

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

ТРЕНАКСА 250

ТРЕНАКСА 500

Склад:

діюча речовина: транексамова кислота;

1 таблетка містить транексамової кислоти 250 мг або 500 мг;

допоміжні речовини: целюлоза мікрокристалічна, повідон, натрію кроскармелоза, кремнію діоксид колоїдний безводний, тальк, магнію стеарат, титану діоксид (Е 171), гіпромелоза, пропіленгліколь, діетилфталат.

Лікарська форма. Таблетки, вкриті оболонкою.

Основні фізико-хімічні властивості:

таблетки 250 мг: круглі двоопуклі таблетки білого або майже білого кольору, вкриті оболонкою, гладенькі з обох боків;

таблетки 500 мг: круглі двоопуклі таблетки білого або майже білого кольору, вкриті оболонкою, гладенькі з одного боку та з розподільчою рискою – з іншого.

Фармакотерапевтична група.

Антигеморагічні засоби. Інгібітори фібринолізу.

Код АТХ В02А А02.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Антифібринолітичний засіб. Транексамова кислота специфічно інгібує активацію профібринолізину (плазміногену) та його перетворення на фібринолізин (плазмін). Має 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 – 30–50 %. $T_{\text{сmax}}$ 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 та у грудне молоко (близько 1 % від концентрації у плазмі матері). Виявляється у сім'яній рідині, де знижує фібринолітичну активність, але не впливає на міграцію сперматозоїдів. Початковий об'єм розподілення – 9–12 л. Антифібринолітична концентрація у різних тканинах зберігається 17 годин, у плазмі крові – 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 впродовж перших 12 годин.

Ідентифіковано 2 метаболіти транексамової кислоти: N-ацетильоване та дезаміноване 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 і в післяопераційному періоді на передміхуровій залозі, геморагічні ускладнення фібринолітичної терапії), так і місцевого (маткова, шлунково-кишкова, носова кровотеча, посттравматична гифема, кровотеча після простатектомії або втручанні на сечовому міхурі, тонзилектомії, конізації шийки матки, екстракції зуба у хворих на гемофілію).

Спадковий ангіоневротичний набряк.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до препарату або до інших компонентів препарату, тяжка ниркова недостатність, макроскопічна гематурія, високий ризик тромбоутворення, тромбофлебіт; активна тромбоемболічна хвороба, венозний або артеріальний тромбоз в анамнезі; інфаркт міокарда, субарахноїдальний крововилив, гострий венозний або артеріальний тромбоз; фібринолітичні стани після коагулопатії внаслідок виснаження, за винятком надмірної активації фібринолітичної системи при гострій тяжкій кровотечі; судоми в анамнезі; порушення сприйняття кольорів.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Транексамова кислота несумісна з урокіназою, норадреналіном бітартратам, дезоксиєпінефрином гідрохлоридом, метарміном бітартратам, дипіридамолом, діазепамом. Високоактивні протромбінові комплекси та 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. З обережністю застосовувати транексамову кислоту пацієнтам, які застосовують пероральні контрацептиви, оскільки підвищується ризик виникнення тромбозів.

Особливості застосування.

При нирковій недостатності (залежно від ступеня підвищення креатиніну сироватки крові) зменшувати дозу і кількість введень. У пацієнтів з порушеннями функції нирок концентрації препарату у плазмі крові є підвищеними. Тому таким пацієнтам рекомендується зменшувати дозу. Повідомляли про сечоподібну закупорку через утворення згустка із джерелом кровотечі у верхніх сечовивідних шляхах у пацієнтів, які застосовували препарат. Повідомляли про випадки венозного та артеріального тромбозу або тромбоемболії у пацієнтів, які застосовували транексамову кислоту. Крім того, повідомляли про випадки закупорки центральної артерії сітківки і центральної ретинальної вени. Пацієнтам, які застосовують препарат довше кількох днів, рекомендується пройти офтальмологічний огляд, включаючи перевірку гостроти зору, сприйняття кольорів, очного дна, поля зору, та провести контроль функції печінки.

Пацієнтам із порушеннями зору необхідно припинити лікування.

Пацієнти із тромбоемболічною хворобою можуть перебувати у групі підвищеного ризику для венозних або артеріальних тромбозів.

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

Не слід застосовувати препарат пацієнтам із розсіяною внутрішньосудинною коагуляцією.

Транексамову кислоту не слід застосовувати пацієнтам із підвищеним фібринолізмом, що виник внаслідок розсіяної внутрішньосудинної коагуляції.

Транексамова кислота була виявлена у спермі у фібринолітичній концентрації, але вона не впливає 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 аорто-коронарного шунтування (АКШ). При використанні рекомендованих низьких доз транексамової кислоти частота виникнення випадків судом після операцій така ж, як і у пацієнтів, які не отримували транексамову кислоту.

Пацієнткам із нерегулярними менструальними кровотечами не слід застосовувати транексамову кислоту до встановлення причини таких кровотеч. Якщо застосування

транексамової кислоти не зменшує інтенсивність менструальних кровотеч, слід розглянути можливість альтернативного лікування.

Пацієнтам із попередніми тромбоемболічними випадками та пацієнтам, які мають тромбоемболічні хвороби в сімейному анамнезі (пацієнти з тромбофілією), препарат слід застосовувати відповідно до суворих медичних показань під ретельним наглядом лікаря.

Клінічний досвід застосування транексамової кислоти для лікування менорагій у дітей віком до 15 років відсутній.

Повідомляли про випадки судом у поєднанні з лікуванням транексамовою кислотою. У кардіохірургії про більшість цих випадків повідомляли після внутрішньовенного введення транексамової кислоти у високих дозах.

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 в цей період призначати препарат можливо лише тоді, коли очікувана користь для матері перевищує потенційний ризик для плода або дитини. У разі необхідності застосування препарату у період лактації 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 складними механізмами.

Спосіб застосування та дози.

Дорослим препарат призначати внутрішньо незалежно від прийому їжі.

Місцевий фібриноліз: рекомендована доза – по 1-1,5 г 2-3 рази на добу.

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

Менорагія: рекомендована доза – по 1 г 3 рази на добу не більше 4 днів. При тривалій менструальній кровотечі дозу збільшувати, але не вище максимальної дози – 4 г на добу (8 таблеток по 500 мг). Не потрібно розпочинати лікування препаратом до початку менструальної кровотечі.

Носові кровотечі: по 1 г 3 рази на добу впродовж 7 днів.

Конізація шийки матки: по 500 мг 3 рази на добу тривалістю до 12 днів.

Посттравматична гефема: рекомендована доза препарату становить по 1 г 3 рази на добу внутрішньо.

Спадковий ангіоневротичний набряк: деякі пацієнти обізнані про перебіг загострень хвороби, їм зазвичай достатньо прийому по 1-1,5 г 2-3 рази на добу впродовж кількох днів. Іншим пацієнтам слід застосовувати препарат у тій же самій дозі впродовж тривалого часу залежно від перебігу захворювання.

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

Пацієнти з порушенням функції нирок.

Необхідна корекція дози для пацієнтів з легкою та помірною нирковою недостатністю згідно з рівнем креатиніну плазми крові.

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

Пацієнти літнього віку.

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

Дітям віком від 15 років препарат призначати в дозі 25 мг/кг маси тіла.

Тривалість лікування зазвичай становить 2-8 днів.

Діти.

Відсутній клінічний досвід застосування транексамової кислоти дітям та підліткам віком до 15 років.

Проте дані щодо дозування, ефективності та безпеки застосування за таких умов є обмеженими.

Передозування.

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

Лікування: ініціювати блювання, потім промивання шлунка та проводити терапію активованим вугіллям. Потрібно підтримувати високе споживання рідини, щоб сприяти виведенню препарату нирками. В осіб зі схильністю до тромбозів існує ризик розвитку тромбозів. Необхідно розглянути лікування антикоагулянтами.

Побічні реакції.

З боку травного тракту: нудота, блювання, печія, діарея, які зникають при зменшенні дози, зниження апетиту, біль у животі.

З боку шкіри та підшкірної клітковини: висип, свербіж, кропив'янка.

З боку нервової системи: сонливість, запаморочення, судоми, особливо при неправильному використанні.

З боку органів зору: порушення кольоросприйняття, порушення зору, судоми, застійна ретинопатія, оклюзія вен/артерій сітківки ока.

З боку імунної системи: реакції гіперчутливості, включаючи анафілаксію.

З боку судин: артеріальний або венозний тромбоз, тромбоемболія, артеріальна гіпотензія.

З боку нирок: гострий некроз коркового шару нирок.

Термін придатності.

2 роки.

Умови зберігання.

Зберігати при температурі не вище 25 °C в оригінальній упаковці.

Зберігати в недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 6 таблеток у стрипі, по 2 стрипи у картонній коробці.

Категорія відпуску.

За рецептом.

Виробник.

Маклеодс Фармасьютикалс Лімітед.

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

Фаза II, Плот № 12,15, 21, 23, 24, 25, 26, 27, 28, і 30, Сюрвей № 366, Прем'єр Індастріал Істейт, Качигам, Даман - 396210, Індія.