

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
ТРОПІСЕТРОН
(TROPISETRON)

Загальна характеристика:

міжнародна та хімічна назви: Tropisetron;

[(аН, 5аН)-8-метил-8-азобіцикло-[3,2,1]-окт-3а-іл]-1Н-індол-3-карбоксилату гідрохлорид;

основні фізико-хімічні властивості: тверді желатинові капсули, корпус світло-рожевого кольору, кришка коричневого кольору, що містять порошок білого або майже білого кольору, без запаху;

склад: 1 капсула містить тропісетрону гідрохлориду в перерахуванні на 100 % тропісетрон - 0,005 г (5 мг);

допоміжні речовини: кальцію стеарат, целюлоза мікрокристалічна.

Форма випуску. Капсули.

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

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Тропісетрон являє собою високоактивний селективний конкурентний антагоніст периферичних та центральних серотонінових 5-НТ₃-рецепторів. Блокуючи ці рецептори, тропісетрон запобігає появі блювотного рефлексу, що спричиняється прийманням хіміотерапевтичних протипухлинних препаратів, які стимулюють викид серотоніну з enteroхромафінних клітин у слизовій оболонці травного тракту. Окрім того, тропісетрон пригнічує центральні ланки блювотного рефлексу, блокуючи 5-НТ₃-рецептори в ЦНС, зокрема, в агеа postrema (дно IV шлуночка).

Фармакокінетика. Після прийому внутрішньо препарат більше як на 95 % всмоктується із травного тракту (період напівабсорбції в середньому становить приблизно 20 хв.). Максимальна концентрація в крові досягається протягом 3 год. 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 глюкуроною або сірчаною кислотами та виводиться з сечею або з жовчю.

У осіб, з непорушеним метаболізмом, період напіввиведення тропісетрону становить 8 год, у осіб з низькою швидкістю метаболізму, період напіввиведення може збільшуватись до 43 год. 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.

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

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

Дітям старше двох років рекомендована доза становить 0,2 мг/кг маси тіла, максимальна доза - до 5 мг на добу; схема лікування така: після попереднього внутрішньовенного краплинного або струминного введення ін'єкційного розчину препарату, який вводять у перший день лікування (використовується

розчин для ін'єкцій, 1 мг/мл, ампули по 5 мл), у наступні дні (2 – 6-й) препарат приймається внутрішньо в капсулах (вміст капсули змішують з апельсиновим соком або з напоєм типу коли).

Добова доза для дорослих становить 5 мг. Капсули призначають з 2-го по 6-й день після попереднього внутрішньовенного краплинного або струминного введення ін'єкційного розчину препарату, який вводять у перший день лікування (використовується розчин для ін'єкцій, 1 мг/мл, ампули по 5 мл). Капсули треба приймати вранці, безпосередньо після пробудження або за годину до сніданку, запиваючи водою.

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

Тривалість дії Тропісетрону становить 24 год, що дозволяє застосовувати його один раз на добу. Призначення препарату протягом множинних циклів хіміотерапії не впливає на його ефективність. Широкий терапевтичний індекс Тропісетрону обумовлює відсутність необхідності в зміні дози у хворих літнього віку, в осіб з порушенням функцій печінки або нирок.

Побічна дія. Препарат добре переноситься. Порушення можливі з боку ЦНС: головний біль, запаморочення, почуття втоми; з боку травного тракту: біль у животі, запори, діарея. У поодиноких випадках відмічаються реакції гіперчутливості негайного типу (почервоніння обличчя, поширена кропив'янка, відчуття нестачі повітря, задишка, гострий бронхоспазм); у поодиноких випадках - колапс, зупинка серцевої діяльності, але точного взаємозв'язку з Тропісетроном не встановлено. Деякі з побічних ефектів можуть бути обумовлені одночасно проведеною хіміотерапією або основним захворюванням.

Протипоказання. Гіперчутливість до Тропісетрону, вагітність, лактація (під час прийому слід зупинити грудне вигодовування), дитячий вік до 2 років.

Передозування. При повторному прийомі дуже великих доз можливі такі симптоми: зорові галюцинації, підвищення АТ (у хворих з артеріальною гіпертензією). Лікування симптоматичне (в умовах моніторингу життєво важливих функцій та уважного спостереження за станом хворого).

Особливості застосування. Хворим із неконтрольованою артеріальною гіпертензією потрібно уникати призначення добових доз Тропісетрону, що перевищують 10 мг.

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

Препарати, що інгібують мітросомальні ферменти печінки, не мають суттєвого впливу на концентрацію Тропісетрону в плазмі крові. Терапевтична ефективність препарату посилюється дексаметазоном. Прийом разом з їжею може дещо збільшити біодоступність Тропісетрону, що клінічного значення не має.

Умови та термін зберігання. Зберігати в сухому, захищеному від світла місці при температурі від 15°C до 25°C. Зберігати в недоступному для дітей місці.

Термін придатності - 3 роки.

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка. Капсули по 0,005 г № 5 у контурній чарунковій упаковці, 1 контурна чарункова упаковка у пачці.

Виробник. ВАТ "Київмедпрепарат".

Адреса. Україна, 01032, м. Київ, вул. Саксаганського, 139.
Тел. (044) 490 7522.