

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату

ТРОПІСЕТРОН
(TROPISETRON)

Склад:

діюча речовина: 1 капсула містить тропісетрону гідрохлориду, в перерахуванні на 100 % речовину, 5 мг;
допоміжні речовини: лактози моногідрат, крохмаль кукурудзяний, кремнію діоксид колоїдний безводний (аеросил), магнію стеарат;
склад капсули: азорубін, кармоїзин (Е 122), заліза оксиди (Е 172), титану діоксид (Е 171), желатин.

Лікарська форма. Капсули.

Фармакотерапевтична група. Протиблювотні засоби та препарати, що усувають нудоту.
Код АТС А04А А03.

Клінічні характеристики.

Показання. Профілактика нудоти та блювання при проведенні протипухлинної хіміотерапії та в післяопераційному періоді (профілактика та лікування).

Противпоказання. Гіперчутливість до тропісетрону, інших антагоністів 5-НТЗ-рецепторів або до будь-якого іншого компонента препарату.

Спосіб застосування та дози. Застосовують внутрішньо. Тропісетрон призначають курсами по 5 днів.

Дорослі. Добова доза для дорослих становить 5 мг. Капсули призначають з 2-го по 6-й день лікування після попереднього внутрішньовенного краплинного або струминного введення ін'єкційного розчину препарату, який вводять у перший день лікування (використовується розчин для ін'єкцій).

Капсули треба приймати вранці, безпосередньо після пробудження або за годину до сніданку, запиваючи водою.

Тривалість дії Тропісетрону становить 24 години, що дозволяє застосовувати його один раз на добу. Призначення препарату протягом множинних циклів хіміотерапії не впливає на його ефективність.

У осіб зі зниженою швидкістю метаболізму зменшення стандартної добової дози не вимагається.

Широкий терапевтичний індекс Тропісетрону обумовлює відсутність необхідності в зміні дози у хворих літнього віку, в осіб з порушенням функцій печінки або нирок.

Діти. Дітям старше 4-х років Тропісетрон застосовують з метою запобігання нудоті і блюванню, що виникають внаслідок протипухлинної хіміотерапії. Рекомендована доза становить 0,2 мг/кг маси тіла, максимальна доза – до 5 мг на добу. Схема лікування наступна: після попереднього внутрішньовенного краплинного або струминного введення ін'єкційного розчину препарату, який вводять у перший день застосування протипухлинної хіміотерапії (використовується розчин для ін'єкцій), у наступні дні (2-6-й) препарат приймають внутрішньо в капсулах (вміст капсули змішують з апельсиновим соком або з напєм типу коли). Тропісетрон слід приймати зранку, за 1 годину до сніданку.

Побічні реакції. Можливі побічні реакції:

- з боку ЦНС: головний біль, інколи спостерігається запаморочення, почуття втоми, сонливість;

- з боку травного тракту: інколи відмічаються запори, рідше – біль у животі, діарея, анорексія;

- алергічні реакції: в рідкісних випадках відмічаються реакції гіперчутливості негайного типу (почервоніння обличчя, поширена кропив'янка, відчуття нестачі повітря, задишка, відчуття дискомфорту у грудній клітці, гострий бронхоспазм), дуже рідко – висипання, еритема, анафілактичні реакції/шок;

- з боку серцево-судинної системи: в дуже рідкісних випадках – колапс, артеріальна гіпотензія, зупинка серцевої діяльності, непритомність, але точного взаємозв'язку з Тропісетроном не встановлено. Деякі з побічних ефектів можуть бути обумовлені одночасно проведеною хіміотерапією або основним захворюванням.

При застосуванні препарату в рекомендованих дозах побічні ефекти носять мимолітний характер.

Передозування. При повторному прийомі дуже великих доз можливі такі симптоми: зорові галюцинації, підвищення артеріального тиску (у хворих з артеріальною гіпертензією).

Лікування симптоматичне, показаний моніторинг життєво важливих функцій та спостереження за станом хворого.

Застосування у період вагітності або годування груддю. Не слід застосовувати в період вагітності. При необхідності застосування Тропісетрону необхідно відмінити годування груддю.

Діти. Застосовують дітям старше 4 років з метою запобігання нудоті і блюванню, що виникають внаслідок протипухлинної хіміотерапії.

Особливості застосування. Хворим із неконтрольованою артеріальною гіпертензією потрібно уникати призначення добових доз Тропісетрону, що перевищують 10 мг. Необхідно дотримуватися обережності при одночасному застосуванні Тропісетрону і засобів для наркозу у пацієнтів з порушеннями серцевого ритму і провідності, а також у пацієнтів, яким проводилося лікування антиаритмічними препаратами або –адреноблокаторами, у зв'язку з відсутністю досвіду їх спільного застосування.

Необхідності корекції дози для пацієнтів літнього віку немає.

Тропісетрон слід застосовувати з обережністю пацієнтам зі спадковою непереносимістю галактози, дефіцитом лактази або синдромом мальабсорбції глюкози/галактози.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами. Не вивчалась. Однак деякі побічні дії препарату, такі як запаморочення та відчуття втоми, можуть негативно впливати на здатність керувати автотранспортом і виконувати потенційно небезпечні види діяльності, що вимагають підвищеної концентрації уваги та швидкості психомоторних реакцій.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій. Рифампіцин, фенобарбітал та інші препарати, які індукують активність ферментів печінки, знижують концентрацію Тропісетрону в плазмі крові, що може призвести до необхідності збільшення дози у осіб з активним метаболізмом, тоді як при зниженій швидкості метаболізму цього не вимагається.

Препарати, що інгібують мікросомальні ферменти печінки, не мають суттєвого впливу на концентрацію Тропісетрону в плазмі крові.

Терапевтична ефективність препарату посилюється дексаметазоном.

Слід проявляти обережність при застосуванні препарату з іншими лікарськими препаратами, які можуть збільшувати інтервал QTc.

Прийом разом з їжею може дещо збільшити біодоступність Тропісетрону, що клінічного значення не має.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Тропісетрон являє собою високоактивний селективний конкурентний антагоніст периферичних та центральних серотонінових 5-НТЗ-рецепторів. Блокуючи ці рецептори, Тропісетрон запобігає появі блювотного рефлексу, що спричиняється прийманням хіміотерапевтичних протипухлинних препаратів, які стимулюють викид серотоніну з ентохромафінних клітин слизової оболонки травного тракту. Окрім того, Тропісетрон пригнічує центральні ланки блювотного рефлексу, блокуючи 5-НТЗ-рецептори в ЦНС, зокрема *varea postrema* (дно IV шлуночка).

Фармакокінетика. Після прийому внутрішньо препарат більше ніж на 95 % всмоктується із травного тракту (період напівабсорбції в середньому становить приблизно 20 хв). Максимальна концентрація в крові досягається протягом 3 годин. Абсолютна біодоступність залежить від дози та досягає приблизно 60 % після прийому 5 мг, зростаючи до 100 % після прийому 45 мг.

Зв'язування з білками плазми становить 71 %, об'єм розподілу – 7,9 л/кг.

Препарат метаболізується в печінці шляхом гідроксилювання з наступною кон'югацією з глюкуроновою або сірчаною кислотами та виводиться із сечею або з жовчю.

У осіб з непорушеним метаболізмом період напіввиведення Тропісетрону становить 8 годин, у осіб з низькою швидкістю метаболізму період напіввиведення може збільшуватися до 43 годин. Загальний кліренс Тропісетрону становить приблизно 1 л/хв, майже 10 % припадає на нирковий кліренс. Виводиться з організму повільно.

У хворих з порушеним метаболізмом загальний кліренс знижений до 0,1-0,2 л/хв при незміненому нирковому кліренсі.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості: тверді желатинові капсули, корпус світло-рожевого кольору, кришка коричневого кольору. Вміст капсул – порошок білого або майже білого кольору, без запаху.

Термін придатності. 5 років.

Умови зберігання. Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С. Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка. По 5 капсул у блістері, 1 блістер у паці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. ПАТ «Київмедпрепарат».

Місцезнаходження. Україна, 01032, м. Київ, вул. Саксаганського, 139.