

SÚHRN CHARAKTERISTICKÝCH VLASTNOSTÍ LIEKU

1. NÁZOV LIEKU

QUAMATEL

20 mg prášok a rozpúšťadlo na injekčný roztok

2. KVALITATÍVNE A KVANTITATÍVNE ZLOŽENIE

Každá liekovka obsahuje 20,0 mg famotidínu.

Pomocné látky so známym účinkom:

Každý ml injekčného roztoku obsahuje približne 3,5 mg sodíka.

Úplný zoznam pomocných látok, pozri časť 6.1.

3. LIEKOVÁ FORMA

Prášok a rozpúšťadlo na injekčný roztok.

Prášok na injekčný roztok: biely, sterilný lyofilizát.

Rozpúšťadlo na injekčný roztok: číry, bezfarebný, sterilný roztok.

4. KLINICKÉ ÚDAJE

4.1 Terapeutické indikácie

QUAMATEL injekcie sú indikované pri: dvanástnikových a benígnych žalúdočných vredoch, gastroezofageálnom refluxe a iných hypersekrečných stavoch (napr. Zollingerov-Ellisonov syndróm). Prevencia relapsu symptómov a erózií alebo ulcerácií, spojených s gastroezofageálnou refluxnou chorobou. Prevencia aspirácie kyseliny pri celkovej anestézii (Mendelsonov syndróm).

4.2 Dávkovanie a spôsob podávania

Dávkovanie

QUAMATEL injekcie sa odporúčajú pre použitie v nemocniciach, iba vo vážnych prípadoch, alebo ak nie je pacient schopný užívať lieky perorálne. QUAMATEL injekcie sa má podávať do zavedenia perorálnej liečby.

Zvyčajná dávka je 20 mg intravenózne dvakrát denne (každých 12 hodín).

Zollingerov-Ellisonov syndróm

Začiatková dávka je 20 mg intravenózne, každých 6 hodín. Ďalšie dávkovanie závisí od množstva vylúčenej kyseliny a od klinického stavu pacienta.

Prevencia aspirácie kyseliny pri celkovej anestézii

20 mg intravenózne ráno v deň chirurgického zákroku alebo najneskôr 2 hodiny pred začatím operácie.

Jednorazová intravenózna dávka nemôže byť vyššia ako 20 mg.

Renálna insuficiencia

Nakoľko sa QUAMATEL vylučuje prednostne obličkami, pacientov so závažnou poruchou funkcie obličiek je potrebné pozorne sledovať. V prípade poklesu klírensu kreatinínu pod 30 ml/min sa majú dávky znížiť na 20 mg večer alebo sa majú intervaly medzi dávkami predĺžiť na 36 až 48 hodín.

Pediatrická populácia

Bezpečnosť a účinnosť u detí nebola stanovená.

Starší pacienti

Na základe veku nie je potrebná úprava dávkovania.

Spôsob podávania

QUAMATEL injekcie sú určené iba na intravenózne podanie.

V prípade intravenózneho podania sa má obsah liekovky rozpustiť v 5-10 ml 0,9 % roztoku chloridu sodného (rozpúšťadlo v ampulke), potom pomaly podať (najmenej počas 2 minút). Pri podávaní v infúzii sa má obsah liekovky rozpustiť v 100 ml 5 % roztoku glukózy a podávať počas 15-30 minút. Roztoky sa majú pripravovať bezprostredne pred podaním. Môžu sa podávať iba číre, bezfarebné roztoky. Rozpustená injekcia je pri izbovej teplote stabilná počas 24 hodín.

4.3 Kontraindikácie

Precitlivenosť na liečivo alebo ktorúkoľvek z pomocných látok uvedených v časti 6.1.
Pre nedostatok skúseností je kontraindikovaný u detí.

4.4 Osobitné upozornenia a opatrenia pri používaní

Pred začatím liečby famotidínom je potrebné vylúčiť prítomnosť malignity.

Nakoľko u tejto triedy liekov bola hlásená skrížená citlivosť, je potrebné zvážiť podávanie lieku QUAMATEL pacientom s precitlivenosťou na iné blokátory H₂-receptorov v anamnéze.

Tento liek obsahuje 0,8 mmol (18 mg) sodíka v jednej dávke (5 ml), t.j. v podstate zanedbateľné množstvo sodíka.

V prípade 10 ml injekcie tento liek obsahuje 36 mg sodíka, čo zodpovedá 1,8 % WHO odporúčaného maximálneho denného príjmu 2 g sodíka pre dospelú osobu.

4.5 Liekové a iné interakcie

Famotidín neovplyvňuje enzymatický systém pečeneového cytochrómu P-450. Navyše klinické štúdie ukázali, že famotidín nezosilňuje účinok warfarínu, teofylínu, fenytoínu, diazepam, propranololu, aminopyrínu a antipyrínu, ktoré tento systém inaktivujú.

U pacientov podstupujúcich hemodialýzu existuje riziko straty účinnosti uhličitanu vápenatého pri jeho súbežnom podávaní ako viazača fosfátov s famotidínom.

4.6 Fertilita, gravidita a laktácia

Gravidita

Famotidín prestupuje cez placentu. U ľudí neboli vykonané adekvátne a dobre kontrolované štúdie. Štúdie na potkanoch a králikoch s perorálnymi dávkami do 2000 resp. 500 mg/kg a deň nepreukázali nežiaduce účinky famotidínu na plod.

Neodporúča sa podávanie lieku QUAMATEL v tehotenstve a má byť predpísaný, iba ak je to jednoznačne nevyhnutné. Skôr, ako lekár prijme rozhodnutie podávať QUAMATEL počas tehotenstva, má zvážiť potenciálne prínosy lieku proti možným súvisiacim rizikám.

Dojčenie

Famotidín prechádza do materského mlieka. Preto je potrebné prijať rozhodnutie, či prerušiť dojčenie alebo liečbu, a pritom vziať do úvahy potrebu lieku pre matku.

Fertilita

Štúdie na potkanoch a králikoch s perorálnymi dávkami do 2000 resp. 500 mg na kg telesnej hmotnosti (mg/kg) a deň nepreukázali poškodenie fertility famotidínom. U gravidných žien však nie sú adekvátne alebo dobre kontrolované štúdie.

4.7 Ovplynenie schopnosti viesť vozidlá a obsluhovať stroje

O vplyve famotidínu na schopnosť viesť vozidlá a obsluhovať stroje nie sú dostupné žiadne údaje.

4.8 Nežiaduce účinky

Od uvedenia famotidínu na trh boli hlásené nasledujúce nežiaduce účinky. V mnohých prípadoch však nebola stanovená príčinná súvislosť s liečbou famotidínom.

MedDRA trieda systémových orgánov/frekvencia	Menej časté (≥ 1/1 000 až < 1/100)	Zriedkavé (≥ 1/10 000 až < 1/1 000)	Veľmi zriedkavé (< 1/10 000)
Poruchy krvi a lymfatického systému			agranulocytóza, leukopénia, pancytopenia, trombocytopenia
Poruchy imunitného systému			anafylaxia
Poruchy metabolizmu a výživy			anorexia
Psychické poruchy			depresia, halucinácie, agitovanosť, úzkosť, zmätenosť
Poruchy nervového systému		bolesť hlavy, závrat	
Poruchy srdca a srdcovej činnosti			arytmia, atrioventrikulárny blok
Poruchy dýchacích ciest, hrudníka a mediastína			bronchospazmus
Poruchy gastrointestinálneho traktu	flatulencia	hnačka, zápcha	brušná nevoľnosť, nauzea, vracanie, sucho v ústach
Poruchy pečene a žlčových ciest			cholestatická žltáčka
Poruchy kože a podkožného tkaniva			akné, alopecia, angioedém, suchá koža, toxická epidermálna nekrolýza, žihľavka, svrbenie
Poruchy kostrovej a svalovej sústavy a spojivového tkaniva			artralgia, svalové kŕče
Poruchy reprodukčného systému a prsníkov			gynekomastia*
Celkové poruchy a reakcie v mieste podania			únava, mierna horúčka
Laboratórne a funkčné vyšetrenia			abnormality pečeňových enzýmov

* Gynekomastia, vyskytujúca sa veľmi zriedkavo je po ukončení liečby reverzibilná.

- V mieste injekcie môže dôjsť k prechodnému podráždeniu.

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

V súčasnosti nie sú skúsenosti s dobrovoľným predávkovaním. Pacientom s patologickým hypersekrečným stavom boli počas viac ako jedného roka podávané dávky až do 800 mg/deň bez závažných nežiaducich účinkov.

Liečba predávkovania: symptomatická a podporná liečba, pacienta je potrebné sledovať.

5. FARMAKOLOGICKÉ VLASTNOSTI

5.1 Farmakodynamické vlastnosti

Farmakoterapeutická skupina: Liečivá pri poruchách acidity, liečivá na žalúdočný vred a refluxnú chorobu pažeráka (GORD)

ATC kód: A02BA03

Mechanizmus účinku

Famotidín je silný, kompetitívny inhibítor histamínových H₂-receptorov. Primárna klinicky dôležitá farmakologická aktivita lieku QUAMATEL je inhibícia žalúdočnej sekrécie. Famotidín potláča ako koncentráciu kyseliny, tak objem žalúdočnej sekrécie, pokým zmeny v sekrécii pepsínu zodpovedajú vylúčenému objemu.

U normálnych dobrovoľníkov a hypersekrétorov inhiboval famotidín bazálnu a nočnú sekréciu stimulovanú pentagastrínom, betazolom, kofeínom, inzulínom a fyziologickým vágovým reflexom. Inhibičný účinok famotidínu na sekréciu žalúdočnej kyseliny je známy ako silnejší, než účinok cimetidínu. Inhibícia sekrécie dávkami 20 a 40 mg pretrvávala 10 až 12 hodín.

Jednorazová večerná perorálna dávka 20 a 40 mg inhibovala bazálnu a nočnú sekréciu kyseliny. Nočná sekrécia žalúdočnej kyseliny bola potlačená o 86-94 % počas najmenej 10 hodín. Rovnaké dávky, podané ráno potlačili potravou stimulovanú sekréciu kyseliny, a toto potlačenie bolo o 76-84 % po 3-5 hodinách po podaní, a 25-30 % po 8-10 hodinách po podaní.

Famotidín má malý alebo nemá žiadny vplyv na sérové hladiny gastrínu v stave nalačno alebo pri sýtosti. Famotidín neovplyvňuje vyprázdňovanie žalúdka, exokrinnú funkciu pankreasu a hepatálny a portálny prietok krvi.

Famotidín neovplyvňuje pečeňový enzymatický systém cytochrómu P-450.

Vo farmakologických štúdiách nebol zaznamenaný systémový účinok famotidínu na CNS, kardiovaskulárny, respiračný alebo endokrinný systém. Taktiež neboli pozorované žiadne antiandrogénne účinky. Liečba famotidínom neovplyvnila sérové hladiny hormónov (vrátane prolaktínu, kortizolu, tyroxínu, testosterónu).

Po intravenóznom podaní sa maximálny účinok dosiahol do 30 minút. Jednotlivé intravenózne dávky 10 a 20 mg inhibovali nočnú sekréciu počas 10 až 12 hodín.

5.2 Farmakokinetické vlastnosti

Famotidín podlieha lineárnej kinetike.

Absorpcia

QUAMATEL injekcie sú výlučne na intravenózne podanie.

Distribúcia

Po intravenóznom podaní sa maximálny účinok dosiahne do 30 minút.

Väzba na bielkoviny plazmy je relatívne nízka, 15-20 %, ako stanovila rovnovážna dialýza. Plazmatický polčas: 2,3-3,5 hodín. U pacientov so závažnou poruchou funkcie obličiek (klírens kreatinínu menej ako 10 ml/min) môže vylučovací polčas lieku QUAMATEL presiahnuť 20 hodín (pozri časť 4.2).

Biotransformácia

Metabolizmus liečiva prebieha v pečeni. Jediný metabolit identifikovaný u človeka je sulfoxid.

Eliminácia

QUAMATEL sa vylučuje obličkami (65-70 %) a metabolicky (30-35 %). Obličkový klírens je 250-450 ml/min, čo naznačuje isté tubulárne vylučovanie. 25-30 % perorálnej a 65-70 % intravenózne dávky sa objavuje v nezmenenej podobe v moči. Malé množstvo látky môže byť vylúčené ako sulfoxid.

5.3 Predklinické údaje o bezpečnosti

Štúdie akútnej toxicity:

U potkanov: perorálna LD₅₀ lieku QUAMATEL u potkanov je vyššia ako 8 000 mg/kg.

U myši: intraperitoneálna LD₅₀ u myši je približne 800 mg/kg alebo viac (723-921 mg/kg).

U psov: zistilo sa, že po podaní lieku QUAMATEL v jedinej perorálnej dávke 2 000 mg/kg sa nedajú pozorovať patologické zmeny a odchýlky v hmotnosti orgánov, spojené s liečbou. Počas štúdie akútnej toxicity nezahynul ani jeden z 12 psov. Počas štúdie akútnej toxicity a počas 7 dní obdobia zotavovania po liečbe sa u žiadneho z 12 zvierat nevyskytli zmeny.

Štúdie subakútnej a chronickej toxicity:

Počas 13 týždňov boli psom podávané perorálne dávky 50, 150, 500 alebo 1 000 mg/kg/deň.

U skupiny liečenej dávkou 1 000 mg/kg/deň boli pozorované iba minimálne zmeny (mierny úbytok telesnej hmotnosti, mierne zvýšenie sérového albumínu, zníženie beta-globulínu a mierne zvýšenie bielkovín v moči). V skupinách s nižším dávkovaním sa famotidín dobre znášal.

Počas 1 mesiaca boli psom perorálne podávané dávky 2 000 mg/kg/deň alebo 2 000 mg/kg/12 hodín. V žiadnej skupine neboli pozorované zmeny.

V 106 týždňovej štúdii na potkanoch a 92 týždňovej štúdii na myšiach pri dávkovaní do 2.000 mg/kg/deň perorálne (približne 2500-násobok odporúčanej dávky pre ľudí s aktívnym dvanástnikovým vredom) neboli dôkazy o karcinogénnom potenciáli famotidínu.

Famotidín bol v mutagénnom teste (Amesov test), používajúcom *Salmonella typhimurium* a *Escherichia coli* s aktiváciou potkaních pečenejých enzýmov pri koncentráciách do 10 000 µg/plaťňu negatívny. V *in vivo* štúdiách na myšiach s mikronukleovým testom a testom chromozómových aberácií neboli pozorované dôkazy o mutagénnom účinku.

V štúdiách na potkanoch neovplyvnili perorálne dávky do 2 000 mg/kg/deň alebo intravenózne dávky 200 mg/kg/deň plodnosť a reprodukčný výkon.

6. FARMACEUTICKÉ INFORMÁCIE

6.1 Zoznam pomocných látok

Prášok na injekčný roztok

kyselina asparagová
manitol

Rozpúšťadlo na injekčný roztok

chlorid sodný
voda na injekciu

6.2 Inkompatibility

Liečivo:

Rozkladá sa v silne kyslom prostredí. Citlivé na medené nečistoty.

6.3 Čas použiteľnosti

3 roky.

6.4 Špeciálne upozornenia na uchovávanie

Uchovávať v chladničke (2°C – 8°C). Uchovávať v pôvodnom obale na ochranu pred svetlom.

Po rekonštitúcii je injekcia stabilná pri teplote 25 °C počas 24 hodín.

6.5 Druh obalu a obsah balenia

Liekovka: bezfarebná injekčná liekovka s prírubou, sklo hydrolytickej skupiny I (PhEur., USP 23, DIN 52339) s prepichovacou gumenou zátkou na lyofilizované prípravky a kombinovaným pertľovým uzáverom.

Ampulka s rozpúšťadlom: 5 ml bezfarebná ampulka.

Veľkosť balenia: 5 liekoviek + 5 ampuliek s rozpúšťadlom (5 ml) v skladanej kartónovej škatuli.

6.6 Špeciálne opatrenia na likvidáciu a iné zaobchádzanie s liekom

Žiadne zvláštne požiadavky.

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

7. DRŽITEĽ ROZHODNUTIA O REGISTRÁCII

Gedeon Richter Plc.

Gyömrői út 19-21

1103 Budapešť

Maďarsko

8. REGISTRAČNÉ ČÍSLO

09/0133/95-S

9. DÁTUM PRVEJ REGISTRÁCIE/PREDĹŽENIA REGISTRÁCIE

Dátum prvej registrácie: 10. marca 1995

Dátum posledného predĺženia registrácie: 27. júla 2005

10. DÁTUM REVÍZIE TEXTU

02/2023