

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
ТРАНЕСТАТ
(TRANESTAT)

Склад:

діюча речовина: 1 таблетка, вкрита оболонкою, містить транексамової кислоти 500 мг;

допоміжні речовини: натрію крохмальгліколят (тип А), кальцію фосфат, повідон 30, кросповідон, магнію стеарат, тальк, кремнію діоксид колоїдний безводний, плівкове покриття «Опадрі білий» YL28900 (гіпромелоза, лактоза моногідрат, титану діоксид (E 171), поліетиленгліколь).

Лікарська форма Таблетки вкриті оболонкою.

Фармакотерапевтична група.

Інгібітори фібринолізу.

Код АТС B02A A02.

Клінічні характеристики.

Показання.

Кровотеча або ризик кровотечі при посиленні фібринолізу, як генералізованого (кровотеча під час операції і в післяопераційному періоді на передміхуровій залозі, геморагічні ускладнення фібринолітичної терапії), так і місцевого (маткова, шлунково-кишкова кровотеча, кровотеча після простатектомії, тонзилектомії, конізації шийки матки, екстракції зуба у хворих на гемофілію).

Протипоказання.

Підвищена чутливість до транексамової кислоти та до компонентів, які входять до складу препарату, тяжка ниркова недостатність, макроскопічна гематурія, високий ризик тромбоутворення, тромбофлебіт, інфаркт міокарда, субарахноїдальний крововилив.

Спосіб застосування та дози.

Дорослим препарат призначають внутрішньо незалежно від прийому їжі.

Місцевий фібриноліз: рекомендована доза-14,5 г 2-3 рази на добу.

Простатектомія: для профілактики і лікування геморагій у пацієнтів з підвищеним ризиком перед або після операцій транексамову кислоту призначають у вигляді ін'єкцій, після чого призначають у вигляді таблеток по 1 г (2 таблетки по 500 мг) 3-4 рази на добу до зникнення макроскопічної гематурії.

Менорагія: рекомендована доза становить 2 таблетки 3 рази на добу, не більше 4 днів. При тривалій менструальній кровотечі дозу збільшують, але не вище максимальної дози (8 таблеток на добу).

Не потрібно розпочинати лікування препаратом до початку менструальної кровотечі.

Носові кровотечі: при періодичних кровотечах призначають по 2 таблетки 3 рази на добу протягом 7 днів.

Конізація шийки матки: призначають по 3 таблетки 3 рази на добу тривалістю до 12 днів.

Посттравматична гефема: 2 таблетки 3 рази на добу.

Екстракція зубів у пацієнтів з гемофілією: рекомендована доза становить 25 мг/кг транексамової кислоти внутрішньо через кожні 8 годин, починаючи за 1 день до операції і продовжуючи протягом 2-8 днів після неї.

Спадковий ангіоневротичний набряк: деяким пацієнтам, обізнаним про перебіг загострень хвороби, зазвичай достатньо 2-3 таблетки 2-3 рази на добу протягом кількох днів. Іншим пацієнтам слід приймати препарат у тій же дозі протягом тривалого часу залежно від перебігу захворювання.

Порушення видільної функції нирок: необхідна корекція дози для пацієнтів з легкою та помірною нирковою недостатністю.

Діти: призначають дітям старше 12 років у дозі 20-25 мг/кг. Тривалість лікування зазвичай становить 2-8 днів.

Пацієнти літнього віку: у випадку відсутності порушень видільної функції нирок корекція дози не потрібна.

Пацієнти з нирковою недостатністю: необхідно коригувати дозу згідно з рівнем креатиніну плазми.

Креатинін плазми	Дозування
120-250 мкмоль/л	15 мг/кг 2 рази на день
250-500 мкмоль/л	15 мг/кг 1 раз на день

Побічні реакції.

Нудота, блювання, діарея, біль у животі, зниження апетиту, запаморочення, алергічні реакції (найчастіше у вигляді шкірних висипань, кропив'янки, свербіж), дуже рідко можливі тромбози, тромбоемболії, порушення сприйняття кольорового зображення, застійна ретинопатія.

Передозування.

Симптоми: нудота, блювання, біль у животі, ортостатична гіпотензія.

Лікування: застосування симптоматичної терапії.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Транексамова кислота проникає через плаценту та в грудне молоко. Дослідження щодо безпеки застосування препарату під час вагітності не проводилися, тому в цей період призначати препарат можна лише тоді, коли очікувана користь для матері перевищує потенційний ризик для плода. У разі необхідності застосування препарату слід вирішити питання про припинення годування груддю.

Діти.

Не застосовують дітям віком до 12 років.

Особливості застосування.

При нирковій недостатності (залежно від ступеня підвищення креатиніну сироватки) зменшують дозу і кількість введень. Повідомлялося про сечоподібну закупорку через утворення згустку із джерелом кровотечі у верхніх сечових шляхах у пацієнтів, що приймали препарат. Повідомлялося про випадки венозного й артеріального тромбозу чи тромбоемболії у пацієнтів, які приймали транексамову кислоту. Крім того, повідомлялося про випадки закупорки центральної артерії сітківки і центральної ретинальної вени.

Пацієнтам, які приймають препарат довше кількох днів, рекомендується пройти офтальмологічний огляд, включаючи гостроту зору, кольоровий зір, очне дно, поле зору.

Пацієнти із тромбоемболічною хворобою можуть знаходитись у групі підвищеного ризику для венозних чи артеріальних тромбозів.

Транексамову кислоту не слід приймати одночасно з ФакторІх комплексом або антиінгібіторними коагуляційними комплексами, оскільки може бути збільшений ризик утворення тромбозів.

Пацієнтам із розсіяною внутрішньосудинною коагуляцією, яким необхідне лікування транексамовою кислотою, необхідно знаходитися під спостереженням лікаря, що має досвід у лікуванні таких захворювань.

Транексамова кислота була виявлена у спермі у фібринолітичній концентрації, але не впливає на рухомість сперматозоїдів. Клінічні дослідження не виявили впливу на фертильність.

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

Під час застосування препарату слід утриматись від керування автотранспортом або роботи зі складними механізмами.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Транексамова кислота несумісна з урокіназою, норадреналіном бітартратам, дезоксиепінефрином гідрохлоридом, метарміном бітартратам, дипіридамолом, діазепамом. Високоактивні протромбінові комплекси і антифібринолітичні агенти, антиінгібіторні коагуляційні комплекси не слід застосовувати одночасно з транексамовою кислотою. Необхідно уникати комбінації хлорпромазину і транексамової кислоти у пацієнтів із субарахноїдальним крововиливом; це може призводити до спазму мозкових судин і церебральної ішемії і, можливо, до зниження церебрального потоку крові; симптоматичні властивості обох препаратів, можливо, сприяють розвитку спазму судин і церебральної ішемії у цих пацієнтів.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Препарат специфічно інгібує дію активатора плазміну та плазміногену, чинить гемостатичну дію при кровотечах, пов'язаних із підвищенням фібринолізу, а також протиалергенною та протизапальною дією за рахунок пригнічення утворень хінінів та інших активних пептидів, що беруть участь в алергічних та запальних реакціях.

Антифібринолітичний, протиалергійний, протизапальний засіб. Конкурентно інгібує активатор плазміногену, у вищих концентраціях зв'язує плазмін. Подовжує протромбіновий час. Пригнічує утворення кінінів та інших пептидів, що беруть участь у запальних та алергійних реакціях. При прийманні внутрішньо всмоктується 30-50 % дози.

C_{max} досягається за 3 години після прийому та становить при дозуванні 1 і 2 г відповідно 8 та 15 мг/л. Крива «концентрація – час» має трифазову форму з $T_{1/2}$ у термінальній фазі 2 години. У крові приблизно 3 % зв'язано з білком (плазміногеном). Початковий об'єм розподілу – 9-12 л.

Легко проходить крізь гістогематичні бар'єри, включаючи ГЕБ, плацентарний. Концентрація у цереброспінальній рідині становить 1/10 від плазмової. Виявляється у сім'яній рідині, де інгібує фібринолітичну активність, але не впливає на міграцію сперматозоїдів. Незначна частина зазнає біотрансформації. Основний шлях екскреції – гломерулярна фільтрація. Понад 95 % (переважно у незміненому вигляді) екскретується із сечею. Загальний нирковий \dot{C} дорівнює плазмовому.

Антифібринолітична концентрація у різних тканинах зберігається протягом 17 годин, у плазмі – до 7-8 годин.

Фармакокінетика.

Транексамова кислота швидко проникає в синовіальну рідину і синовіальну оболонку. У синовіальній рідині отримана та ж концентрація, що і в сироватці. Період напіввиведення транексамової кислоти становить близько 3 годин. Концентрація транексамової кислоти в крові нижча, ніж в інших тканинах. У грудному молоці концентрація становить близько 1/100 пікової концентрації в сироватці. Концентрація транексамової кислоти в цереброспінальній рідині становить близько 1/10 від плазмової. Препарат проникає у внутрішньоочну рідину, концентрація становить близько 1/10 відплазмової.

Виведення. Період напіврозпаду та виведення становить приблизно 2 години. Виводиться нирками, переважно у незміненому вигляді.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості: таблетки двоопуклі, вкриті оболонкою білого кольору.

Термін придатності.

4 роки.

Умови зберігання.

Зберігати в сухому, захищеному від світла недоступному для дітей місці при температурі від 15 до 30 °С.

Упаковка.

10 таблеток, вкритих оболонкою, у блістері. № 20 (10x2) у пачці.

Категорія відпуску.

За рецептом.

Виробник.

Амоун Фармасьютикал Ко.

Місцезнаходження.

Ель-Обур Сіті, Каїр, Єгипет El-Obour City, Cairo, Egypt