

SÚHRN CHARAKTERISTICKÝCH VLASTNOSTÍ LIEKU

1. NÁZOV LIEKU

EPHEDRIN BBP
50 mg/ml injekčný roztok

2. KVALITATÍVNE A KVANTITATÍVNE ZLOŽENIE

Liečivo:

Efedrínium-chlorid 50 mg v 1 ml.

Úplný zoznam pomocných látok, pozri časť 6.1

3. LIEKOVÁ FORMA

injekčný roztok
Číry bezfarebný roztok, takmer bez častíc.

4. KLINICKÉ ÚDAJE

4.1 Terapeutické indikácie

EPHEDRIN BBP sa používa na alergické stavy (astma, alergická rinitída, urtikária, angioneurotické edémy, liekové exantémy) v kombinácii s antihistaminikami.

Obehové: vazomotorický kolaps, sínusová bradykardia (pri sklone k ortostatickým synkopám).

Centrálne: enuresis nocturna, narkolepsia.

4.2 Dávkovanie a spôsob podávania

Efedrín sa musí dávkovať individuálne, podľa obehových parametrov. Nasledujúce údaje majú slúžiť len orientačne ako smernica:

Dávkovanie

Pri kolapsových stavoch sa podáva 25 - 50 mg (0,5 až 1 ml) subkutánne alebo intramuskulárne.

Pri bronchospazme sa podá počiatočná dávka 12,5 - 25 mg, ďalšie dávky podľa reakcie pacienta.

Pri potrebe intravenózneho podania sa dávka 0,4 ml (20 mg) zriedi do 20 ml izotonického roztoku chloridu sodného a podáva sa veľmi pomaly.

Najvyššia jednotlivá dávka pri subkutánnom a intramuskulárnom podaní je 50 mg.

Najvyššia denná dávka pri subkutánnom a intramuskulárnom podaní je 150 mg.

Odporúča sa podať ráno a popoludní, nie večer, pretože môže spôsobiť nespavosť.

Pediatrická populácia

Deťom do 1 roka sa podáva výnimočne subkutánne 5 mg (0,1 ml) alebo intravenózne 2,5 mg (0,05 ml) 1 až 2 krát denne.

Deťom od 1 do 6 rokov sa podáva subkutánne 12,5 mg (0,25 ml) alebo intravenózne 5 mg (0,1 ml) 1 až 2 krát denne.

Deťom od 6 do 15 rokov sa podáva subkutánne 25 mg (0,5 ml) alebo intravenózne 10 mg (0,2 ml) 1 až 2 krát denne.

Spôsob podávania

Liek je určený na intramuskulárnu, subkutánnu a pomalú intravenóznú aplikáciu.

4.3 Kontraindikácie

Precitlivenosť na liečivo alebo na ktorúkoľvek z pomocných látok uvedených v časti 6.1.

Nepoužívajte pri:

- hypersenzitívite na sympatikomimetiká,
- arteriálnej hypertenzii,
- srdcovej nedostatočnosti,
- ischemickej chorobe srdca,
- infarkte myokardu,
- hypertyreóze,
- traumatickom šoku,
- sínusovej tachykardii.

4.4 Osobitné upozornenia a opatrenia pri používaní

Efedrín sa nesmie použiť u hypovolemických pacientov ako monoterapia. Len v absolútne nevyhnutných prípadoch sa môže efedrín podať súčasne s primárnym doplnením objemu alebo na zachovanie koronárnej a cerebrálnej perfúzie pri deplécii objemu. Efedrín aj v najmenších dávkach pôsobí vazokonstrikčne. Pôsobí dráždivo na mozgovú kôru a na subkortikálne centrá. Pri využívaní periférnych účinkov efedrínu je centrálny stimulačný efekt efedrínu často nežiaducim účinkom.

Je potrebné jeho opatrné podávanie u pacientov s diabetes mellitus, aneuryzmou, hypertrofiou prostaty a arteriosklerózou. Vzhľadom na toleranciu, ktorá na efedrín vzniká, sú známe prípady dlhodobého podávania efedrínu v gramových dávkach, po ktorých zvyčajne dochádza k cirkulačným a nervovým poruchám.

Na liek môže vzniknúť lieková závislosť (efedrinizmus) a pri dlhodobom používaní, najmä vyšších dávok, toxické psychózy. Efedrín je zaradený do skupiny prekurzorov omamných a psychotropných látok.

4.5 Liekové a iné interakcie

Najzávažnejšie sú interakcie s inhibítormi MAO a halotanom (arytmie až fibrilácie) a opatrnosť sa vyžaduje aj pri jeho kombinácii s kardioaktívnymi farmakami. Potencuje napríklad účinok digitálistových glykozidov. V kombinácii s kofeínom môže vyvolávať palpitácie. Súčasné použitie vyšších dávok teofylínu a aminofylínu zvyšuje toxicitu efedrínu.

Reserpín a perorálne kontraceptíva efekt efedrínu znižujú. Po aplikácii efedrínu sa môže meniť odpoveď na katecholamíny.

4.6 Fertilita, gravidita a laktácia

Gravidita

V experimentoch na laboratórnych zvieratách bol preukázaný teratogénny potenciál. Poškodenie sa prejavuje špecifickými vývojovými abnormalitami kardiovaskulárneho systému. U ľudí sa doposiaľ tento teratogénny vplyv nedokázal. V dostupných literárnych prameňoch a databázach nie sú informácie o mutagenite efedrínu.

Aj napriek uvedeným poznatkom je potrebná opatrnosť pri podávaní efedrínu gravidným ženám, pretože efedrín prechádza placentárnou bariérou.

Liek sa môže podať iba vtedy, ak po jeho podaní prevýši očakávaný prínos pre matku možné riziko pre plod.

Parenterálne podanie počas pôrodu môže vyvolať fetálnu tachykardiu. Liek sa nesmie podať, ak je krvný tlak matky nad 130/80 mmHg.

Dojčenie

Efedrín prechádza do materského mlieka. Množstvo efedrínu v materskom mlieku dosahuje koncentrácie, ktoré môžu ohroziť dojčiacie dieťa. Ak si zdravotný stav matky vyžaduje podanie efedrínu, je potrebné dojčenie prerušiť.

Fertilita

Účinky na fertilitu nie sú známe.

4.7 Ovplyvnenie schopnosti viesť vozidlá a obsluhovať stroje

Aj keď EPHEDRIN BBP má centrálné stimulačné účinky, tieto sa môžu prejaviť nervovou podráždenosťou, bolesťou hlavy, preto o zapojení sa pacienta do cestnej premávky a obsluhy strojov rozhodne lekár podľa aktuálneho stavu pacienta.

4.8 Nežiaduce účinky

V nasledujúcej tabuľke sú zhrnuté nežiaduce účinky rozdelené do skupín podľa terminológie MedDRA s uvedením frekvencie výskytu: veľmi časté ($\geq 1/10$), časté ($\geq 1/100$ až $< 1/10$), menej časté ($\geq 1/1\,000$ až $< 1/100$), zriedkavé ($\geq 1/10\,000$ až $< 1/1\,000$), veľmi zriedkavé ($< 1/10\,000$), neznáme (z dostupných údajov).

MedDRA triedy orgánových systémov	Frekvencia výskytu	Nežiaduci účinok
Psychické poruchy	časté	paranoidné psychózy, dezilúzie, halucinácie, vznik závislosti
Poruchy nervového systému	časté	ataxia, bolesť hlavy, insomnia, nepokoj
Poruchy srdca a srdcovej činnosti	časté	palpitácie, dysrytmie
Poruchy ciev	časté	hypertenzia
Poruchy gastrointestinálneho traktu	časté	nauzea, dávenie
Poruchy kostrovej a svalovej sústavy a spojivového tkaniva	časté	svalová slabosť, tras
Poruchy obličiek a močových ciest	časté	poruchy močenia
Celkové poruchy a reakcie v mieste podania	časté	kontaktná dermatitída, potenie

Hlásenie podozrení na nežiaduce reakcie

Hlásenie podozrení na nežiaduce reakcie po registrácii lieku je dôležité. Umožňuje priebežné monitorovanie pomeru prínosu a rizika lieku. Od zdravotníckych pracovníkov sa vyžaduje, aby hlásili akékoľvek podozrenia na nežiaduce reakcie na [národné centrum hlásenia uvedené v Prílohe V](#).

4.9 Predávkovanie

Efedrín sa svojimi toxikologickými vlastnosťami radí medzi stredne toxické látky. Akútna otrava efedrínom sa podobá otrave adrenalínom s preťažením kardiovaskulárneho systému.

Experimentálne boli na zvieratách zistené zmeny na myokarde a dystrofické zmeny na tubulárnom systéme obličiek.

Príznaky:

Predávkovanie efedrínom sa prejavuje variabilnou symptomatológiou ako výsledok sympatikomimetického dráždenia kardiovaskulárneho a nervového systému. Dostavuje sa nauzea, dávenie, horúčka, hypertenzia, tachykardia, srdcové arytmie, prekordálna bolesť, palpitácie, respiračná depresia, konvulzie, kóma až zástava srdca. Môže sa vyvinúť hypokaliémia a respiračná alkalóza.

Centrálne účinky zahŕňajú strach, anxiету, nepokoj, tremor, nespavosť, konfúziu, iritabilitu. Objavuje sa paranoidná psychóza, bludy a halucinácie.

Liečba:

Je symptomatická, zameraná na tlmenie centrálnych účinkov neuroleptikami a anxiolytikami. Nutná je úprava ťažkej hypokaliémie a respiračnej alkalózy. Pri monitorovaní kardiovaskulárnych funkcií je možné upraviť tachyarytmiu alebo hypertenziu podávaním alfablokátorov (fentolamín), betablokátorov (propranolol, esmolol), kombinovaných alfa- a betablokátorov (labetalol) alebo nitroprusidu.

5. FARMAKOLOGICKÉ VLASTNOSTI

5.1 Farmakodynamické vlastnosti

Farmakoterapeutická skupina: Antiastmatická, Agonisty adrenergických receptorov alfa a beta
ATC kód: R03CA02

Mechanizmus účinku

Efedrín je prirodzený rastlinný alkaloid s kombinovanými, priamymi aj nepriamymi sympatomimetickými účinkami. Je účinný agonista alfa aj beta adrenergických receptorov a jeho účinok na cieľové orgány je komplexný. Popri priamom účinku na receptory efedrín pôsobí aj nepriamym mechanizmom - uvoľňovaním natívneho noradrenalinu z nervových adrenergických zakončení. Najvýznamnejšie účinky efedrínu sú účinky na srdce, hladké svalstvo ciev a bronchov a účinky na CNS. Pri jeho opakovanom podaní po krátkej dobe sa vyskytuje tachyfyliaxia. Efedrín pôsobí na srdce pozitívne inotropne, slabodromotropne, chronotropne i batmotropne, vyvoláva tachykardiu. Aj v najmenších dávkach pôsobí vazokonstrikčne a v terapeutických dávkach zvyšuje krvný tlak. Ovplyvňuje dýchanie jednak tým, že dráždi dychové centrum, jednak spôsobuje rozšírenie priedušiek. Pôsobí dráždivo na mozgovú kôru a na subkortikálne centrá. Pri využívaní periférnych účinkov efedrínu je centrálny stimulačný efekt efedrínu často nežiaducim účinkom.

V oblasti črevného systému vyvoláva efedrín útlm peristaltiky a ochabnutie svalstva čriev. Doba vyprázdňovania žalúdka ako aj pasáž sa predlžujú. Vyvoláva zvýšenie tonusu sfinkteru močového mechúra, takže u pacientov liečených efedrínom sa môžu objaviť ťažkosti pri močení.

Na oku vyvoláva efedrín rozšírenie zreníc, pričom vnútroočný tlak zostáva neovplyvnený. Efedrín zvyčajne znižuje aktivitu matrice.

5.2 Farmakokinetické vlastnosti

Absorbcia

Efedrín sa dobre a úplne resorbuje z gastrointestinálneho traktu, z podkožia i svalu.

Distribúcia

Rýchlo sa distribuuje hlavne do pečene, pľúc, obličiek, sleziny a mozgu. Za terapeutickú hladinu v sére sa považujú hodnoty 0,04 - 0,08 mg/ml.

Biologický polčas je 3 až 6 hodín. Efedrín je rezistentný voči pôsobeniu monoaminoxidázy a prevažne sa vylučuje v nezmenenej forme močom (60 až 80 %).

Biotransformácia

Časť efedrínu (5 %) sa metabolizuje deamináciou a N-demetyláciou. Hlavný metabolit norefedrín je farmakologicky aktívny, má centrálny stimulačný účinok a jeho biologický polčas je 1,5 - 4 hodiny.

Eliminácia

95 % z podanej dávky sa vylúči z organizmu za 24 hodín.

Eliminácia efedrínu a biologický polčas sa v zodpovedajúcej miere skracujú ak má moč kyslé pH. Pri chorobách obličiek je eliminácia spomalená.

6. FARMACEUTICKÉ INFORMÁCIE

6.1 Zoznam pomocných látok

voda na injekciu
hydroxid sodný

6.2 Inkompatibility

EPHEDRIN BBP je inkompatibilný v roztoku s hydrokortizónom a niektorými barbiturátmi.

6.3 Čas použiteľnosti

5 rokov

6.4 Špeciálne upozornenia na uchovávanie

Uchovávajúte pri teplote do 25 °C. Uchovávajúte v pôvodnom obale na ochranu pred svetlom.

6.5 Druh obalu a obsah balenia

Ampula z bezfarebného skla s etiketou, výlisok z PVC, papierová škatuľka, písomná informácia pre používateľa.

Veľkosť balenia:

10 sklenených ampúl po 1 ml.

6.6 Špeciálne opatrenia na likvidáciu a iné zaobchádzanie s liekom

Žiadne zvláštne požiadavky.

Roztok použite bezprostredne po otvorení obalu.

Všetok nepoužitý liek alebo odpad vzniknutý z lieku sa má zlikvidovať v súlade s národnými požiadavkami.

7. DRŽITEĽ ROZHODNUTIA O REGISTRÁCII

BB Pharma a.s.
Durychova 101/66
142 00 Praha 4 - Lhotka
Česká republika

8. REGISTRAČNÉ ČÍSLO

78/0765/92-S

9. DÁTUM PRVEJ REGISTRÁCIE/PREDĹŽENIA REGISTRÁCIE

Dátum prvej registrácie: 14.12.1992

Dátum posledného predĺženia registrácie: 19.06.2003

10. DÁTUM REVÍZIE TEXTU

05/2023