

ЗАТВЕРДЖЕНО
Наказ Міністерства охорони
здоров'я України
02.02.09 № 51
Реєстраційне посвідчення
№ UA/9315/01/01

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
ГЛІПРЕСИН
(GLYPRESSIN®)

Склад:

діюча речовина: терліпресину ацетат;

1 флакон містить 1 мг терліпресину ацетату, що еквівалентно 0,86 мг терліпресину;

допоміжні речовини: маніт (Е 421);

1 ампула з розчинником містить натрію хлорид, 1 М розчин кислоти хлористоводневої, воду для ін'єкцій.

Лікарська форма. Порошок та розчинник для розчину для ін'єкцій.

Фармакотерапевтична група. Гормони задньої долі гіпофіза. Код АТС Н01В А04.

Клінічні характеристики.

Показання. Кровотеча із вен стравоходу.

Протипоказання. Септичний шок. Вагітність. Дитячий вік.

Спосіб застосування та дози.

Порошок розчиняють у розчиннику, що додається, і вводять внутрішньовенно повільно. Можливе подальше розведення препарату шляхом додавання 0,9% розчину натрію хлориду до загального об'єму готового розчину - 10 мл.

Спочатку вводять 1–2 мг Гліпресину (1–2 флакони). Підтримуюча доза становить 1 мг препарату (1 флакон) кожні 4 – 6 годин. Зазвичай добова доза Гліпресину становить 120–150 мкг/кг маси тіла. Для дорослих з масою тіла 70 кг доза становить 8–9 флаконів на добу, що вводяться з 4-годинним інтервалом.

Гліпресин слід вводити лише при постійному кардіомоніторингу (артеріальний тиск, пульс, водний баланс) в умовах блоку інтенсивної терапії. Препарат можна застосовувати при наданні першої невідкладної допомоги при підозрі на кровотечу перед госпіталізацією. Слід ретельно контролювати появу ознак гіповолемії. За необхідності лікування може тривати 2–3 дні.

Побічні реакції.

Блідість шкірних покривів, незначне підвищення артеріального тиску, більш значуще у пацієнтів із початково підвищеним рівнем артеріального тиску, аритмія, зниження частоти серцевих скорочень, а також розвиток гострої коронарної недостатності.

В окремих випадках відмічався головний біль, розвиток місцевого некрозу.

Внаслідок стимулювальної дії на гладку мускулатуру терліпресин може підсилювати перистальтику, що, в свою чергу, може спричинити біль у животі, нудоту, діарею.

В окремих випадках звуження бронхів може спричинити задишку.

Скорочення мускулатури матки може спричинити порушення кровообігу в ендометрії і

міометрії.

Можливі одиничні випадки гіпонатріємії та гіпокаліємії, особливо у пацієнтів з існуючим порушеним водним балансом.

Передозування. Завдяки фармакокінетичним особливостям препарату передозування малоімовірне. Не слід перевищувати рекомендовану дозу (2 мг/4 год) у зв'язку з тим, що ризик розвитку тяжких побічних ефектів з боку серцево-судинної системи є дозо-залежним. Слід приділяти особливу увагу пацієнтам з артеріальною гіпертензією в анамнезі (див. розділ “Особливості застосування”).

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Застосування Гліпресину у період вагітності протипоказано (можлива мальформація органів плода; спонтанний аборт). На період застосування препарату слід відмінити годування груддю.

Діти. Досвід застосування Гліпресину дітям відсутній, тому не слід застосовувати препарат пацієнтам цієї вікової категорії.

Особливості застосування.

З обережністю, за наявності ретельного моніторингу, застосовують Гліпресин при таких захворюваннях: бронхіальна астма, артеріальна гіпертензія, ураження серця і судин (поширений атеросклероз, захворювання серця, коронарна недостатність, аритмія), ниркова недостатність.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами. Не впливає.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Одночасне введення з препаратами, здатними спричинити брадикардію (наприклад, пропופол, суфентаніл), може призвести до тяжкої брадикардії.

Фармакологічні властивості. Фармакодинаміка.

Терліпресин – синтетичний аналог гормона задньої долі гіпофіза – вазопресину. Терліпресин зменшує портальну гіпертензію, одночасно знижуючи портальний кровотік і спричиняє спазм м'язів стравоходу з подальшим стисненням варикозно розширених вен стравоходу. Біологічно активний лізин-вазопресин повільно вивільняється із неактивного прогормона терліпресину і зберігається в діапазоні концентрацій від мінімально активної до субтоксичної протягом 4 – 6 годин у зв'язку з тим, що метаболічна елімінація лізин-вазопресину відбувається паралельно з вивільненням.

Терліпресин підвищує тонус гладком'язової мускулатури шлунково-кишкового тракту як у судинах, так і поза ними. Зважаючи на підвищення периферичного опору в термінальних артеріальних судинах має місце зниження трофіки нервових волокон, що іннервують внутрішні органи. Зниження артеріальної перфузії призводить до зниження тиску в системі ворітної вени. Одночасне скорочення м'язових оболонки різних відділів кишечника призводить до посилення перистальтики. Більш того, скорочуються м'язи стінки стравоходу і, таким чином, перетискають варикозні вузли.

Антидіуретична активність терліпресину становить всього 3 % від активності нативного вазопресину. Така активність не є клінічно значущою. При нормоволемії кровотік в нирках істотно не змінюється. За наявності гіповолемії кровотік у нирках збільшується.

Терліпресин чинить повільний гемодинамічний ефект протягом 2–4 годин. Незначною мірою підвищується артеріальний тиск як систоли, так і діастолі. За наявності ренальної гіпертензії і генералізованого ангіосклерозу відмічалось значне підвищення артеріального

тиску.

Застосування терліпресину не спричиняло будь-яких кардіотоксичних ефектів, навіть при застосуванні вищих доз.

Під впливом терліпресину кровотік в ендометрії і міометрії істотно знижується.

Зважаючи на наявність судинозвужувального ефекту, терліпресин призводить до зниження кровотоку в шкірі і, таким чином, спричиняє блідість шкіри у пацієнта.

Гемодинамічний ефект і дія на гладку мускулатуру є головними чинниками фармакологічної дії терліпресину. Ефект централізації кровообігу при гіповолемії є бажаним побічним ефектом у пацієнтів з кровотечею із варикозно розширених вен стравоходу.

Фармакокінетика. Терліпресин має слабку фармакологічну активність. Фармакологічно активний метаболіт терліпресину лізин-вазопресин характеризується уповільненим вивільненням внаслідок руйнування останнього. Одиначний гліциловий залишок при розщепленні тригліцилнонапептиду легко виділяється у вільному вигляді. Середній період напіввиведення терліпресину з плазми крові становить 24 ± 2 хв. Після внутрішньовенного болюсного введення терліпресин виводиться відповідно до закономірностей кінетики другого порядку. Визначений час напівжиття для фази розподілу (тривалість – до 40 хв), який становить 12 хв. При виділенні вільного гліцилового залишку гормон лізин-вазопресин вивільняється повільно і досягає пікової концентрації через 120 хв. У сечі визначається всього 1 % введеного терліпресину, що вказує на практично повну деградацію препарату за допомогою ендо- й екзопептидаз печінки і нирок.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості: порошок білого кольору; розчинник – прозорий, безбарвний розчин.

Несумісність. Не відома.

Термін придатності. 3 роки.

Приготовлений розчин для ін'єкцій слід застосовувати негайно.

Не застосовувати препарат після закінчення терміну придатності, вказаного на упаковці.

Умови зберігання. Зберігати при температурі не вище 25 °С в оригінальній упаковці. Зберігати в недоступному для дітей місці.

Упаковка. Флакон з порошком та ампула з розчинником в упаковці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. Феррінг ГмбХ.

Феррінг Інтернешнл Сентер СА.

Рентшлер Біотехнологі ГмбХ.

Місцезнаходження. Вітланд 11, Постфаш 21 45, Д-24109 Кіль, Німеччина.

Чемін де ла Вергогнаусаз 50, 1162, Сан-Пре, Швейцарія.

Вул. Ервін Рентшлер, 21 Д-88471, Лауфайм, Німеччина.