

SÚHRN CHARAKTERISTICKÝCH VLASTNOSTÍ LIEKU

1. NÁZOV LIEKU

MEGESIN 160 mg
tablety

2. KVALITATÍVNE A KVANTITATÍVNE ZLOŽENIE

Jedna tableta obsahuje 160 mg megestrolacetátu.

Pomocná látka so známym účinkom: 180 mg monohydrátu laktózy v jednej tablete.

Úplný zoznam pomocných látok, pozri časť 6.1.

3. LIEKOVÁ FORMA

Tableta

Biele, okrúhle, neobalené tablety.

4. KLINICKÉ ÚDAJE

4.1 Terapeutické indikácie

Megesin je indikovaný na paliatívnu liečbu pokročilých karcinómov prsníka a endometria (t.j. na liečbu recidivujúcich, inoperabilných a metastázujúcich foriem uvedených ochorení).

Megesin je ďalej indikovaný na liečbu anorexie alebo straty hmotnosti pri zhubných nádoroch alebo AIDS u mužov aj žien.

4.2 Dávkovanie a spôsob podávania

Dávkovanie

Príslušné dávkovanie u každého pacienta určí vždy individuálne lekár, často v kombinácii s ďalšími liekmi.

Pre každú z nasledovných indikácií je na zistenie efektívnosti terapie Megesinom potrebné minimálne 2 mesačné kontinuálne podávanie lieku v nasledovných dávkach:

Karcinóm prsníka: 160 mg/deň (jednorazovo alebo v rozdelených dávkach).

Karcinóm endometria: 40-320 mg/deň (jednorazovo alebo v rozdelených dávkach).

Anorexia alebo strata hmotnosti: 400-800 mg/deň (jednorazovo alebo v rozdelených dávkach).

Pacientov liečených pre recidivujúci alebo metastázujúci karcinóm je potrebné starostlivo monitorovať.

Pediatrická populácia

Megesin sa neodporúča používať u detí.

Starší pacienti

Podávanie Megesinu starším pacientom si nevyžaduje úpravu dávkovania.

Spôsob podávania

Na vnútorné použitie.

4.3 Kontraindikácie

Precitlivenosť na megestrolacetát alebo na ktorúkoľvek z pomocných látok uvedených v časti 6.1. Použitie Megesinu ako diagnostický test na graviditu. Megesin sa nemá používať počas gravidity a dojčenia.

4.4 Osobitné upozornenia a opatrenia pri používaní

Každému pacientovi liečenému Megesinom je potrebné venovať zvýšenú pozornosť. U pacientov s tromboflebitídou a u pacientov s ťažkou poruchou funkcie pečene v anamnéze je potrebná zvýšená opatrnosť.

Tento liek obsahuje monohydrát laktózy. Pacientky so zriedkavými dedičnými problémami galaktózovej intolerancie, celkovým deficitom laktázy alebo glukózo-galaktózovej malabsorpcie nesmú užívať tento liek.

4.5 Liekové a iné interakcie

In vitro štúdie preukázali, že megestrolacetát blokuje bunkový cyklus hematopoetických prekursorov, ak sa podáva spolu s antineoplastickými chemoterapeutickými látkami.

4.6 Fertilita, gravidita a laktácia

Gravidita

Megesin sa nemá používať počas gravidity a u dojčiacich žien.

Reprodukčné štúdie na pokusných zvieratách preukázali pri vysokých dávkach megestrolacetátu reverzibilnú feminizáciu niektorých plodov mužského pohlavia.

Gestagény sa používali v prvom trimestri gravidity so zámerom zabrániť habituálnemu alebo hroziacemu potratu. Nie sú spoľahlivé údaje, že by tento postup bol účinný, dostupnú sú dôkazy o možnom nepriaznivom pôsobení takýchto postupov pri používaní v prvých štyroch mesiacoch gravidity.

Okrem toho je u prevažnej väčšiny žien príčinou potratu defekt plodu a nemožno očakávať, že by ho gestagény ovplyvnili. Gestagény majú taktiež tokolytické účinky a tie by v prípade defektného embrya mohli vyvolať oneskorenie spontánneho potratu. Preto sa neodporúča používať gestagény počas prvých štyroch mesiacov gravidity.

Mnohé údaje svedčia o vzťahu medzi intrauterinnou expozíciou liečiva s gestagénymi účinkami počas prvého trimestra gravidity a medzi abnormalitami genitálií u mužských a ženských plodov. Riziko hypospádie (v bežnej populácii u 0,5 – 0,8 % novonarodených chlapcov) sa môže po použití tohto lieku zdvojnásobiť. Nie sú k dispozícii dostatočné údaje pre kvantifikáciu možného rizika na ženské plody; je však známe, že niektoré z týchto látok môžu u ženských plodov vyvolať miernu virilizáciu vonkajších genitálií.

GESTAGÉNY SA NEODPORÚČA PODÁVAŤ POČAS PRVÝCH MESIACOV GRAVIDITY.

Ženu, ktorá užíva Megesin počas prvých štyroch mesiacov gravidity, je potrebné upozorniť na možné riziká.

Ženám v plodnom veku sa počas liečby Megesinom odporúča zabrániť otehotneniu používaním vhodnej antikoncepcie.

Dojčenie

Počas dojčenia nesmie dojčiaca žena užívať Megesin.

4.7 Ovplyvnenie schopnosti viesť vozidlá a obsluhovať stroje

Je nepravdepodobné, že by Megesin ovplyvňoval schopnosti viesť vozidlá a obsluhovať stroje.

4.8 Nežiaduce účinky

Nežiaduce účinky sú kategorizované podľa triedy orgánových systémov a frekvencie ako je uvedené nižšie. Frekvencia výskytu je definovaná podľa nasledujúcej konvencie: 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).

Benigne a malígne nádory vrátane nešpecifikovaných novotvarov (cysty a polypy)

Neznáme: vzplanutie nádorov (s hyperkáciou alebo bez nej).

Poruchy endokrinného systému

Zriedkavé: insuficiencia nadobličiek

Neznáme: Cushingov syndróm, cushingoidný vzhľad

(U každého pacienta, ktorý sa dlhodobo liečil megestrolacetátom alebo u ktorého sa liečba ukončila, je potrebné zvážiť možnosť insuficiencie nadobličiek. Môže byť potrebná zmena liečby na glukokortikoidy. Zriedkavé prípady prejavujúcej sa insuficiencie nadobličiek sa vyskytli po ukončení liečby megestrolacetátom).

Poruchy metabolizmu a výživy

Neznáme: diabetes, zhoršenie pre-existujúceho diabetu, znížená tolerancia glukózy, hyperglykémia, zvýšená chuť do jedla

Psychické poruchy

Neznáme: zmeny nálady

Poruchy nervového systému

Neznáme: syndróm karpálneho tunela

Poruchy srdca a srdcovej činnosti

Neznáme: zlyhanie srdca

Poruchy ciev

Časté: hypertenzia

Zriedkavé: tromboflebitída, pľúcny embolizmus (v niektorých prípadoch s fatálnym následkom)

Poruchy dýchacej sústavy, hrudníka a mediastína

Neznáme: dyspnoe

Poruchy gastrointestinálneho traktu

Časté: nauzea, vracanie

Poruchy kože a podkožného tkaniva

Neznáme: alopecia

Poruchy reprodukčného systému a prsníkov

Časté: metroragia

Laboratórne a funkčné vyšetrenia

Veľmi časté: zvýšenie hmotnosti (zvyčajne nesúvisí so zvýšenou retenciou tekutín)

(Zvýšenie hmotnosti je spojené so zvýšením chuti do jedla a súvisí s nárastom telesného tuku a telesnej hmotnosti).

Zriedkavo sa pri dlhodobom podávaní lieku môže vyskytnúť urtikária, príp. idiosynkratická reakcia.

Megestrolacetát nezapríčiňuje myelosupresiu typickú pre väčšinu cytotoxických látok.

V klinických štúdiách u pacientov, ktorí dostávali Megesin na liečbu AIDS boli opísané tieto nežiaduce účinky ($\geq 5\%$): hnačka, impotencia, vyrážka, flatulencia, asténia, bolesť.

4.9 Predávkovanie

V štúdiách so 6 mesačnou alebo dlhšou liečbou megesterolacetátom v dávke 1600 mg denne sa nepozorovali žiadne akútne toxické účinky.

5. FARMAKOLOGICKÉ VLASTNOSTI

5.1 Farmakodynamické vlastnosti

Farmakoterapeutická skupina: cytostatiká a imunomodulátory, gestagény, ATC kód: L02AB01.

Megesterolacetát je syntetický steroid so silným gestagénnym, antiestrogénnym a antigonadotropným účinkom. Zatiaľ čo presný mechanizmus antineoplastického účinku megesterolacetátu na karcinóm endometria a prsníka nie je doteraz známy, antiluteinizačný účinok sprostredkovaný hypofýzou sa predpokladá. Predpoklad pre existenciu lokálneho účinku je založený na zmenách, ku ktorým dochádza v maternici po priamej instilácii lieku obsahujúceho progesterón.

5.2 Farmakokinetické vlastnosti

Vzhľadom na prítomnosť acetylovej skupiny na pozícii 17 v reťazci sa megesterolacetát pomaly metabolizuje pečeňou, vylučuje sa hlavne močom a stolicou ako steroidný metabolit alebo neaktívna zlúčenina. Biologický polčas v plazme je 15-20 hodín.

Výšku hladiny megesterolacetátu v plazme ovplyvňuje veľké množstvo faktorov a jej určenie závisí aj na použitej metóde stanovenia. Plazmatická hladina závisí od intestinálnej a hepatálnej inaktívacie lieku, môže byť ovplyvnená črevnou motilitou, črevnými baktériami, sprievodnou antibiotickou liečbou, telesnou hmotnosťou, diétou, hepatálnymi funkciami. Klinicky významné rozdiely v biologickej dostupnosti megesterolacetátu pravdepodobne neexistujú.

Metabolizuje sa pravdepodobne len 5-8 % podaného megesterolacetátu. Prevažná väčšina podaného množstva sa vylúči u človeka močom (66 %) a stolicou (20 %). Zvyšok podanej dávky sa eliminuje dýchaním alebo sa ukladá do tukového tkaniva.

5.3 Predklinické údaje o bezpečnosti

Perorálne podanie vysokých dávok megesterolacetátu (5g/kg) nepreukázalo toxický účinok na myšiach. V štúdiách na psoch sa pozorovala zvýšená incidencia benígnych a malígnych nádorov prsnej žľazy po podaní megesterolacetátu po dobu až 7 rokov. Porovnávacie štúdie u opíc a potkanov nepotvrdili zvýšený výskyt nádorov. Aj keď vzťah medzi incidenciou nádorov u psov a ľudí nie je známy, pri hodnotení miery rizika pri predpisovaní megesterolacetátu sa majú sa vziať do úvahy zistené fakty. Pri použití vysokých dávok megesterolacetátu u potkanov sa pozoroval reverzibilný feminizačný účinok.

6. FARMACEUTICKÉ INFORMÁCIE

6.1 Zoznam pomocných látok

monohydrát laktózy
kukuričný škrob
mikrokryštalická celulóza
magnéziumstearát

koloidný oxid kremičitý
predželatinovaný škrob

6.2 Inkompatibility

Neaplikovateľné.

6.3 Čas použiteľnosti

5 rokov

6.4 Špeciálne upozornenia na uchovávanie

Uchovávajúte pri teplote do 15 °C - 25 °C v pôvodnom obale na ochranu pred svetlom.

6.5 Druh obalu a obsah balenia

Fľaška z hnedého priesvitného skla hydrolytickej triedy III s polypropylénovým uzáverom v papierovej škatuľke.

Obsah balenia: 30 alebo 100 tabliet.

Na trh nemusia byť uvedené všetky veľkosti balenia.

6.6 Špeciálne opatrenia na likvidáciu a iné zaobchádzanie s liekom

Žiadne zvláštne požiadavky na likvidáciu.

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

7. DRŽITEĽ ROZHODNUTIA O REGISTRÁCII

Teva B.V.
Swensweg 5
2031 GA Haarlem
Holandsko

8. REGISTRAČNÉ ČÍSLO

44/0330/03-S

9. DÁTUM PRVEJ REGISTRÁCIE/PREDĹŽENIA REGISTRÁCIE

Dátum prvej registrácie: 03. november 2003

Dátum posledného predĺženia registrácie: 12. december 2012

10. DÁTUM REVÍZIE TEXTU

05/2022