

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
ТРОПІСЕТРОН
(TROPISETRON)

Загальна характеристика:

міжнародна та хімічна назви: tropisetron; $\{(1\text{-H}, 5\text{-H})\text{-8-метил-8-азабіцикло- [3,2,1]-окт-3-іл}\text{1H-індол-3-карбоксилату гідрохлорид}$;

основні фізико-хімічні властивості: прозора, безбарвна рідина;

склад: 1 мл розчину містить 1,128 мг тропісетрону гідрохлориду, що дорівнює 1 мг тропісетрону.

допоміжні речовини: кислота хлористоводнева, натрію хлорид, натрію ацетат тригідрат, кислота оцтова льодяна, вода для ін'єкцій.

Форма випуску. Розчин для ін'єкцій.

Фармакотерапевтична група. Протиблювотні засоби. Код АТС А03А А03.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Тропісетрон є високоактивним селективним конкурентним антагоністом серотонінових рецепторів, які в своїй більшості знаходяться в тонкому кишечнику (до 90 %) та ЦНС. Препарат блокує блювотний рефлекс і супроводжує його відчуття нудоти, що спричиняються протипухлинними цитотоксичними препаратами, променевою терапією та деякими наркотичними препаратами, які стимулюють вихід серотоніну з ентохромафіноподібних клітин у слизовій оболонці шлунково-кишкового тракту (ШКТ). Дія Тропісетрону не зменшується протягом 24 годин, що дозволяє застосовувати його 1 раз на добу. Препарат Тропісетрон зберігає ефективність при використанні його під час повторних курсів хіміо- та променевої терапії. На відміну від інших протиблювотних засобів Тропісетрон не чинить екстрапірамідних побічних явищ.

Фармакокінетика. При внутрішньовенному введенні препарату об'єм розподілу становить 7,9 л/кг. Препарат метаболізується в печінці з утворенням фармакологічно неактивних метаболітів. Враховуючи різну метаболізуючу активність печінки, що пов'язана з активністю монооксигеназ, період напіввиведення ($1/2T$) має розбіжність від 8 годин (для швидкого метаболізму) до 45 годин (для людей з низьким метаболізмом). Загальний кліренс Тропісетрону – близько 1 л/хв. У пацієнтів з низьким метаболізмом кліренс зменшується до (0,1 – 0,2) л/хв., АUC збільшується в 5-7 разів. Максимальна концентрація та рівень розподілу препарату не має відмінностей у людей зі швидким і повільним метаболізмом.

При прийомі per os Тропісетрон має високу біодоступність, досить швидко (період напівабсорбції 20 хв.) всмоктується (майже на 95%) із ШКТ. Максимальна концентрація препарату досягається протягом 3 годин.

Зв'язування з білками плазми. З білками плазми неспецифічно зв'язується 71 % препарату (в основному з α -глікопротеїном).

Виведення з організму. Тропісетрон виводиться з організму в основному через нирки із сечею (70 % у вигляді метаболітів фармакологічно малоактивних, 8 % – в незміненому вигляді). З калом у вигляді метаболітів виводиться близько 15% введеної дози.

Виведення з організму при зниженій функції печінки. Метаболізм препарату в печінці зумовлює залежність його виведення від функціонального стану в системі неспецифічних монооксигеназ. У людей із зниженою детоксикаційною функцією печінки період напіввиведення Тропісетрону зменшується у 5 разів. Але це не впливає на максимальну концентрацію та рівень розподілу, тому корекція дози не потрібна.

Показання до застосування. Запобігання та лікування блювання і нудоти, які спричинені протипухлинною хіміо- та променевою терапією. Лікування та усунення нудоти і блювання, що виникають у післяопераційний період.

Спосіб застосування та дози. Дорослим Тропісетрон призначають курсами по 6 днів. Добова доза становить 5 мг Тропісетрону. В перший день за 30 хвилин до проведення хіміотерапії препарат

Тропісетрон вводять внутрішньовенно: або повільно (1 хв.) струминою, або шляхом інфузії. Для приготування розчину для інфузії 5 мг розчину препарату (1 ампула) розчиняють у 100 мл фізіологічного розчину Рінгера, 5 % розчині глюкози або фруктози. На наступні 5 днів препарат призначають усередину (per os), в капсулах, за 1 годину до сніданку, запиваючи капсули водою. Хворим з порушенням функції печінки, нирок, а також хворим похилого віку немає необхідності знижувати дози нижче рекомендованих. Для дітей старше 2 років рекомендована доза Тропісетрону становить 0,2 мг/кг; максимальна добова доза – до 5 мг. У 1 -й день за 30 хвилин до проведення протипухлинної хіміотерапії рекомендується внутрішньовенне введення, а з 2-ї по 6-ту добу препарат призначають перорально. Тропісетрон можна призначати для перорального застосування одразу ж після розведення відповідної кількості Тропісетрону, який міститься в ампулі, апельсиновим соком. Приймати найкраще вранці, за годину до сніданку.

Побічна дія. Можливі порушення з боку ЦНС: головний біль, запаморочення, відчуття втоми. З боку ШКТ: біль у шлунку, діарея, запор. Можливе підвищення артеріального тиску крові.

Протипоказання. Тропісетрон протипоказаний пацієнтам з гіперчутливістю до Тропісетрону чи інших компонентів його лікарської форми. Препарат не слід вживати вагітним та матерям-годувальницям, а також дітям до 2-х років.

Передозування.

Симптоми: зорові галюцинації, підвищення артеріального тиску, особливо у хворих на гіпертонію.

Лікування: симптоматичне (в умовах моніторингу життєво важливих функцій та нагляду за станом хворого).

Особливості застосування. Слід бути обережним при призначенні Тропісетрону пацієнтам з артеріальною гіпертензією. У лікуванні цих хворих не слід використовувати добові дози Тропісетрону більш ніж 0,01 г, оскільки вищі дози можуть спричинити подальше підвищення артеріального тиску.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами.

Однчасне застосування Тропісетрону з препаратами, які є індукторами мікросомального окислення (фенобарбітал, рифампіцин), призводить до зменшення його концентрації в плазмі крові. В цьому випадку пацієнтам з високим рівнем мікросомального окислення слід підвищити дозу Тропісетрону. Препарати, які є інгібіторами мікросомального окислення в печінці, наприклад, циметедин, не впливають суттєво на концентрацію Тропісетрону в крові.

Умови та термін зберігання. Зберігати в сухому, захищеному від світла та недоступному для дітей місці, при температурі від +4 °С до +15 °С, не допускати заморожування. Термін зберігання – 3 роки. Тропісетрон не повинен зберігатися у відкритих ампулах, і має бути використаним одразу після розкриття ампули.

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка. По 2 мл або 5 мл в ампулах, по 5 ампул у коробці з картону.

Виробник. ЗАТ "Біолік".

Адреса. 61070, Україна, м. Харків, Помірки.