

ЗАТВЕРДЖЕНО
Наказ Міністерства охорони
здоров'я України
25.06.09 № 446
Ресстраційне посвідчення
№ UA/9801/01/01

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
РЕМЕСТИП
(REMESTYP)

Склад:

діюча речовина: terlipressin;

1 мл розчину містить терліпресину 0,1 мг;

допоміжні речовини: натрію хлорид, натрію ацетат тригідрат, кислота оцтова, вода для ін'єкцій.

Лікарська форма. Розчин для ін'єкцій.

Фармакотерапевтична група. Гормони задньої частки гіпофіза. Аналоги вазопресину.

Код АТС Н01В А04.

Клінічні характеристики.

Показання.

Кровотечі травного тракту та сечостатевого шляхів наприклад, кровотечі з варикозних вузлів стравоходу, виразки шлунка і дванадцятипалої кишки; маткова кровотеча, зумовлена функціональними порушеннями або іншими причинами, пологами, абортom тощо; кровотечі, пов'язані з хірургічними втручаннями, зокрема на органах черевної порожнини й малого таза.

Місцево – під час гінекологічних втручань на шийці матки.

Протипоказання.

Гіперчутливість до діючої речовини або до будь-якого допоміжного компонента препарату. I триместр вагітності, крім життєвих показань. Токсикоз вагітних, епілепсія.

Спосіб застосування та дози.

Кровотечі з варикозно розширених вен стравоходу: 1 мг (1000 мкг) кожні 4 – 6 годин протягом 3 – 5 днів. Для запобігання рецидиву кровотечі, лікування слід продовжувати протягом 24 – 48 годин після її зупинки. Препарат вводять внутрішньовенно болюсно або у вигляді короткочасної інфузії.

Інші види кровотеч травного тракту: 1 мг кожні 4 – 6 годин. Препарат також може бути використаний як засіб першої допомоги незалежно від хірургічного втручання, якщо є підозра на кровотечу з верхніх відділів травного тракту.

Кровотечі з внутрішніх органів у дітей: зазвичай вводять у дозі від 8 до 20 мкг/кг маси тіла з інтервалом 4 – 8 годин. Препарат слід вводити протягом усього періоду кровотечі; загальною рекомендацією є продовження введення для запобігання її рецидиву – так само, як у випадку кровотеч у дорослих. За наявності склерозованих варикозних вузлів стравоходу призначають одноразове введення у дозі 20 мкг/кг маси тіла болюсно.

Кровотечі сечостатевої шляхів: враховуючи різницю активності ендопептидаз у плазмі крові та тканинах, діапазон дозувань є достатньо широким – від 0,2 до 1 мг, які призначають з інтервалом 4 – 6 годин.

При ювенільних маткових кровотечах рекомендовані дози від 5 до 20 мкг/кг маси тіла. Препарат слід застосовувати внутрішньовенно.

Місцеве застосування при гінекологічних втручаннях: 0,4 мг (400 мкг) розводять 0,9 % розчином натрію хлориду до об'єму 10 мл, застосовують інтрацервікально або парацервікально. У цьому випадку ефект препарату розвивається через 5 – 10 хвилин. За необхідності дозу можна збільшити або призначити повторно.

Побічні реакції.

З боку системи травлення: біль у животі, підсилена перистальтика аж до кишкової коліки, нудота, діарея.

З боку серцево-судинної системи: підвищення артеріального тиску, брадикардія, виняткові одиничні випадки - задишка, серцева недостатність, інфаркт міокарда.

З боку нервової системи: головний біль.

Інші: винятково-поодинокі випадки - фокальний некроз у місці введення.

Передозування.

Не можна перевищувати дозу 2 мг протягом 4 годин, оскільки збільшується ризик серйозної побічної дії на системний кровообіг. Для контролю артеріальної гіпертензії, яка може розвинутиися при лікуванні Реместипом, слід застосовувати клонідин або симпатолітики. Для купірування брадикардії вводять атропін.

Застосування в період вагітності або годування груддю.

Терліпресин стимулює активність міометрія та знижує матковий кровотік. Дослідження впливу препарату на репродуктивну функцію тварин свідчать, що більш високі дози терліпресину збільшують кількість абортів або ранніх смертей плода з наступними абортами. Встановлено, що живі плоди мали меншу масу тіла та більшу кількість вроджених аномалій.

Препарат протипоказаний у I триместрі вагітності, крім випадків призначення за життєвими показаннями. В інші періоди вагітності Реместип призначають лише після оцінки співвідношення очікувана користь для матері/можливий ризик для плода. Достатніх даних про виділення препарату в грудне молоко немає, проте всмоктування якоїсь значимої кількості незміненого пептиду у травному тракті дитини мало ймовірно.

Діти. Препарат застосовують дітям згідно з рекомендованою схемою (див. „Спосіб застосування та дози”).

Особливості застосування.

Препарат слід обережно застосовувати літнім пацієнтам, хворим з ішемічною хворобою серця, тяжкою артеріальною гіпертензією, аритмією, бронхіальною астмою.

При лікуванні Реместипом, особливо у високих дозах (0,8 мг і більше), необхідно ретельно контролювати артеріальний тиск, частоту пульсу, баланс рідини, особливо при наявності у пацієнта тяжкої артеріальної гіпертензії, захворювань серця, а також у літніх осіб.

Реместип не є кровозамінним засобом для пацієнтів з дефіцитом об'єму циркулюючої крові. Оскільки після застосування терліпресину епізодично спостерігалися фокальні некрози, слід уникати внутрішньом'язового введення, застосовуючи нерозведений препарат у дозах 0,5 мг і більше тільки внутрішньовенно.

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

На даний час дані відсутні.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Вазоконстрикторний ефект і стимулюючий вплив на тонус міометрія посилюються при одночасному застосуванні з окситоцином та метилергометрином. Реместип потенціює дію неселективних бета-адреноблокаторів щодо зниження портальної гіпертензії. Паралельне застосування з препаратами, які зменшують частоту серцевих скорочень, може спричинити тяжку брадикардію.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Терліпресин (N-тригліцил-8-лізин-вазопресин) – синтетичний аналог вазопресину, природного гормону задньої частки гіпофіза, що відрізняється від нього заміщенням у 8-й позиції аргініном на лізин, а також тим, що три гліцинових залишки приєднані до термінальної аміногрупи цистеїну. Фармакологічна дія терліпресину полягає у сумуванні специфічного ефекту речовин, утворених у результаті його ферментативного розщеплення. Помітними ефектами терліпресину є виражений вазоконстриктивний та антигеморагічний. Найбільш помітним у цьому відношенні ефектом є зниження кровообігу в паренхімі внутрішніх органів, внаслідок чого знижується печінковий кровотік і тиск у системі ворітної вени.

Фармакодинамічні дослідження показали, що терліпресин, подібно до аналогічних пептидів, спричиняє спазм артеріол і венул переважно в паренхімі внутрішніх органів, скорочення гладкої мускулатури стінки стравоходу, підвищення тону та перистальтики кишечника загалом.

Крім впливу на гладкі м'язи судин, терліпресин стимулює гладку мускулатуру матки, у тому числі при відсутності вагітності.

За результатами досліджень дії препарату у тварин і людей максимальна його активність спостерігалась у внутрішніх органах і шкірі.

Клінічних проявів антидіуретичного ефекту терліпресину не виявлено.

Фармакокінетика.

Власне терліпресин є неактивним щодо гладкої мускулатури, але він слугує хімічним депо для фармакологічно активних речовин, які утворюються у результаті ферментативного розщеплення. Цей ефект розвивається повільніше, ніж ефект лізин-вазопресину, але триває значно довше.

Лізин-вазопресин зазвичай піддається біотрансформації в печінці, нирках та інших тканинах.

Фармакокінетичний профіль після внутрішньовенного введення найкраще описаний за допомогою двокомпонентної моделі. Період напіввиведення становить 40 хвилин,

метаболічний кліренс – 9 мл/кг за хвилину, об'єм розподілу – 0,5 л/кг. Очікувана концентрація лізин-вазопресину починає досягатись у плазмі приблизно через 30 хвилин після введення терліпресину. Максимальна концентрація досягається між 60 і 120 хвилинами.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості: прозорий безбарвний розчин.

Несумісність.

Препарат не слід змішувати з іншими лікарськими засобами.
Застосовувати тільки рекомендовані розчинники.

Термін придатності.

2 роки.

Умови зберігання.

Зберігати у холодильнику (при температурі від +2 до + 8 °С).

Не заморожувати.

Протягом 1 місяця препарат може зберігатися при температурі 25 °С (наприклад, в автомобілі швидкої допомоги).

Упаковка.

По 2 мл або 10 мл в ампулі. По 5 ампул у картонній коробці.

Категорія відпуску.

За рецептом.

Виробник. ЗЕНТИВА а.с.

Місцезнаходження. У кабеловни 130, 102 37 Прага 10, Долні Мехолупи, Чеська Республіка.