

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування лікарського засобу

ГАСТРОЦЕПІН®
(GASTROZEPIN®)

Склад:

діюча речовина: пірензепіне;

1 ампула по 2 мл містить пірензепіну дигідрохлориду моногідрату 10,43 мг, що еквівалентно пірензепіну дигідрохлориду 10 мг;

допоміжні речовини: пропіленгліколь (Е 1520); натрію хлорид; натрію ацетат, тригідрат (Е 262); кислота оцтова льодяна (Е 260); вода для ін'єкцій.

Лікарська форма. Розчин для ін'єкцій.

Фармакотерапевтична група. Засоби для лікування пептичної виразки та гастроєзофагеальної рефлюксної хвороби (ГЕРХ).

Код АТС А02В Х03.

Клінічні характеристики.

Показання.

Профілактика та лікування виразок, спричинених стресом, ерозій або виразок верхніх відділів шлунково-кишкового тракту, що кровоточать.

Протипоказання.

Встановлена гіперчутливість до будь-якого з компонентів препарату; паралітична непрохідність кишечника. Застосування препарату протипоказане пацієнтам із рідкісною вродженою непереносимістю до будь-якого з компонентів препарату.

Спосіб застосування та дози.

Рекомендовано застосування у нижчезазначених дозах.

Звичайна добова доза становить 20 мг пірензепіну дигідрохлориду (2 разові дози).

Дорослим кожні 12 годин необхідно вводити вміст 1 ампули (10 мг) внутрішньом'язово або внутрішньовенно. В особливо тяжких випадках показано вводити по 2 ампули, що еквівалентно 20 мг ГАСТРОЦЕПІНу, 3 рази на добу, тобто добову дозу можна збільшити до 60 мг.

Метод приготування та сумісність.

Внутрішньовенна інфузія: ГАСТРОЦЕПІН, розчин для ін'єкцій, можна поєднувати з 0,9 % розчином натрію хлориду, розчином Рінгера або 5 % розчином декстрази.

Безпосередньо перед застосуванням слід проводити візуальну оцінку зазначених розчинів, оскільки залежно від виробника склад таких розчинів може змінюватись (наприклад рН). ГАСТРОЦЕПІН, розчин для ін'єкцій, можна поєднувати із зазначеними розчинами за умови, що немає каламутності, осаду або зміни кольору. Змішування розчинів слід проводити належним чином перед початком введення інфузії. Для оцінки змішуваності розчину спостереження проводять протягом 12 годин при кімнатній температурі. Інфузійні розчини, що містять ГАСТРОЦЕПІН слід вводити не пізніше ніж через 12 годин після приготування.

ГАСТРОЦЕПІН, розчин для ін'єкцій, можна вводити у вигляді внутрішньом'язових і внутрішньовенних ін'єкцій або шляхом інфузії.

Внутрішньовенні ін'єкції слід, як правило, здійснювати повільно, оскільки:

– у зв'язку із вмістом 39,2 % пропіленгліколю у складі препарату існує ризик розвитку тромбофлебіту;

– у хворих з нестабільною гемодинамікою проводять моніторинг артеріального тиску і частоти серцевих скорочень у зв'язку з високим початковим рівнем пірензепіну дигідрохлориду в плазмі. Парентеральне застосування повинно тривати до зникнення симптомів, зазвичай протягом 2-3 днів, для продовження лікування слід застосовувати пероральні форми препарату. Курс лікування визначає лікар.

Побічні реакції.

За частотою прояву побічні реакції класифіковані таким чином:

дуже часто ($\geq 1/10$);

часто ($\geq 1/100$ до $<1/10$);

нечасто ($\geq 1/1000$ до $<1/100$);

рідко ($\geq 1/10\ 000$ до $<1/1000$);

дуже рідко ($\geq 1/10000$);

невідомо (не можна встановити за наявними даними).

Спостерігалися нижчезазначені побічні реакції:

Класифікація за системою органів	Частота
<i>З боку імунної системи</i>	
анафілактичні реакції	Невідомо
гіперчутливість	Невідомо
<i>З боку нервової системи</i>	
головний біль	Часто
сплутаність свідомості	Дуже рідко
<i>З боку органів зору</i>	
порушення акомодатії	Часто
<i>Кардіальні порушення</i>	
зміна частоти серцевих скорочень, зокрема тахікардія	Невідомо
<i>З боку травної системи</i>	
сухість у роті	Дуже часто
запор, діарея	Часто
<i>З боку шкіри та підшкірної клітковини</i>	
висипання	Часто
<i>З боку сечовидільної системи</i>	
затримка сечі	Нечасто

Підвищення рН у шлунку до понад 3,5 призводить у більшості випадків до колонізації вмісту шлунка грамнегативними бактеріями у пацієнтів після 3-7 днів проведення інтенсивної терапії. Дослідження показують, що колонізація трахеобронхіальної системи зі шлунка можлива. Було описано, що кількість випадків внутрішньо-лікарняної пневмонії у пацієнтів інтенсивної терапії була вищою у разі медикаментозного підвищення рН вмісту шлунку для профілактики стресових виразок.

Передозування.

При введенні великих доз пірензепіну можуть розвинути такі антихолінергічні ефекти: порушення зору, тахікардія, сухість у роті, підвищення температури тіла, сухість і почервоніння шкіри, затримка сечі, кишкова непрохідність, занепокоєння або сонливість, рефлекторні міоклонічні рухи, хореоатетоз.

Для лікування можна застосовувати парасимпатоміметичні агенти, наприклад фізостигмін.

Пацієнтам із глаукомою застосовують пілокарпін місцево. У разі виникнення гострої глаукоми необхідно почати лікування міотичними краплями і негайно звернутися за допомогою до спеціаліста.

Пірензепін слабко виводиться за допомогою діалізу.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Інформація щодо застосування пірензепіну вагітним жінкам обмежена.

Встановлено, що пірензепін проникає у грудне молоко, хоч і в дуже незначній кількості. У результаті цього у дитини, яка знаходиться на грудному вигодовуванні, може спостерігатися антихолінергічний ефект.

Слід уникати застосування препарату ГАСТРОЦЕПІН, розчин для ін'єкцій, у період вагітності та годування груддю.

Дослідження щодо впливу на фертильність і репродуктивну функцію людини не проводилися.

Діти.

На сьогодні не отримано підтвердження безпеки та ефективності застосування пірензепіну дигідрохлориду дітям віком до 18 років.

Особливості застосування.

Застосування ГАСТРОЦЕПІНу може маскувати симптоми раку шлунка і тим самим відстрочити правильне встановлення діагнозу. Тому перед початком лікування виразки шлунка необхідно провести відповідні обстеження для виявлення злоякісних захворювань.

Пацієнтам із виразкою дванадцятипалої кишки або шлунка слід пройти перевірку на наявність інфекції *Helicobacter pylori* (HP). У разі підтвердження наявності інфекції HP слід провести ерадикаційну терапію, якщо можливо, оскільки успішне проведення цієї терапії зазвичай приводить до виліковування виразки.

Щоб запобігти розвитку побічних реакцій з боку серцево-судинної системи внутрішньовенні ін'єкції ГАСТРОЦЕПІНу, розчину для ін'єкцій, завжди повинні бути повільними. Препарат слід вводити протягом декількох хвилин, з обережністю. У пацієнтів із захворюваннями серця або порушенням кровообігу слід проводити моніторинг артеріального тиску і частоти серцевих скорочень.

У пацієнтів з тяжкими порушеннями функцій нирок (кліренс креатиніну <30 мл /хв) слід звернути увагу на розвиток побічних реакцій і знизити дозу при необхідності.

Пірензепін необхідно застосовувати з обережністю хворим на

- глаукому;
- гіпертрофію передміхурової залози;
- тахікардію.

У разі розвитку антихолінергічних побічних реакцій, таких як порушення зору або затримка сечі, лікування ГАСТРОЦЕПІНом слід припинити. У зв'язку з антихолінергічною дією препарат слід з обережністю застосовувати таким пацієнтам, особливо при парентеральному введенні однократних доз більше 10 мг пірензепіну.

Для отримання інформації щодо застосування пацієнтам інтенсивної терапії див. розділ «Побічні реакції».

ГАСТРОЦЕПІН, розчин для ін'єкцій, містить менше ніж 1 ммоль натрію (23 мг) на одну рекомендовану дозу, тобто практично не «містить натрію».

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

Дослідження щодо здатності впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами не проводилися.

Але пацієнтів слід повідомити, що під час лікування ГАСТРОЦЕПІНом у них можуть виникати небажані ефекти, зокрема порушення акомодатії. Тому цей препарат рекомендується приймати з

обережністю під час керування автотранспортом або роботи з іншими механізмами. Якщо у пацієнтів виникають порушення акомодатції, вони повинні уникати керування автотранспортом або роботи з іншими механізмами.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Однотимчасне застосування ГАСТРОЦЕПІНу з антагоністами H₂-гістамінових рецепторів може призвести до суттєвого посилення антисекреторної дії в результаті синергії.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Пірензепін селективно блокує мускаринові рецептори, знижує продукцію шлункового соку та підвищує рН шлунка. У терапевтичних дозах він не проходить через гематоенцефалічний бар'єр. Пірензепін – це антихолінергічний препарат, фармакологічна дія якого базується на конкурентній блокаді мускаринових рецепторів (M-холінорецепторів). Пірензепін призводить до дозозалежного зниження (головним чином за рахунок зниження об'ємів секреції, меншою мірою за рахунок впливу на концентрацію іонів H⁺) секреції шлункової кислоти, яка стимульована експериментально – шляхом конкурентної блокади M₁-рецепторів на автономних гангліонарних клітинах і паракринних клітинах шлунка. Це є основною дією пірензепіну при застосуванні в терапевтичній дозі 100 мг. Тобто при терапевтичній дозі 100 мг не виключено, що пірензепін певною мірою є селективним препаратом для мускаринових рецепторів M₁. На відміну від класичних антагоністів мускаринових рецепторів, таких як атропін, пірензепін не виявляє однакової спорідненості з різними мускариновими рецепторами: він має меншу спорідненість з рецепторами серця (M₂-рецептори) і гладких м'язів (M₃-рецептори), ніж з рецепторами екзокринних залоз (M₃-рецептори) і рецепторами кори головного мозку та периферійних гангліїв (M₁-рецептори). Тому при застосуванні у низьких дозах пірензепін вважається селективним антагоністом M₁ мускаринових рецепторів. Проте зі збільшенням дози дія пірензепіну поширюється також на інші мускаринові рецептори, що призводить до виникнення антихолінергічних (атропіноподібних) побічних реакцій.

Фармакокінетика.

Після внутрішньовенної ін'єкції 8 мг пірензепіну максимальна концентрація у плазмі становить близько 425 нг пірензепіну/мл; через 30 хвилин після ін'єкції концентрація у плазмі становить 75 нг пірензепіну/мл та через 75 хвилин після ін'єкції 50 нг пірензепіну/мл. Абсорбція після внутрішньом'язової ін'єкції швидка і повна. Пік концентрації 90 нг пірензепіну/мл у плазмі досягається через 20 хвилин після внутрішньом'язової ін'єкції 8 мг пірензепіну. Після внутрішньом'язової ін'єкції 8 мг пірензепіну та такої ж паралельної внутрішньовенної ін'єкції концентрація у плазмі крові була на 20 % вищою, ніж після внутрішньом'язової ін'єкції.

Об'єм розподілу становить у середньому 14 л після внутрішньовенної ін'єкції. Зв'язування пірензепіну з білками плазми слабе (близько 12 %). Період напіввиведення становить 10 год.

Дози 8 мг пірензепіну, перша з яких була введена внутрішньовенно, інша – внутрішньом'язово, були виведені протягом 4 днів однаковою мірою з сечею та калом, переважно в незмінній формі та лише невелика частина – у формі фармакологічно неактивного метаболіту дезметилпірензепіну.

Концентрація в цереброспинальній рідині становить максимум 10 % концентрації в плазмі. Пірензепін слабко проникає через плаценту. Немає даних щодо проникнення пірензепіну в грудне молоко.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості: прозорий, безбарвний або злегка жовтуватий розчин, практично вільний від часток.

Несумісність. Через можливу несумісність не рекомендовано змішувати препарат з іншими розчинами для ін'єкцій або інфузій.

Термін придатності. 5 років.

Умови зберігання.

Зберігати в оригінальній упаковці для захисту від світла у недоступному для дітей місці при температурі не вище 25 °С.

Упаковка.

По 2 мл в ампулі; по 5 ампул у картонній коробці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник.

Берінгер Інгельхайм Еспана, СА, Іспанія/
Boehringer Ingelheim Espana, SA, Spain.

Місцезнаходження.

Прат де ла Ріба 50, 08174 САНТ КУГАТ ДЕЛ ВАЛЛЕС (Барселона), Іспанія/
Prat de la Riba 50, 08174 SANT CUGAT DEL VALLÈS (Barcelona), Spain.