаги).

2 контурные ячейковые упаковки помещают в пачку из картона для потребительской тары.

По 10 ампул помещают в пачку из картона для потребительской тары с вкладышем из бумаги пачечной или со специальными гнездами.

В каждую пачку вкладывают инструкцию по применению, скарификатор ампульный, или скарификатор ампульный прямоугольный, или скарификатор дисковый керамический, или скарификатор ампульный абразивный.

При использовании ампул с насечками, кольцами и точками разлома скарификаторы в пачку не вкладывают.

6.6. Особые меры предосторожности при утилизации использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата, и другие манипуляции с препаратом

Особые требования отсутствуют.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация
Закрытое акционерное общество «ВИФИТЕХ» (ЗАО «ВИФИТЕХ»)
142279, Московская обл., г. Серпухов, п. Оболенск, ГНЦ ПМ
Телефон: +7 (495) 716-15-81, 716-15-90
Адрес электронной почты: vifiteh@mail.ru

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация
Закрытое акционерное общество «ВИФИТЕХ» (ЗАО «ВИФИТЕХ»)
142279, Московская обл., г. Серпухов, п. Оболенск, ГНЦ ПМ
Телефон: +7 (495) 716-15-81, 716-15-90
Адрес электронной почты: vifiteh@mail.ru

8. НОМЕР (НОМЕРА) РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. КАТЕГОРИЯ ОТПУСКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Лекарственный препарат относится к категории отпуска по рецепту.

Общая характеристика лекарственного препарата Галантамин доступна на информационном портале в едином реестре зарегистрированных лекарственных средств Евразийского экономического союза и на официальном сайте уполномоченного органа (экспертной организации) https://lk.regmed.ru/Register/EAEU_SmPC.