ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению препарата

ТРОКСАМИНАТ

Регистрационный номер:

Торговое название: ТРОКСАМИНАТ

Международное непатентованное название: Транексамовая кислота

Лекарственная форма: Раствор для внутривенного введения

Состав
5 мл раствора содержат:
Активное вещество: транексамовая кислота ….250 мг или 500 мг;
Вспомогательные вещества: вода для инъекций до 5 мл.

Описание
Прозрачный бесцветный раствор.

Фармакотерапевтическая группа
Гемостатический препарат. Ингибитор фибринолиза – ингибитор перехода плазминогена в плазмин.

Код АТХ
[B02AA02]

Фармакологическое действие
Гемостатический препарат. Ингибитор фибринолиза. Ингибирует активацию плазминогена, а в высоких концентрациях является неконкурентным ингибитором плазмина. Обладает местным и системным гемостатическим действием при кровотечениях, связанных с повышением фибринолиза (патология тромбоцитов, меноррагии). За счет подавления образования кининов и других активных пептидов, участвующих в аллергических и воспалительных реакциях, обладает противоаллергическим и противовоспалительным действием. В экспериментальных исследованиях подтверждена собственная анальгезирующая активность транексамовой кислоты, а также потенцирующий эффект в отношении анальгезирующей активности опиоидных анальгетиков.

Фармакокинетика
Связь с белками плазмы (профибринолизином) - менее 3 %.
Распределяется в тканях относительно равномерно (за исключением спинномозговой жидкости, где концентрация составляет 1/10 от плазменной). Проникает через плацентарный барьер и гематоэнцефалический барьер, выделяется с грудным молоком

(достигая приблизительно 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 в незначительной степени. Кривая AUC (площадь под кривой «концентрация – время») имеет трехфазную форму с $T_{1/2}$ (период полувыведения) в конечной фазе - 3 ч. Общий почечный клиренс равен плазменному (7 л/ч). Более 95% выводится почками в неизмененном виде в течение первых 12 ч (основной путь - гломерулярная фильтрация). Идент ифицировано 2 метаболита транексамовой кислоты: N-ацетилированное и дезаминированное производные.
Фармакокинетика в особых клинических случаях:
При нарушенной функции почек существует риск кумуляции транексамовой кислоты.

Показания к применению
Показания к применению у взрослых.
- Кровотечения или риск развития кровотечений на фоне усиления фибринолиза, как генерализованного (кровотечения во время операций и в послеоперационном периоде, послеродовые кровотечения, ручное отделение последа, отслойка хориона, кровотечение при беременности, злокачественные новообразования поджелудочной и предстательной желез, гемофилия, геморрагические осложнения фибринолитической терапии, тромбоцитопеническая пурпура, лейкозы, заболевания печени, предшествующая терапия стрептокиназой), так и местного (маточные, конизации шейки матки по поводу рака шейки матки, носовые, легочные, желудочно-кишечные кровотечения, гематурия, кровотечения после простатэктомии, экстракции зуба у больных с геморрагическим диатезом).
- Оперативные вмешательства на мочевом пузыре.
- Хирургические манипуляции при системной воспалительной реакции (сепсис, перитонит, панкреонекроз, тяжелый и средней степени тяжести гестоз, шок различной этиологии и другие критические состояния).
Показания к применению в детской практике.
- Маточные кровотечения пубертатного периода, кровотечения из верхних отделов желудочно-кишечного тракта, носовые кровотечения, легочные кровотечения, в том числе у больных с муковисцидозом, кровотечения после тонзиллэктомии.
- Наследственный ангионевротический отёк.
- Профилактика и лечение кровотечений при хирургических вмешательствах, хирургия врожденных пороков сердца, спинальная хирургия, трансплантация печени.
- Меноррагии у женщин с коагулопатиями, в том числе с болезнью Виллебранда, дефицитом факторов свертывания крови VII, X, XI.
- Кровотечения из верхних отделов желудочно-кишечного тракта, носовые кровотечения, стоматологические процедуры, в том числе хирургические манипуляции при губных или гингивальных гематомах у пациентов с коагулопатиями.
- Хирургическое лечение больных с геморрагическими расстройствами.

Противопоказания
- Субарахноидальное кровоизлияние;
- Повышенная чувствительность к компонентам препарата;
- Одновременное применение с фактором свертывания крови IX или антиингибиторным коагулянтным комплексом.

С осторожностью следует назначать препарат при тромбозах (в том числе при тромбозе сосудов головного мозга, инфаркте миокарда, тромбофлебите глубоких вен,

тромбоэмболическом синдроме) или при угрозе их развития, тромбогеморрагических осложнениях (в комбинированной терапии с гепарином, и непрямыми антикоагулянтами), нарушении цветового зрения, гематурии из верхних отделов мочевыводящих путей (возможна обструкция кровяным сгустком), почечной недостаточности (из-за увеличения риска кумуляции), тромбоэмболическом осложнении в анамнезе (в том числе в семейном).

Применение при беременности и кормлении грудью
Противопоказано применение при беременности. На время лечения следует прекратить грудное вскармливание.

Способ применения и дозы
Внутривенно (капельно, струйно).
При генерализованном фибринолизе вводят в разовой дозе 15 мг/кг массы тела каждые 6-8 ч, скорость введения 1 мл/мин.
При местном фибринолизе - 250-500 мг 2-3 раза в сутки.
При простатэктомии или операции на мочевом пузыре вводят во время операции 1 г, затем по 1 г каждые 8 часов в течение 3 дней, затем переходят на прием внутрь таблетированной формы до исчезновения макрогематурии.
При высоком риске развития кровотечения, при системной воспалительной реакции в дозе 10-11 мг/кг за 20-30 минут до вмешательства.
Больным с коагулопатиями перед экстракцией зуба вводят в дозе 10 мг/кг массы тела, после экстракции зуба принимают внутрь таблетированную форму препарата.
В случае нарушения выделительной функции почек необходима коррекция режима дозирования: при концентрации креатинина в крови 120-250 мкмоль/л вводят по 10 мг/кг 2 раза в сутки; при концентрации креатинина 250-500 мкмоль/л вводят по 10 мг/кг один раз в сутки; при концентрации креатинина более 500 мкмоль/л вводят по 5 мг/кг один раз в сутки.
Способ применения и дозы в детской практике.
Маточные кровотечения пубертатного периода: в зависимости от объема кровотечения и общего состояния пациентки, вводят по 0,5-1 г 3-4 раза в день с 1-го по 4-й день менструации.
Кровотечения из верхних отделов желудочно-кишечного тракта: 10-15 мг/кг массы тела больного.
Носовые кровотечения: по 1 г 3 раза в день в течение 10 дней после кровотечения.
Легочные кровотечения, в том числе у больных с муковисцидозом: по 1 г 3-4 раза в сутки до полного прекращения кровохарканья.
Тонзиллэктомия: внутривенно перед хирургической операцией 10-15 мг/кг, а после операции – внутрь по 1 г 3 раза в сутки в течение 5 дней.
Наследственный ангионевротический отёк: 1-1,5 г внутрь 2-3 раза в день или внутривенно капельно 15 мг/кг массы тела под контролем свертывающей системы крови.
Для профилактики и лечения кровотечений при хирургических вмешательствах: 10 мг/кг массы тела.
Стоматологические процедуры: внутрь 10 мг/кг массы тела после экстракции зуба, также может быть использовано полоскание полости рта транексамовой кислотой.
Хирургия врожденных пороков сердца:
1) нагрузочная доза 10 мг/кг с последующей инфузией препарата в дозе 1 мг/кг/ч;
2) 10 мг/кг препарата вводится в аппарат искусственного кровообращения;
3) 10 мг/кг пациент получает после введения протамина.
Спинальная хирургия, трансплантация печени: 20 мг/кг массы тела при кожном разрезе с последующей инфузией 1 мг/кг/ч, 20 мг/кг каждые 6-8 часов в послеоперационном периоде.

Меноррагии у женщин с коагулопатиями, в том числе с болезнью Виллебранда, дефицитом факторов свертывания крови VII, X и XI: 15-20 мг/кг массы тела 3-4 раза в сутки при наступлении кровотечения до его остановки (1-1,5 г 3 раза в сутки).
Кровотечения из верхних отделов желудочно-кишечного тракта у пациентов с коагулопатиями: 10 мг/кг массы тела 3-6 раз в сутки внутривенно. При эрозивном гастрите: 10 мг/кг массы тела 3-4 раза в сутки вводится в назогастральную трубку до остановки кровотечения.
Носовые кровотечения у пациентов с коагулопатиями: 15-20 мг/кг внутрь или местно (смоченный жгут).
Стоматологические процедуры у пациентов с коагулопатиями: внутрь по 15-20 мг/кг массы тела перед операцией и после удаления зуба, затем 3 раза в сутки в течение 8-10 дней. Можно полоскать рот в течение 2-х минут 4 раза в сутки в течение 2-х дней.
Для лечения продолжающейся после удаления зуба кровоточивости вводят в дозе 20 мг/кг внутривенно, а после выполнения местного гемостаза, 10 мг/кг внутрь каждые 6 ч в течение нескольких дней.
При образовании губных или гингивальных гематом для осуществления гемостаза вводят из расчета 7,5-10 мг/кг каждые 6 часов.
При манипуляциях, требующих гингивального разреза или местного воздействия на кости, целесообразно использование непрерывной инфузии в дозе 1,5 мг/кг/ч.
Хирургическое лечение больных с геморрагическими расстройствами: вводят 10 мг/кг массы тела 3 раза в сутки внутривенно непосредственно перед и после операции. Орально 15-20 мг/кг массы тела 3 раза в сутки после операции, когда пациент может принимать таблетки в течение 7-10 дней.
При эндопротезировании коленного сустава непосредственно перед снятием кровоостанавливающего жгута применяется дополнительная доза.
При операциях в нижнем отделе мочевых путей применяется доза 2 г 3 раза в сутки в день проведения операции и в первый день после операции наряду с орошением мочевого пузыря.
При малых операциях препарат может применяться только внутрь за 2 часа до операции и в течение одной недели после операции.

Передозировка
Симптомы: тошнота, рвота, диарея; ортостатическая гипотензия; артериальная или венозная тромбоэмболия; нарушение зрения; изменение психического статуса; миоклонус, сыпь.

Побочное действие
Со стороны пищеварительной системы: анорексия, тошнота, рвота, изжога, диарея.
Со стороны центральной нервной системы: головокружение, слабость, сонливость, нарушения цветовосприятия, нечеткость зрения.
Со стороны свертывающей системы крови: редко - тромбоз, тромбоэмболия.
Со стороны сердечно-сосудистой системы: тахикардия, боль в грудной клетке, артериальная гипотензия (при быстром внутривенном введении).
Аллергические реакции: сыпь, кожный зуд, крапивница.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами
Фармацевтически несовместим с урокиназой, гипертензивными средствами (норэпинефрином), дипиридамолом, диазепамом.
При одновременном применении с гемостатическими препаратами и гемокоагулазой возможна активация тромбообразования.
В растворе транексамовая кислота реагирует (нельзя смешивать) с антибиотиками (бензилпенициллин, тетрациклины), белками крови.

Особые указания
Перед началом и в процессе лечения необходимо проведение консультаций офтальмолога (определение остроты зрения, цветного зрения, состояние глазного дна).
При гематурии может вызвать формирование тромба и закупорку мочеточников.
Троксаминат не следует применять во время работы водителям транспортных средств и людям, профессия которых связана с повышенной концентрацией внимания.

Форма выпуска
Раствор для внутривенного введения 50 мг/мл, 100 мг/мл
По 5 мл препарата в ампулы из бесцветного прозрачного стекла марки USP тип 1 с насечкой для разлома в верхней части ампулы, которую обозначают синей полосой.
По 10 ампул помещают в пластиковый поддон с ячейками без покрытия. 1 пластиковый поддон вместе с инструкцией по применению помещают в пачку картонную.

Условия хранения
В сухом, защищенном от света месте, при температуре от 8 °С до 25 °С.
Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности
3 года.
Не использовать после срока, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек
Список Б.
По рецепту

Производитель
Хилтон Фарма (Пвт.) Лтд.
Прогрессив Плаза Бомон Роуд, Карачи, Пакистан

Адрес для направления претензий потребителей
Хилтон Фарма (Пвт.) Лтд.
Прогрессив Плаза Бомон Роуд, Карачи, Пакистан
Hilton Pharma (Pvt.) Ltd.
Progressive Plaza Beaumont road, Karachi-75530, Pakistan
Тел/Tel: (92-21) 111-123-000
Факс/Fax: (92-21) 111-124-000
e-mail: hilton@hiltonpharma.com
Website: www.hiltonpharma.com

Представитель фирмы Сухомлинова В.А.