

Информация за пациента. Моля прочетете внимателно

**РЕМЕСТИП 0,1 mg/ml инжекционен разтвор/
REMESTYP® 0,1 mg/ml solution for injection**

Описание на продукта

Терлипресин е N-триглицил-8-лизин-вазопресин - синтетичен аналог на вазопресин (естествено отделящ се хипофизен хормон). Разликата между естествения и синтетичния вазопресин е в заместването на аргинин в 8-ма позиция от лизин, а също така и свързването на три глицинови остатъка към аминокиселинния край на цистеина. Фармакологичният ефект на Терлипресин се състои в наслагване на ефектите от отделните субстанции, образувани в процеса на ензимно делене.

Терлипресин има значителен съдосвиващ и антихеморагичен ефект.

Най-значимата промяна е намаления кръвоток в спланхникусовата област с последващо намаление на чернодробния кръвоток и порталното кръвно налягане. Фармакодинамични изследвания показват, че подобно на други пептиди, терлипресин предизвиква свиване на артериите, вените и венулите предимно в спланхникусовата област, а така също и спазъм на гладката мускулатура на хранопровода, повишава тонуса и активността на чревната перисталтика.

Освен свиване на кръвоносните съдове, Терлипресин предизвиква и стимулиране на активността на миометриума (маточната гладка мускулатура), дори и в небременна матка.

Резултатите от проучвания с експериментални животни и хора подкрепят хипотезата за най-интензивна активност на Терлипресин в спланхникусовата област и кожата.

Антишоковият ефект на Терлипресин бе потвърден не само при хеморагичен, но също така и при ендотоксичен и хистаминов шок.

Няма клинични данни за антидиуретичен ефект на Терлипресин.

Фармакотерапевтична група

Вазопресори

Фармакокинетика

Терлипресин сам по себе си е неактивен по отношение на гладката мускулатура, но той служи като химично депо на активни фармакологични субстанции, образувани от процеса на ензимно делене. В сравнение с лизин-вазопресин, ефектът настъпва по-бавно, но е по-дълготраен.

Лизин-вазопресин е обект на обикновено разграждане в черния дроб, бъбреците и други тъкани.

Интравенозният фармакологичен профил може да се опише чрез използване на двукомпартиментен модел.

Полувремето на екскреция е около 40 минути, метаболитният клирънс около 9 ml/kg x min и обемът на разпределение е около 0,5 l/kg. Изчислима концентрация на лизин-вазопресин може да се открие в плазмата 30 мин. след прилагане на Терлипресин с пикови стойности след 60 - 120 мин.

Показания

Кървене от стомашно-чревната и пикочо-половата система при възрастни и деца – напр. кървене от разширени вени на хранопровода, стомашни и дуоденални язви, функционални и подобни видове кървене от матката, раждане, аборт и т.н.

Кървене в резултат на оперативна интервенция, по-специално такава в областта на



корема и таза.

Локално приложение при гинекологични операции, напр. на шийката на матката.

Бременност и кърмене

Терлипресин предизвиква повишаване на активността на миометриума и понижение на маточния кръвен поток. Репродуктивни изследвания, извършени върху зайци и плъхове, показват повишено ниво на абортите или ембрионална смърт, последвана от аборт при приложение на по-високи дози. При раждане на жив плод е установено по-ниско телесно тегло, а също така са установени по-голям брой аномалии. Продуктът е противопоказан през първото тримесечие на бременността освен в случаите на жизнено важни показания.

Няма достатъчно налична информация за разпределението на Терлипресин в кърмата, но е малко вероятно да има значителна резорбция на непроменен пептид в стомашно-чревната система на детето. В по-късните периоди на бременността трябва да се прецени ползата от прилагането на продукта спрямо възможните рискове.

Противопоказания

Свръхчувствителност към лекарственото вещество или към някое от помощните вещества.

Първите 3 месеца на бременността, освен ако няма жизненоважна индикация, токсикоза на бременността, епилепсия. В следващите месеци на бременността би трябвало винаги да се има предвид съотношението полза/риск при приложението му.

Внимание

Когато Реместип се прилага особено в по-високи дози (800 µg и повече) се препоръчва стриктно мониториране на кръвното налягане, сърдечната честота и водния баланс. Това трябва да се има предвид основно при пациенти с високо кръвно налягане, сърдечна недостатъчност и възрастни пациенти.

Реместип не отменя вливането на кръвни заместители при пациенти с намален обем на кръвта.

Имайки предвид отделните случаи на локална некроза, наблюдавана след прилагане на Терлипресин, трябва да се избягва интрамускулното приложение на дози от 0,5 mg (500 µg) и повече. За предпочитане е интравенозното приложение.

Лекарствени взаимодействия

Окситоцинът и метилергометринът повишават вазоконстрикторния (съдосвиващ) и тоничния ефект върху матката. Терлипресин усилва хипертензивния ефект на неселективните блокери в vena portae. Паралелното лечение с вещества, намаляващи сърдечната честота, може да доведе до сериозна брадикардия (забавяне на сърдечната честота).

Дозировка и начин на приложение

Дозата и продължителността на лечението се определят от лекаря.

Кървене от варици на хранопровода: 1,0 mg (1000 µg) на всеки 4 - 6 часа в продължение на 3 - 5 дни. За предпазване от повторно кървене, би трябвало да се препоръчва продължително лечение, докато кървенето бъде овладяно в рамките на 24 - 48 часа.

Дозата трябва да се прилага интравенозно (по принцип струйно) чрез инжекция или крактотрайна инфузия.

Други видове кръвоизливи на стомашно-чревния тракт: 1,0 mg (1000 µg) на всеки 4 - 6 часа. Може да бъде използвано като лечение при първа помощ в случаи на



клинични данни съмнителни за кървене в горната част на стомашно-чревния тракт.

Кървене от спланхниковата област при деца: обичайната доза варира от 8 до 20 µg/kg телесно тегло, разпределена на интервали от 4 до 8 часа. Приложението трябва да продължи през целия период на кървене, общата препоръка е то да се продължи както в случаите на кървене при възрастни. За склезозирани варици на хранопровода се прилага единична доза от 20 µg/kg телесно тегло приложена струйно венозно.

Кървене от пикочо-половите пътища: диапазонът на дозировката е твърде широк и това се дължи на различната активност на плазмените и тъканните ендопептидази. Затова дозировката ще варира от 0,2 до 1,0 mg (200 - 1000 µg) на всеки 4 - 6 часа. При ювенилни метрорагии се препоръчват дози от 5 до 20 µg/kg телесно тегло. Прилагането трябва да бъде интравенозно, в изключителни случаи - интрамускулно. Последният начин на прилагане трябва да се избягва, особено при високи дози.

Локално приложение при гинекологични операции: Доза от 0,4 mg (400 µg) се разрежда с физиологичен серум до обем от 10 ml и се прилага интрацервикално или парацервикално. Ефектът при този начин на приложение на лекарството може да се установи приблизително след 5 - 10 мин. Ако е необходимо, дозата се увеличава или се повтаря.

Предозиране

Дози над 2 mg/4 h (2000 µg/4 h) часа увеличават риска от сериозни нежелани реакции по отношение на общото кръвообращение. Затова, максималният предписан дозов режим не би трябвало да се надвишава.

В случай на хипертония, поради прилагането на Реместип трябва да се приложи клонидин или друг α- симптиколитик. В случай на брадикардия трябва да се приложи атропин.

Нежелани реакции

Най-честите странични ефекти по време на прилагане са: бледост, хипертония, коремна болка, ускорена дефекация или колики, гадене, диария и главоболие, по-рядко брадикардия. Сериозните странични ефекти са редки. Съобщава се също за отделни случаи на стенокардни пристъпи, сърдечна недостатъчност, задух и локална некроза в мястото на инжектиране.

Предупреждение

Лекарството да не се използва след изтичане срока на годност, обозначен на опаковката.

Съхранение

Да се съхранява при температура 2 - 8 ° C (в хладилник) в оригиналната опаковка, за да се предпази от светлина. Да не се замразява.

Да се съхранява на места недостъпни за деца.

Състав

Лекарствено вещество: Терлипесин 0,1 mg/ml.

Помощни вещества: натриев хлорид, оцетна киселина, натриев ацетат, вода за инжекции

Опаковка

РЕМЕСТИП 0,1 mg/ml инжекционен разтвор 2 ml x 5 бр. ампули



РЕМЕСТИП 0,1 mg/ml инжекционен разтвор 10 ml x 5 бр. ампули
Притежател на разрешението за употреба
Борола ЕООД, ул. Цар Самуил 125, 1202 София, България

Производител
Ferring-Leciva, a.s., K Rybníku 475, 252 42, Jesenice u Prahy, Чешка Република

Дата на последната редакция на текста
09/2008

