ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

ТРАНЕКСАМОВА КИСЛОТА-ЗДОРОВ'Я

(TRANEXAMIC ACID-ZDOROVYE)

Склад:

діюча речовина: tranexamic acid;

1 таблетка містить транексамової кислоти 500 мг;

допоміжні речовини: целюлоза мікрокристалічна, повідон, кремнію діоксид колоїдний безводний, тальк, магнію стеарат, кросповідон, суха суміш «Opadry white», що містить титану діоксид (Е 171), гіпромелозу, триацетин.

Лікарська форма. Таблетки, вкриті плівковою оболонкою.

Основні фізико-хімічні властивості: таблетки, вкриті плівковою оболонкою, білого або майже білого кольору, овальної форми, з рискою з однієї сторони.

Фармакотерапевтична група. Антигеморагічні засоби, антифібринолітичні амінокислоти. Інгібітори фібринолізу. Код АТХ В02А А02.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Антифібринолітичний засіб. Транексамова кислота специфічно інгібує активацію профібринолізину (плазміногену) та його перетворення на фібринолізин (плазмін). Чинить місцеву та системну гемостатичну дію при кровотечах, пов'язаних із підвищенням фібринолізу (патологія тромбоцитів, менорагії). Також транексамова кислота через стримування утворення кінінів та інших активних пептидів, що беруть участь в алергічних та запальних реакціях, чинить протиалергічну та протизапальну дію.

Фармакокінетика.

Абсорбція при пероральному застосуванні доз у діапазоні 0,5–2 г становить 30–50 %. T_{Cmax} при застосуванні внутрішньо 0,5 г, 1 г та 2 г – 3 години, C_{max} – 5, 8 та 15 мкг/мл відповідно. Зв'язок з білками плазми крові (профібринолізином) – не менше 3 %.

Розподіляється у тканинах відносно рівномірно (за винятком спинномозкової рідини, де концентрація становить 1/10 від плазмової); проникає крізь плацентарний бар'єр, у грудне

молоко (близько 1 % концентрації у плазмі матері). Виявляється у сім'яній рідині, де знижує фібринолітичну активність, але не впливає на міграцію сперматозоїдів. Початковий об'єм розподілу – 9–12 л. Антифібринолітична концентрація у різних тканинах зберігається 17 годин, у плазмі – до 7–8 годин.

Метаболізується незначна частина. Крива AUC має трифазну форму з $T_{1/2}$ у кінцевій фазі 3 години. Загальний нирковий кліренс дорівнює плазмовому (7 л/год). Виводиться нирками (основний шлях – гломерулярна фільтрація), близько 95 % – у незміненому вигляді протягом перших 12 годин.

Ідентифіковано два метаболіти транексамової кислоти: N-ацетильовану та дезаміновану похідні. При порушенні функції нирок існує ризик кумуляції транексамової кислоти.

Клінічні характеристики.

Показання.

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

Спадковий ангіоневротичний набряк.

Протипоказання.

Гіперчутливість до транексамової кислоти або до інших компонентів препарату, ниркова недостатність тяжкого ступеня (через ризик кумуляції), макроскопічна гематурія, гострі тромбоемболічні захворювання, гострий венозний або артеріальний тромбоз, тромбофлебіт, артеріальні або венозні тромбози в анамнезі, високий ризик тромбоутворення, інфаркт міокарда, субарахноїдальний крововилив, судоми в анамнезі; фібринолітичні стани внаслідок коагулопатії споживання, за винятком надмірної активації фібринолітичної системи при гострій тяжкій кровотечі; порушення сприйняття кольорів.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Транексамова кислота несумісна з урокіназою, норадреналіну бітартратом, дезоксіепінефрину гідрохлоридом, метарміну бітартратом, дипіридамолом, діазепамом. Високоактивні протромбінові комплекси та антифібринолітичні агенти, антиінгібіторні коагуляційні комплекси не слід застосовувати одночасно з транексамовою кислотою. Необхідно уникати застосування комбінації хлорпромазину і транексамової кислоти пацієнтам 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. З обережністю слід застосовувати транексамову кислоту пацієнтам, які приймають пероральні контрацептиви, оскільки підвищується ризик тромбозів.

Особливості застосування.

При нирковій недостатності (залежно від ступеня підвищення креатиніну сироватки крові) необхідно зменшувати дозу і кількість введень.

У разі виникнення гематурії ниркового походження (особливо при гемофілії) зростає ризик механічної анурії внаслідок утворення згустку крові у сечовивідних шляхах.

Повідомляли про випадки закупорки центральної артерії сітківки і центральної ретинальної вени. Пацієнтам, які приймають препарат довше кількох днів, рекомендується пройти офтальмологічний огляд, включаючи перевірку гостроти зору, сприйняття кольорів, очного дна, поля зору, та оцінити функцію печінки.

Пацієнтам з порушенням зору необхідно припинити лікування.

До встановлення причини порушення менструального циклу не можна застосовувати цей лікарський засіб. Якщо менструальну кровотечу не вдалося зменшити за допомогою транексамової кислоти, необхідно розглянути альтернативне лікування.

Необхідно з обережністю застосовувати транексамову кислоту пацієнтам, які приймають пероральні контрацептиви, через підвищений ризик розвитку тромбозу.

Повідомляли про випадки венозного та артеріального тромбозу або тромбоемболії у пацієнтів, які приймали транексамову кислоту. Пацієнти з попередніми тромбоемболічними ускладненнями та тромбоемболічними захворюваннями у сімейному анамнезі (пацієнти з тромбофілією) повинні застосовувати лікарський засіб тільки за наявністю чітких медичних показань та під суворим наглядом лікаря.

Не рекомендується застосування транексамової кислоти у разі підвищеного фібринолізу внаслідок дисемінованого внутрішньосудинного згортання крові.

Пацієнти із розсіяною внутрішньосудинною коагуляцією, яким необхідне лікування транексамовою кислотою, повинні знаходитися під спостереженням лікаря, який має досвід лікування таких захворювань.

Клінічного досвіду застосування транексамової кислоти дітям віком до 15 років з менорагією немає, тому не слід застосовувати лікарський засіб даній категорії пацієнтів.

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

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

При застосуванні транексамової кислоти повідомляли про випадки судом. Більшість із цих випадків були зареєстровані після внутрішньовенного застосування транексамової кислоти у високих дозах при проведенні аортокоронарного шунтування (АКШ). При застосуванні рекомендованих низьких доз транексамової кислоти частота виникнення випадків судом після операцій така ж, як у пацієнтів, які не отримували транексамову кислоту.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Транексамова кислота проникає через плаценту та в грудне молоко. Дослідження щодо безпеки застосування препарату у період вагітності не проводили, тому вагітним призначати препарат можна лише тоді, коли очікувана користь для жінки перевищує потенційний ризик для плода.

У разі необхідності застосування препарату слід вирішити питання про припинення годування груддю.

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

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

Спосіб застосування та дози.

Препарат застосовувати перорально. Прийом препарату не залежить від прийому їжі.

Дорослі пацієнти з нормальною функцією нирок.

Стосовно дозування слід дотримуватись нижчезазначених рекомендацій для дорослих пацієнтів з нормальною функцією нирок, у яких кліренс креатиніну становить понад 50 мл/хвилину.

Показання	Разова доза	Кількість прийомів на добу	Тривалість лікування	Примітки
Місцевий фібриноліз	1–1,5 г	2–3 рази	3–15 днів	
Простатектомія	1 г	3–4 рази	До зникнення макроскопічної гематурії	Для профілактики і лікування геморагій у пацієнтів з підвищеним ризиком їх виникнення застосовувати до або після операції у вигляді ін’єкцій, після чого призначати у вигляді таблеток.
Менорагія	1 г	3 рази	До 4 днів	При тривалій менструальній кровотечі дозу збільшувати, але не вище максимальної дози (4 г на добу). Не потрібно розпочинати лікування препаратом до початку менструальної кровотечі.
Носові кровотечі	1 г	3 рази	7 днів	Застосовувати при періодичних носових кровотечах

Конізація шийки матки	1,5 г	3 рази	до 12 днів	
Посттравматична гіфема	1 г	3 рази	3–15 днів	
Спадковий ангіоневротичний набряк	1–1,5 г	2–3 рази	Залежно від перебігу захворювання	
Екстракція зубів у пацієнтів із гемофілією	25 мг/кг	Кожні 8 годин	3–10 днів	Застосовувати за 1 день до операції і продовжувати протягом 2–8 днів після неї

Пацієнти літнього віку.

У разі відсутності порушень видільної функції нирок корекція дози не потрібна.

Діти.

Призначати дітям віком від 12 років у дозі 20–25 мг/кг. Тривалість лікування зазвичай становить 2–8 днів.

Пацієнти з нирковою недостатністю.

Необхідно коригувати дозу згідно з рівнем креатиніну плазми крові.

Креатинін плазми крові	Дозування
120–249 мкмоль/л	15 мг/кг 2 рази на добу
250–500 мкмоль/л	15 мг/кг 1 раз на добу

Діти. Не застосовувати дітям віком до 12 років.

Клінічного досвіду застосування транексамової кислоти дітям віком до 15 років з менорагією немає, тому не слід застосовувати цей лікарський засіб даній категорії пацієнтів.

Передозування.

Симптоми: нудота, блювання, біль у животі, ортостатична гіпотензія, артеріальна гіпотензія, запаморочення, головний біль, судоми або посилення проявів інших побічних реакцій, у тому числі ризик тромбозу.

Лікування: викликати блювання, промити шлунок, прийняти активоване вугілля. Необхідним є вживання великої кількості рідини для сприяння нирковій екскреції. Застосовувати симптоматичне лікування та у разі необхідності – антикоагулянтну терапію.

Побічні реакції.

З боку імунної системи: реакції гіперчутливості, включаючи анафілаксію.

З боку травної системи: нудота, блювання, печія, діарея, біль у животі, зниження апетиту.

З боку шкіри та підшкірної клітковини: висип, свербіж, алергічні шкірні реакції.

З боку нервової системи: сонливість, запаморочення, судоми.

З боку органів зору: порушення зору, порушення кольоросприйняття, оклюзія артерії сітківки, застійна ретинопатія.

З боку судин: тромбоемболічні ускладнення, артеріальний або венозний тромбоз будь-якої локалізації, артеріальна гіпотензія.

З боку нирок: гострий некроз коркового шару нирок.

Термін придатності. 2 роки.

Умови зберігання. Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 ºС.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка. Таблетки № 20 (10×2) у блістерах у коробці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. ТОВАРИСТВО З ОБМЕЖЕНОЮ ВІДПОВІДАЛЬНІСТЮ «КОРПОРАЦІЯ «ЗДОРОВ'Я».

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.

Україна, 61013, Харківська обл., місто Харків, вулиця Шевченка, будинок 22.