

1. A GYÓGYSZERKÉSZÍTMÉNY MEGNEVEZÉSE

Mestinon 60 mg draszté

2. MINŐSÉGI ÉS MENNYISÉGI ÖSSZETÉTEL

60 mg piridosztigmin-bromid draszténként.

3. GYÓGYSZERFORMA

Draszté: halvány narancs színű, kerek, domború felületű, cukor-bevonatú tabletta. Törési felülete: csaknem fehér színű.

4. KLINIKAI JELLEMZŐK

4.1 Terápiás javallatok

Bélatonia;

- Atoniás székrekedés;
- Myasthenia gravis pseudoparalytica.

4.2 Adagolás és alkalmazás módja

Felnőttek szokásos adagja:

Bélatonia, atoniás obstipatio: 4 óránként 60 mg (1 draszté).

Myasthenia gravis pseudoparalytica: 60-180 mg (1-3 draszté) 2-4-szer naponta; esetenként magasabb adagot is lehet adni.

Teljes hatása a bevételtől számított 15-30 perc múlva fejlődik ki. Egy adag hatása nappal kb. 4 órán át tart, míg éjszaka a csekély fizikai aktivitás miatt kb. 6 órás időtartam várható. Célszerű az adagolást úgy elosztani, hogy a hatás maximuma a legnagyobb fizikai igénybevétel idejével essen egy időbe. Centrális és perifériás paresis (próbaképpen): 60-360 mg naponta, az eset súlyosságának megfelelően.

Gyermekkor:

6 éves kor alatt a kezdő adag fél tabletta (30 mg), 6-12 éves kor között 1 tabletta (60 mg).

A dóziszemelés lépcsőzetesen, napi 15-30 mg-mal javasolt, a szükséges fenntartó adagot eléréséig.

A napi teljes adag 30-360 mg között van.

Neonatalis myasthenia esetében elsősorban neosztigmin javasolt. Piridosztigmint csak akkor kell adni, ha a neosztigmin az erős kolinerg mellékhatások miatt nem alkalmazható. Ilyenkor a javasolt dózis 5-10 mg az étkezések előtt 30-60 perccel.

4.3 Ellenjavallatok

- Ismert túlérzékenység a készítmény hatóanyagával vagy egyéb összetevőivel (lásd 6.1) szemben;
- Mechanikus ileus;
- A vizelet-elvezető rendszer mechanikus elzáródása;
- Peritonitis;
- Depolarizáló típusú izomrelaxansok (pl. szuxametonium) szedése.

4.4 Különleges figyelmeztetések és az alkalmazással kapcsolatos óvintézkedések

- Alkalmazása különös elővigyázatosságot igényel az alábbi állapotok, illetve betegségek fennállása esetén: bradycardia; asthma bronchiale; újabb keletű coronaria elzáródás; hypotensio; vagotonia; fekélybetegség; epilepsia; parkinsonismus; diabetes mellitus; a közelmúltban végrehajtott gyomor-, bél-, valamint húgyhólyagműtét.
- Beszűkült vesefunkció esetén alacsonyabb adagok elegendőek lehetnek.

- Nincs bizonyíték arra, hogy a Mestinon idősekben speciális hatásokkal rendelkezik, azonban az idősök érzékenyebbek a dysrhythmia szempontjából, mint a fiatal felnőttek.

Ritkán előforduló, örökletes fruktóz intoleranciában, glükóz-galaktóz malabszorbcióban vagy szacharáz-izomaltáz hiányban a készítmény nem szedhető.

4.5 Gyógyszerkölsönhatások és egyéb interakciók

- Kurare típusú, nem-depolarizáló izomrelaxánsok hatását a piridosztigmin antagonizálja;
- Morfin- és barbiturát-származékok hatását a piridosztigmin erősítheti;
- A piridosztigmin kolinerg hatásait (különösen a bradycardiát és a hypersecretiót) az atropin antagonizálja.

4.6 Terhesség és szoptatás

Terhességben biztonságos alkalmazása nem bizonyított. Állatkísérletek alapján teratogén hatást nem sikerült kimutatni, de hasonló, emberen szerzett tapasztalat nincs. Ezért csak szigorú indikáció alapján, szoros orvosi felügyelet mellett, az előny/kockázat mérlegelése mellett adható terhes nőnek. Nem zárható ki, hogy a piridosztigmin átjut az anyatejbe, ezért, ha a szoptató anya piridosztigmin kezelésre szorul, a gyermeket el kell választani.

4.7 A készítmény hatásai a gépjárművezetéshez és gépek üzemeltetéséhez szükséges képességekre

Alkalmazásának és a pszichomotoros teljesítményt befolyásoló hatásának időtartama alatt tilos gépjárművet vezetni, gépeket üzemeltetni, vagy baleseti veszéllyel járó munkát végezni.

4.8 Nemkívánatos hatások, mellékhatások

Mint minden kolinerg hatású gyógyszer a Mestinon is befolyásolhatja a vegetatív idegrendszert

Muszkarin-szerű hatások: hányinger, hányás, hasmenés, hasi görcsök, fokozott perisztaltika, fokozott nyáleválasztás, könnyelválasztás, veritékezés, bradycardia, myosis.

Nikotinszerű hatások: izomgörcsök, izomköteg-rángás, izomgyengeség.

A nemkívánatos hatások értékelése az alábbi gyakorisági kategóriákon alapul:

Nagyon gyakori:	($\geq 1/10$)
Gyakori:	($\geq 1/100$, $< 1/10$)
Nem gyakori:	($\geq 1/1\ 000$, $< 1/100$)
Ritka:	($\geq 1/10\ 000$, $< 1/1\ 000$)
Nagyon ritka:	($< 1/10\ 000$)

Nem ismert (a rendelkezésre álló adatokból nem állapítható meg).

Szembetegségek és szemészeti tünetek

Nem ismert: miosis, fokozott könnyelválasztás, a szem alkalmazkodó képességének zavara

Szívbetegségek és a szívvel kapcsolatos tünetek

Nem ismert: aritmia (bradycardia, tachycardia, AV blokk) syncope hipertónia

Légzőrendszeri, mellkasi és mediastinalis betegségek és tünetek

Nem ismert: bronchus szűkülettel járó fokozott bronchiális szekréció

Emésztőrendszeri betegségek és tünetek *Nem ismert:* hányinger, hányás, hasmenés, hasi görcsök, fokozott perisztaltika, fokozott nyáleválasztás

A bőr és a bőralatti szövet betegségei és tünetei

Ritka: bőrküütés, (A kezelés megszüntetése után spontán eltűnik. Ilyen esetben sem Mestinont, sem más bróm-tartalmú gyógyszert nem szedhet a beteg a továbbiakban.)

Nem ismert: hypehidrosis

A csont- és izomrendszer, valamint a kötőszövet betegségei és tünetei

Nem ismert: izomköteg-rángás, tremor, izomgörcsök, izomgyengeség.

Vese és húgyúti betegségek és tünetek

Nem ismert: sürgető vizeletelési inger

A fenti tünetek a kolinerg krízis jelei is lehetnek, ezért a betegnek azonnal értesíteni kell orvosát a diagnózis tisztázása érdekében.

4.9 Túladagolás

Tünetek: Kolinerg krízis, növekvő izomgyengeség, ami a légzőizmokra terjedve halálhoz vezethet; bradycardia, esetleg paradox módon tachycardia.

Kezelés: a Mestinon adását azonnal fel kell függeszteni és 1-2 mg atropint kell adni lassan, intravénásan. A pulzusszám változása szerint ezt az adagot 2-4 óra múlva meg lehet ismételni.

5. FARMAKOLÓGIAI TULAJDONSÁGOK**5.1 Farmakodinámiás tulajdonságok**

Farmakoterápiás csoport: Paraszimpatomimetikumok: antikolinészterázok

ATC: N07A A02

A piridosztigmin, a Mestinon hatóanyaga, egy kolineszteráz bénító molekula. Kolinerg hatása lassan fejlődik ki, viszonylag hosszú hatástartammal és lassú kiürüléssel jellemezhető.

A piridosztigmin és a nem depolarizáló típusú izomrelaxánsok között antagonistá hatás, a piridosztigmin és a depolarizáló típusú izomrelaxánsok között szinergista hatás áll fenn.

5.2 Farmakokinetikai tulajdonságok

A béltraktusból rosszul szívódik fel, biohasznosulása orális alkalmazás esetén 3-8%.

A maximális plazmakoncentráció 120 mg piridosztigmin bevitelétől számított 1,5-2 óra múlva alakul ki. Táplálékfelvétel a felszívódás idejét megnyújtja. Átlagos megoszlási térfogata 1,4 l/ttkg.

Plazmafehérjékhez nem kötődik számottevően és nem jut át a vér-agy gáton. Myasthenia gravisban a terápiás hatás kifejtéséhez 20-60 ng/ml plazmakoncentráció szükséges. Metabolitjai közül csak a 3-hidroxi-N-metilpirimidint azonosították.

Átlagos felezési ideje 1,5 óra, de ez egyes esetekben háromszorosára is megnyúlhat.

Plazma clearance-e egészséges emberben 0,36-0,65 l/ttkg/óra. Kiválasztása a vesén keresztül nagyrészt (75-81%) változatlan formában történik. Egy része (18-21%) 3-hidroxi-metilpirimidin, kis része (1-4%) pedig nem identifikált formában ürül.

A vesefunkció beszűkülése az eliminációs időt akár a négyszeresére is növelheti, a plazma clearance akár ötödére is csökkenhet.

Májbetegség nem gyakorol értékelhető hatást a piridosztigmin metabolizmusára.

5.3 A preklinikai biztonságossági vizsgálatok eredményei

A szokásos farmakológiai biztonságossági, akut és krónikus toxicitási valamint genotoxicitási preklinikai vizsgálatok alapján emberre jelent különös veszélyt. Nyulakon és patkányokon végzett reprodukciós vizsgálatokban nem volt teratogén, de anyai toxicitást előidéző dózisban embryo- és foetotoxicitást mutatott az alábbi tünetekkel: fokozott reszorpció, kevesebb és kisebb súlyú utódok valamint enyhén késleltetett csontosodás.

Karcinogénitási vizsgálatokat a piridosztigmin-bromiddal nem végeztek.

6. GYÓGYSZERÉSZETI JELLEMZŐK**6.1 Segédanyagok felsorolása**

Magnézium-sztearát, talkum, hidegen duzzadó burgonyakeményítő, povidon K30, kukoricakeményítő, vízmentes kolloid szilícium-dioxid (Aerosil 200).

Bevonat: sárga vas-oxid, vörös vas-oxid, hígán folyó paraffin, kemény paraffin, porlasztva szárított arabmézga, rizskeményítő, szacharóz.

6.2 Inkompatibilitások

Nem értelmezhető.

6.3 Felhasználhatósági időtartam

5 év.

6.4 Különleges tárolási előírások

Legfeljebb 30 °C-on tárolandó.

6.5 Csomagolás típusa és kiszerelése

20 db, illetve 150 db. drázsé fehér színű HDPE, garanciazáras biztonsági zárógyűrűvel és LDPE mozgáscsillapító betéttel ellátott kupakkal lezárt, barna színű üvegben, dobozban.

6.6 A készítmény felhasználására, kezelésére vonatkozó útmutatások

Megjegyzés ✘ (egy kereszt)

Osztályozás: **II. csoport**

Kizárólag orvosi rendelvényhez kötött gyógyszer (V).

7. A FORGALOMBA HOZATALI ENGEDÉLY JOGOSULTJA

Meda Pharma Hungary Kft
1139 Budapest Váci út 91.

8. A FORGALOMBA HOZATALI ENGEDÉLY SZÁMA

OGYI-T-517/01 20 db
OGYI-T-517/02 150 db

9. A FORGALOMBA HOZATALI ENGEDÉLY ELSŐ KIADÁSÁNAK/ MEGÚJÍTÁSÁNAK DÁTUMA

2003.12.30./2011. december 06.

10. A SZÖVEG ELLENŐRZÉSÉNEK DÁTUMA

2011.12.06.