МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

МИНЗДРАВ РОССИИ
ЛП-003853-220916
СОГЛАСОВАНО

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

Санксамик

Регистрационный номер:

Торговое название препарата: Санксамик

Международное непатентованное название: транексамовая кислота

Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Состав на 1 таблетку:

Активное вещество: транексамовая кислота 250 мг / 500 мг.

Вспомогательные вещества (ядро): целлюлоза микрокристаллическая 28 мг/ 56 мг, повидон К-30 9,5 мг/ 19 мг, натрия кроскармеллоза 7,5 мг/ 15 мг, кремния оксид коллоидный 3,75 мг/ 7,5 мг, тальк очищенный 3,5 мг/ 7 мг, магния стеарат 3,75 мг/ 7,5 мг.

Вспомогательные вещества (оболочка): гипромеллоза 5,085 мг/ 10,17 мг, титана диоксид 1,95 мг/ 3,9 мг, пропиленгликоль 0,965 мг/ 1,93 мг, диэтилфталат 1 мг/ 2 мг.

Описание.

Для дозировки 250 мг. Круглые, двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой от белого до почти белого цвета. На поперечном разрезе – ядро от белого до почти белого цвета.

Для дозировки 500 мг. Круглые, двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой от белого до почти белого цвета. На поперечном разрезе – ядро от белого до почти белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа: гемостатическое средство.

Код АТХ: B02AA02.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика. Антифибринолитическое средство. Транексамовая кислота специфически ингибирует активацию профибринолизина (плазминогена) и его превращение в фибринолизин (плазмин). Обладает местным и системным гемостатическим действием при кровотечениях, связанных с повышением фибринолиза (патология тромбоцитов, меноррагии). Также транексамовая кислота, за счет подавления образования кининов и других активных пептидов, участвующих в аллергических и воспалительных реакциях, обладает противоаллергическим и противовоспалительным действием.

Фармакокинетика. Абсорбция при пероральном приеме доз в диапазоне 0,5-2 г – 30-50 %. Время достижения максимальной концентрации (T_{max}) при приеме внутрь 0,5, 1 и 2 г – 3 ч, уровень максимальной концентрации (C_{max}) – 5, 8 и 15 мкг/мл, соответственно. Связь с белками плазмы (профибринолизином) – менее 3 %.

Распределяется в тканях относительно равномерно (исключение – спинномозговая жидкость, где концентрация составляет 1/10 от плазменной); проникает через плацентарный барьер, в грудное молоко (около 1 % от концентрации в плазме матери). Обнаруживается в семенной жидкости, где снижает фибринолитическую активность, но не влияет на миграцию сперматозоидов. Начальный объем распределения – 9-12 л. Антифибринолитическая концентрация в различных тканях сохраняется 17 ч, в плазме – до 7-8 ч.

Метаболизируется незначительная часть. Кривая AUC имеет трехфазную форму с периодом полувыведения ($T_{1/2}$) в конечной фазе – 3 ч. Общий почечный клиренс равен плазменному (7 л/ч). Выводится почками (основной путь - гломерулярная фильтрация) – более 95 % в неизмененном виде в течение первых 12 ч.

Идентифицировано 2 метаболита транексамовой кислоты: N-ацетилированное и дезаминированное производные. При нарушенной функции почек существует риск кумуляции транексамовой кислоты.

Показания к применению

Профилактика и лечение кровотечений на фоне усиления генерализованного или местного фибринолиза у взрослых старше 18 лет. Местный фибринолиз может встречаться в следующих случаях:

- простатэктомия или другие хирургические вмешательства на органах мочевыводящей системы;
- гематурия;
- меноррагии;
- носовые кровотечения;
- маточные кровотечения, в том числе на фоне болезни Виллебранда и других коагулопатий;
- операция конизации шейки матки;
- травматическая гифема;
- экстракция зубов у пациентов с коагулопатией;
- желудочно-кишечные кровотечения (язвенный колит).

Генерализованный фибринолиз может встречаться в следующих случаях:

- злокачественные новообразования поджелудочной и предстательной желез;

- акушерские осложнения (кровотечения, отслойка плаценты, послеродовые кровотечения);

- ручное отделение последа;

- операции на органах грудной клетки и другие обширные хирургические вмешательства;

- лейкемия и заболевания печени при назначении тромболитической терапии стрептокиназой.

Наследственный ангионевротический отек.

Для снижения пери- и постоперационной кровопотери и при гемотрансфузии у взрослых пациентов, подвергшихся операции на сердце или тотальной артропластики коленного или бедренного суставов.

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к активному веществу или любому из вспомогательных веществ.
- Венозный или артериальный тромбоз в настоящее время или в анамнезе (тромбоз глубоких вен ног, тромбоэмболия легочной артерии, тромбоз внутричерепных сосудов и др.).
- Фибринолиз вследствие коагулопатии потребления, за исключением преимущественной активации фибринолитической системы при тяжелом остром кровотечении.
- Хроническая почечная недостаточность тяжелой степени (скорость клубочковой фильтрации [СКФ] менее 30 мг/мл/1,73 м^2) в связи с риском кумуляции.
- Судорожный синдром в анамнезе.
- Приобретенные нарушения цветового зрения. Если нарушение зрения возникло в течение курса лечения, препарат необходимо отменить.
- Субарахноидальное кровоизлияние.
- Детский возраст.

С осторожностью

- почечные нарушения из-за риска кумуляции;
- тяжелые кровотечения из верхнего отдела мочевыводящей системы из-за риска образования тромба и обструкции мочевого тракта;
- гематурия, вызванная заболеваниями почечной паренхимы, из-за риска развития механической анурии вследствие формирования тромба в мочеточнике; с массивными почечными кровотечениями из-за риска фиксации тромба в чашечно-лоханочной системе почки;

- тромбоэмболические осложнения в анамнезе и осложненный семейный анамнез по тромбоэмболии; транексамовую кислоту таким пациентам следует назначать по строгим медицинским показаниям и под строгим контролем врача из-за риска возникновения тромбоза центральных артерии и вены сетчатки;
- женщины, принимающие оральные контрацептивы, из-за риска тромбоза;
- принимающие Фактор IX комплекс или антиингибиторный антикоагулянтный комплекс из-за риска тромбоза;
- если имеет место скопление крови в плевральной полости, суставной полости, мочевом пузыре и чашечно-лоханочной системе почки из-за развития нерастворимого сгустка в этих полостях вследствие его резистентности к физиологическому фибринолизу;
- женщины с нерегулярными менструальными кровотечениями;
- верифицированный диагноз тромбофилии;
- пациенты, получающие терапию антикоагулянтами и гепарином;
- нарушения цветового зрения в анамнезе;
- внутрисосудистое диссеменированное свертывание (ДВС-синдром).

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

В доклинических исследованиях транексамовая кислота не оказывала тератогенного воздействия. Адекватные и строго контролируемые исследования эффективности и безопасности применения препаратов транексамовой кислоты у беременных не проводились. Транексамовая кислота проникает через плаценту и может содержаться в пуповинной крови в концентрации, близкой к материнской. Поскольку исследования репродуктивной функции у животных не всегда позволяют предсказать реакции у человека, транексамовую кислоту следует применять во время беременности только в случае крайней необходимости. Транексамовая кислота проникает в грудное молоко (концентрация препарата в молоке составляет около 1 % от концентрации в плазме крови матери). Развитие антифибринолитического эффекта у младенца маловероятно. Тем не менее, следует соблюдать осторожность при применении транексамовой кислоты у кормящих матерей.

Способ применения и дозы

Внутрь. Проглотить таблетку целиком, запивая водой.

При местном фибринолизе рекомендуемая стандартная доза для взрослых составляет 1000-1500 мг 2-3 раза в сутки (у взрослых рекомендуемая доза составляет 20-25 мг/кг массы тела в сутки).

При простатэктомии терапию назначают с внутривенного введения во время операции и в течение первых 3-х дней после операции с последующим переходом на пероральный

прием 1000-1500 мг 3-4 раза в сутки до макроскопического подтверждения отсутствия гематурии.

При гематурии назначают 1000-1500 мг 2-3 раза в сутки до макроскопического подтверждения отсутствия гематурии.

При меноррагиях назначают 1000-1500 мг 3-4 раза в сутки в течение 3-4 дней. Терапию транексамовой кислотой начинают, когда кровотечение приобретает характер профузного.

При кровотечении на фоне болезни Виллебранда и других коагулопатий назначают 1000-1500 мг 3-4 раза в сутки. Продолжительность курса лечения – 3-10 дней

При носовых кровотечениях назначают по 1000 мг 3 раза в сутки в течение 4-10 дней.

После операции конизации шейки матки назначают 1500 мг 3 раза в сутки в течение 12-14 дней.

При кровотечениях во время беременности назначают 250-500 мг 3-4 раза в сутки до полной остановки кровотечения. Средняя продолжительность курса лечения - 7 дней.

При травматической гифеме назначают 1000-1500 мг 3 раза в сутки.

Больным с коагулопатией после экстракции зуба назначают 25 мг/кг массы тела 3-4 раза в сутки в течение 6-8 дней.

При наследственном ангионевротическом отеке назначают 1000-1500 мг 2-3 раза в сутки в качестве постоянной или интермиттирующей терапии в зависимости от того, наблюдаются ли у пациента продромальные признаки ангионевротического отека.

При генерализованном фибринолизе терапию начинают с парентерального (внутривенного) введения с последующим переходом на пероральный прием по 1000-1500 мг 2-3 раза в сутки.

Нарушения функции почек

$T_{1/2}$ увеличивается, поэтому рекомендуется снижать дозу транексамовой кислоты.

У взрослых вСКФ (вычисленная скорость клубочковой фильтрации) ≥ 90 мл/мин/1,73 м^2 обычно указывает на нормальную функцию почек, но не исключает пациентов с начальными признаками нарушений функции почек. При подозрении на почечную недостаточность для выбора дозы могут быть использованы другие критерии оценки функции почек, включая консультацию нефролога. Пациентам с нарушениями функции почек рекомендуются следующие дозы:

Уровень креатинина в сыворотке крови, мкмоль/л	Пероральная доза	Частота
120 – 249	15 мг/кг	2 раза в сутки
250 – 500	15 мг/кг	1 раз в сутки
> 500	7,5 мг/кг	1 раз в сутки

Побочное действие

Определение частоты побочных реакций: очень часто (более 10 %); часто (от 1 до 10 %); редко (от 0,1 до 1 %); очень редко (менее 0,1 %).

Нарушения со стороны пищеварительной системы: часто – тошнота, рвота, диарея.

Нарушения со стороны кожи и кожных придатков: редко – кожные аллергические реакции.

Нарушения со стороны сердечно-сосудистой системы: редко – тромбоэмболия; очень редко – снижение артериального давления с или без потери сознания, артериальные и венозные тромбозы.

Нарушения со стороны нервной системы: очень редко – головокружение, судороги.

Нарушения со стороны органа зрения: редко – нарушения цветового восприятия и другие зрительные нарушения, окклюзия артерии сетчатки.

Нарушения со стороны иммунной системы: очень редко – реакции гиперчувствительности, в т.ч. анафилактический шок.

Прочие: очень редко – чувство недомогания.

Передозировка

Вероятные симптомы: головокружение, головная боль, тошнота, рвота, диарея, ортостатическая гипотензия.

Специфического антидота не существует. В случае передозировки лечение должно быть симптоматическим. Можно индуцировать рвоту, если больной находится в сознании, промыть желудок, назначить активированный уголь и провести форсированный диурез. У предрасположенных к тромбозу пациентов существует риск тромбоза. Рекомендуется наблюдение за больным и контроль функции жизненно-важных органов и систем. В некоторых случаях может быть оправданным применение антикоагулянтов.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

Одновременное применение транексамовой кислоты с препаратами факторов свертывания крови II, VII, IX и X в комбинации [протромбиновым комплексом] или антиингибиторным коагулянтным комплексом повышает риск развития тромбоза.

Возможно повышение риска тромботических осложнений (в частности, инфаркта миокарда) при одновременном применении транексамовой кислоты с гидрохлоротиазидом, десмопрессином, ампициллином-сульбактамом, ранитидином и нитроглицерином.

При сочетанном применении с гемостатическими препаратами возможна активация тромбообразования.

Транексамовая кислота препятствует тромболитическому эффекту фибринолитических препаратов.

При совместном применении транексамовой кислоты с антикоагулянтами пациент должен находиться под постоянным наблюдением врача.

При совместном применении транексамовой кислоты с эстрогенами существует теоретический риск повышения тромбообразования (тромбогенного потенциала).

Особые указания

Экстракция зуба у пациентов с коагулопатией: возможно потребуется назначение концентрата Фактора коагуляции. Это решение должно быть принято после консультации с гемостазиологом.

Фертильность: отсутствуют клинические данные по влиянию транексамовой кислоты на фертильность.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и механизмами:

Некоторые побочные действия транексамовой кислоты, такие как головокружение, нарушение цветового восприятия, другие зрительные нарушения, окклюзия артерии сетчатки, судороги могут отрицательно влиять на способность управлять транспортным средством и выполнение потенциально опасных видов деятельности, требующих повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска. Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 250 мг, 500 мг.

По 10 таблеток в блистер из алюминиевой фольги и бесцветной прозрачной поливинилхлоридной пленки. По 3 блистера вместе с инструкцией по применению в картонную пачку.

По 100, 500 или 1000 таблеток в пакет полиэтиленовый. Пакет в пластмассовую банку, запаянную алюминиевой фольгой с полиэтиленовым покрытием, с навинчиваемой крышкой; на банку наклеивают этикетку из бумаги этикеточной или писчей или из полимерных материалов, самоклеющуюся. По 1, 5, 10, 20 или 40 банок вместе с равным количеством инструкций по медицинскому применению в групповую упаковку - коробку из гофрированного картона (для стационаров).

Условия отпуска:

Отпускают без рецепта.

Срок годности:

3 года. Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия хранения:

При температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.

Производитель:

Сандживани Парантерал Лимитед, Индия

Адрес места производства:

323/1, Централ Хоп Таун, Камп роуд, Дехрадун-248197, Индия

Наименование и адрес юридического лица, на имя которого выдано регистрационное удостоверение/ Претензии потребителей и рекламации направлять в адрес:

ООО «С.П.ИНКОМЕД», Россия

117556, г. Москва, Симферопольский бульвар, дом 7, корп. А, пом. I, часть комн. 30,

тел. +7 (495) 775-07-68

Генеральный директор
ООО «С.П.ИНКОМЕД» Рай Панкадж Кумар