

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування препарату **ОКТРАЙД** **(OCTRIDE)**

Загальна характеристика:

міжнародна назва: октреотид;

основні фізико-хімічні властивості: прозора безбарвна рідина;

склад: 1 мл містить октреотиду ацетату еквівалентно октреотиду 50 мкг або 100 мкг;

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

Форма випуску. Розчин для ін'єкцій.

Фармакотерапевтична група. Гіпоталамічні гормони. Код АТС Н01СВ02.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Октреотид являє собою синтетичний октопептид, котрий є похідним природного гормону соматостатину, він має подібні фармакологічні ефекти, але при цьому тривалість його дії значно більша. Препарат пригнічує патологічно підвищену секрецію гормону росту, а також секрецію тиреотропного гормону. Пригнічує екзокринну та ендокринну (інсуліну, глюкагону) секрецію підшлункової залози, а також секрецію гастрину, соляної кислоти, холецистокініну, секретину, травних ферментів, вазоінтестинального пептиду і деяких інших пептидів, біологічно активних речовин, секреція яких здійснюється гастро-ентеро-панкреатичною системою. Пригнічує моторику шлунка та кишечнику.

Фармакокінетика. Після підшкірного введення препарат швидко та повністю проникає у кров'яне русло. Максимальна концентрація препарату в плазмі досягається у межах 30 хв після введення.

Зв'язування з білками плазми становить 65%. Зв'язування октреотиду з форменими елементами крові вкрай незначне. Обсяг розподілу – 0,27 л/кг.

Загальний кліренс – 160 мл/хв. Майже 32% введеної дози препарату виводиться в незміненому вигляді нирками. Період напіввиведення ($T_{1/2}$) після підшкірної ін'єкції препарату становить 100 хв. Після внутрішньовенного введення виведення препарату здійснюється у дві фази: $T_{1/2}$ – 10 і 90 хв відповідно. У літніх пацієнтів знижується кліренс, а $T_{1/2}$ збільшується. При тяжкій нирковій недостатності кліренс зменшується вдвічі.

Показання для застосування. Акромегалія (при відсутності достатнього ефекту від хірургічного лікування, променевої терапії та у неоперабельних хворих).

Профілактика та лікування ускладнень після операцій на підшлунковій залозі.

Рефрактерна діарея у хворих на СНІД.

Зупинка кровотечі і профілактика повторної кровотечі з варикозно розширених вен стравоходу у хворих на цироз печінки.

Полегшення перебігу симптомів ендокринних пухлин травного тракту і підшлункової залози, карциноїдні пухлини з наявністю карциноїдного синдрому, глюкагономи, гастринноми (синдром Золлінгера-Еллісона), інсуліноми, соматоліберинноми.

Спосіб застосування та дози.

При *акромегалії* підшкірно початкова доза становить 0,05 - 0,1 мг через 8 - 12 год, в подальшому залежно від концентрації гормону росту в крові, клінічних симптомів та переносимості препарату. У більшості хворих добова доза становить 0,2-0,3 мг. Максимальна доза – 1,5 мг/добу. Якщо протягом трьох місяців лікування відсутня позитивна динаміка, лікування слід припинити.

Для *профілактики ускладнень після операцій на підшлунковій залозі* першу дозу 0,1 мг вводять підшкірно за 1 год до лапаротомії; потім після операції вводять підшкірно по 0,1 мг 3 рази на добу

протягом 7 наступних днів.

Для зупинки кровотечі з варикозно розширених вен стравоходу вводять внутрішньовенно у дозі 0,025 мг за годину у вигляді тривалих інфузій протягом 5 днів. У хворих літнього віку немає необхідності знижувати дози октреотиду. 0,025 мг препарату розводять в 200 мл ізотонічного розчину натрію хлориду.

При рефрактерній діарейі у хворих на СНІД вводять підшкірно в початковій дозі 0,1 мг 3 рази на добу. Якщо після 1 тижня лікування симптоми не зникають, дозу підвищують до 0,25 мг 3 рази на добу.

При ендокринних пухлинах травного тракту і підшлункової залози вводять підшкірно в початковій дозі 0,05 мг 1 - 2 рази на добу. Далі, залежно від клінічного ефекту (дослідження гормонів, що продукуються пухлиною), переносимості препарату дозу можна поступово підвищити до 0,1 - 0,2 мг 3 рази на добу. В особливих випадках можуть знадобитися вищі дози. Підтримуючу дозу встановлюють індивідуально.

Побічна дія.

З боку ШКТ, підшлункової залози, печінки і жовчного міхура: можливі - анорексія, нудота, блювання, спастичні болі в животі, відчуття здуття живота, надлишкове газоутворення, діарея і стеаторея. Хоча виділення жиру з калом може зростати, немає вказівок на те, що тривале лікування октреотидом може призводити до розвитку порушень усмоктування (мальабсорбція). У поодиноких випадках можуть відзначатися явища, що нагадують гостру кишкову непрохідність.

Відомі окремі випадки гострого гепатиту без холестазу, а також гіпербілірубінемії у поєднанні зі збільшенням активності лужної фосфатази, гама-глутамілтрансферази та, меншою мірою, інших трансаміназ.

Тривале використання препарату може призводити до утворення конкрементів у жовчному міхурі.

Є повідомлення про поодинокі випадки гострого панкреатиту, що розвивався у перші години або дні застосування і минав після відміни октреотиду.

З боку серцево-судинної системи: в окремих випадках - аритмія, брадикардія.

З боку вуглеводного обміну: можливе порушення толерантності до глюкози після прийому їжі (обумовлено пригніченням препаратом секреції інсуліну), гіпоглікемія; у поодиноких випадках при тривалому лікуванні можливий розвиток персистуючої гіперглікемії.

Місцеві реакції: у місці ін'єкції можливі біль, відчуття свербіжжю або печіння, почервоніння і припухлість (такі явища зазвичай минають протягом 15 хв).

Інші: алергійні реакції, алопеція.

Протипоказання. Підвищена чутливість до компонентів препарату.

Передозування. Можливі такі симптоми: короткочасне зниження ЧСС, почуття припливу, спастичний біль в животі, діарея, нудота, відчуття порожнечі в шлунку.

Лікування симптоматичне.

Особливості застосування. Октрайд треба застосовувати з обережністю у пацієнтів, які страждають на жовчнокам'яну хворобу та цукровий діабет.

У хворих на цукровий діабет, які одержують інсулін, Октрайд може знижувати потребу в інсуліні.

Якщо камені в жовчному міхурі виявлені перед початком лікування, питання про застосування Октрайду вирішується індивідуально залежно від співвідношення потенційного лікувального ефекту препарату і можливих факторів ризику, пов'язаних з наявністю каменів у жовчному міхурі.

Побічні ефекти з боку ШКТ можуть бути зменшені, якщо ін'єкції Октрайду робити в проміжках між прийомами їжі або перед сном.

У хворих з інсуліномами на фоні лікування Октрайдом може відмічатися збільшення вираженості і тривалості гіпоглікемії (це пов'язано з більш вираженим пригнічуючим впливом на секрецію гормону росту і глюкагону, ніж на секрецію інсуліну, а також з меншою тривалістю інгібуючого впливу на секрецію інсуліну). За такими хворими слід уважно спостерігати на початку лікування Октрайдом, а

також при кожній зміні дози препарату. Істотні коливання концентрації глюкози в крові можна спробувати знизити шляхом частішого введення Октрайду.

Під час кровотеч із варикозно розширених вен стравоходу у хворих на цироз печінки підвищений ризик розвитку інсулінзалежного цукрового діабету, а також можливі зміни потреби в інсуліні у хворих на цукровий діабет, тому у цих випадках необхідний систематичний контроль концентрації глюкози в крові.

Для зменшення явищ дискомфорту в місці ін'єкції рекомендується доводити розчин препарату перед введенням до кімнатної температури і вводити менший обсяг препарату. Варто уникати декількох ін'єкцій у те саме місце через короткі проміжки часу.

Вагітність та лактація. Адекватних і контрольованих досліджень у людини не проводилося. Застосування під час вагітності й у період лактації тільки за абсолютними показниками, з урахуванням співвідношення ризик/користь, тобто коли передбачувана користь для матері перевищує передбачуваний ризик для плода. Категорія дії на плід Б за FDA.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами. Октрайд зменшує всмоктування циклоспорину та уповільнює всмоктування циметидину.

Необхідне коригування доз одночасно застосовуваних сечогінних засобів, адреноблокаторів, антагоністів кальцію, інсуліну, пероральних гіпоглікемічних препаратів.

При одночасному застосуванні Октрайду і бромкриптину біодоступність останнього підвищується. Препарати, що метаболізуються ферментами системи цитохрому P₄₅₀ і мають вузький терапевтичний діапазон доз, слід призначати з обережністю.

Умови та термін зберігання. Зберігати в недоступному для дітей, захищеному від світла місці, при температурі від 2 С до 8 С. Не заморожувати!

Термін придатності – 2 роки.

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка. По 1 мл в ампулі, кожна ампула в контурній пластиковій упаковці та в картонній коробці.

Виробник. САН ФАРМАСЬЮТИКАЛ ІНДАСТРІЗ ЛТД.

Адреса. Офіс. Acme Plaza, Andheri East, Mumbai 400059, India.

Завод. Halol-Baroda Highway, Halol-389 350, Gujarat, India.