

ИНСТРУКЦИЯ
(информация для пациентов)
по медицинскому применению лекарственного средства
ТРОПИСЕТРОН

Торговое название: Трописетрон.

Международное непатентованное название: Трописетрон (Tropisetron).

Форма выпуска: раствор для внутривенного введения 1 мг/мл.

Описание: прозрачный бесцветный раствор.

Состав на одну ампулу: *активное вещество:* трописетрона (в виде трописетрона гидрохлорида) – 5,00 мг;

вспомогательные вещества: натрия цитрат, кислота лимонная моногидрат, вода для инъекций.

Фармакотерапевтическая группа: Противорвотные средства и средства для устранения тошноты. Антагонисты серотониновых рецепторов.

Код АТС: A04AA03.

Фармакологическое действие

Оказывает противорвотное действие. Блокирует рвотный рефлекс (и сопровождающее его чувство тошноты), вызываемый химиотерапевтическими противоопухолевыми лекарственными средствами, а также синдром послеоперационной тошноты и рвоты. Продолжительность эффекта составляет 24 ч, что позволяет применять лекарственное средство 1 раз в сутки. Сохраняет эффективность при использовании во время повторных курсов химиотерапии. В отличие от ряда других лекарственных средств, применяемых для предотвращения тошноты и рвоты, трописетрон не вызывает мышечную ригидность, гипокинезию, тремор головы и рук.

Показания к применению

- предупреждение тошноты и рвоты, возникающих вследствие противоопухолевой химиотерапии;
- устранение тошноты и рвоты, возникающих в послеоперационном периоде;
- предупреждение тошноты и рвоты, возникающих после гинекологических интраабдоминальных хирургических вмешательств. С целью достижения оптимальной величины соотношения "эффект/риск" применение лекарственного средства должно ограничиваться пациентками, в анамнезе которых имеются сведения о развитии послеоперационной тошноты и рвоты.

Способ применения и дозы

Предупреждение тошноты и рвоты, возникающих вследствие противоопухолевой химиотерапии.

Взрослые. Взрослым трописетрон рекомендуется в виде 6-дневных курсов по 5 мг/сут. В первый день назначают в/в за короткий промежуток времени до применения противоопухолевой химиотерапии: в виде инфузии (после предварительного разведения) или в виде медленной инъекции (не менее 1 мин). Для инфузионного введения лекарственное средство разводят такими общеупотребительными растворами для инфузий, как изотонический раствор натрия хлорида, раствор Рингера, 5 % раствор декстрозы. Затем со 2-го по 6-ой день лекарственное средство назначают внутрь.

Если применение одного трописетрона оказывает недостаточное противорвотное действие, лечебный эффект лекарственного средства может быть усилен назначением дексаметазона. Внутрь лекарственное средство следует принимать утром, запивая водой, сразу же после подъема, за 1 ч до приема пищи.

Дети. У детей старше 2-х лет рекомендуемая доза трописетрона составляет 0,2 мг/кг; максимальная суточная доза – до 5 мг. В первый день, за короткий промежуток времени до применения противоопухолевой химиотерапии, рекомендуется в/в введение в виде инфузии (после предварительного разведения). Затем со 2-го по 6-ой день лекарственное средство назначают внутрь. У детей с массой тела 25 кг и выше рекомендуемая суточная доза для приема внутрь составляет 5 мг.

Трописетрон может быть назначен в виде раствора для приема внутрь сразу же после разведения соответствующего количества трописетрона, содержащегося в ампуле, апельсиновым соком или другим напитком и должен приниматься утром за 1 ч до приема пищи.

Устранение и предупреждение тошноты и рвоты, возникающих в послеоперационном периоде.

Взрослые. Рекомендуется в/в введение трописетрона в дозе 2 мг в виде инфузии (после предварительного разведения) или в виде медленной инъекции (не менее 30 сек). Для предупреждения тошноты и рвоты, возникающих в послеоперационном периоде, трописетрон следует применять незадолго до введения наркоза.

Дети. Нет опыта применения у детей. Трописетрон не рекомендуется для лечения послеоперационной тошноты у детей.

Пациенты с медленным метаболизмом дебризохин-спартеина. У лиц с низким уровнем метаболизма спартеина/дебризохина период полувыведения трописетрона удлинен (в 4-5 раз по сравнению с лицами с высоким уровнем метаболизма спартеина/дебризохина). Однако при в/в введении в дозах, достигающих 40 мг 2 раза в сутки в течение 7 дней, здоровым добровольцам, относящимся к категории лиц с низким уровнем метаболизма спартеина/дебризохина, серьезных нежелательных явлений отмечено не было. Эти наблюдения указывают на то, что при проведении 6-ти дневных курсов лечения у пациентов, относящихся к категории лиц с низким уровнем метаболизма спартеина/дебризохина, необходимости в снижении обычной суточной дозы лекарственного средства, составляющей 5 мг, не возникает. У этой группы пациентов такие нежелательные эффекты, как головная боль и запоры, наблюдались чаще.

Нарушение функции печени и почек. У пациентов с острым гепатитом или с жировой дистрофией печени изменений фармакокинетики трописетрона не отмечается. У пациентов с циррозом печени или нарушениями функции почек концентрации трописетрона в плазме могут превышать (максимально на 50 %) те показатели, которые выявляются у здоровых добровольцев, относящихся к группе лиц с высоким уровнем метаболизма спартеина/дебризохина. Тем не менее, при применении лекарственного средства у таких пациентов коррекция режима дозирования лекарственного средства не требуется.

Пожилые лица. Коррекция дозы у пожилых пациентов не требуется.

Побочное действие

Частота развития побочных эффектов приведена в следующей градации: очень часто ($\geq 1/10$); часто ($\geq 1/100$, $< 1/10$); нечасто ($\geq 1/1000$, $< 1/100$); редко ($\geq 1/10000$, $< 1/1000$);

очень редко (<1/10000); неизвестно (по имеющимся данным определить частоту встречаемости не представляется возможным).

Нарушения со стороны иммунной системы: нечасто – гиперчувствительность, генерализованная крапивница; неизвестно – бронхоспазм*, анафилактический шок*.

Нарушения со стороны нервной системы: очень часто – головная боль; часто – головокружение; нечасто – обмороки.

Нарушения со стороны сердца: неизвестно – аритмия*, остановка сердца*.

Нарушения со стороны сосудов: нечасто – гипотония, приливы крови к лицу; неизвестно – циркуляторный коллапс*.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: нечасто – одышка, чувство дискомфорта в грудной клетке.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: очень часто – запор; часто – боль в животе, диарея.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: неизвестно – эритема*, сыпь*.

Общие расстройства и нарушения в месте введения: часто – утомляемость.

* На основании постмаркетингового опыта применения. Так как эти сообщения поступали от населения, невозможно достоверно оценить их частоту и связь с применением трописетрона.

Кроме того, в пострегистрационном периоде очень редко сообщалось о возникновении коллапса, обморока или сердечно-сосудистых расстройствах. Однако эти побочные эффекты могли быть вызваны как проведением химиотерапии основного заболевания, так и обусловлены сопутствующей терапией.

В случае возникновения вышеперечисленных побочных реакций или побочных реакций, не указанных в данной инструкции по медицинскому применению лекарственного средства, необходимо обратиться к врачу.

Противопоказания

- гиперчувствительность к трописетрону или любым другим компонентам лекарственного средства;
- беременность и лактация (необходимо прекратить грудное вскармливание на время лечения);
- детский возраст до 2 лет – для предупреждения тошноты и рвоты, возникающих вследствие противоопухолевой терапии, до 18 лет – для устранения и предупреждения тошноты и рвоты в послеоперационном периоде;
- тяжелые нарушения функции почек у пациентов, которые плохо метаболизируют трописетрон.

Передозировка

Симптомы. В случае повторного применения очень высоких доз трописетрона возможны зрительные галлюцинации; у пациентов с предшествующей артериальной гипертензией — повышение артериального давления.

Лечение. Показано симптоматическое лечение под постоянным контролем жизненно важных функций организма и состояния пациента.

Меры предосторожности

Стеклообразные ампулы содержат по 5 мг трописетрона в 5 мл водного раствора. Раствор, содержащийся в ампулах, совместим со следующими растворами для инъекций (1 мг трописетрона разводится в 20 мл): декстроза 5%; маннитол 10%; раствор Рингера; натрия хлорид 0,9%; калия хлорид 0,3%. Раствор, содержащийся в ампулах, также совместим с контейнерами для инфузий обычного типа (изготовленными из стекла, PVC) и наборами для проведения инфузий.

Следует соблюдать осторожность при назначении на фоне неконтролируемой гипертензии и учитывать возможность снижения скорости реакции.

Использовать только свежеприготовленные растворы.

В 5 мл раствора содержится 0,18 ммоль (4,14 мг) натрия, в 2 мл раствора содержится 0,07 ммоль (1,66 мг) натрия. Лекарственное средство содержит натрий в количестве менее 1 ммоль (23 мг) в дозе, т.е. практически не содержит натрия.

Существует потенциальный риск перекрестной реакции с другими антагонистами 5-HT₃-рецепторов. У пациентов с медленным метаболизмом лекарственного средства увеличивается период полувыведения (в 4-5 раз дольше, чем у пациентов с быстрым метаболизмом), но обычную дозу не уменьшают. Фармакокинетика не изменяется у пациентов с острым гепатитом или с заболеванием печени с избыточным накоплением жира, следовательно, обычная доза может быть использована. У пациентов с циррозом печени или нарушением функции почек концентрация лекарственного средства в плазме крови может быть на 50 % выше, чем у здоровых добровольцев с быстрым метаболизмом, но обычная доза 2 мг и 5 мг не должна быть уменьшена. Пациентам с тяжелой почечной недостаточностью до начала приема показано фенотипическое исследование, чтобы исключить лиц с медленным метаболизмом.

Могут отмечаться изменения на ЭКГ, включая удлинение интервала QT, как и при использовании других антагонистов 5-HT-рецепторов. Удлинение интервала QT наблюдается после введения высокой дозы (до 80 мг) лекарственного средства внутривенно. Из-за ограниченного опыта следует проявлять осторожность при назначении лекарственного средства пациентам с нарушением сердечного ритма или с нарушением проводимости, а также, когда лекарственное средство назначается одновременно с антиаритмическими лекарственными средствами, бета-адреноблокаторами или лекарственными средствами, которые могут продлить QT интервал.

Применение во время беременности и в период лактации. Противопоказано применение во время беременности. На время лечения следует прекратить грудное вскармливание.

Влияние на способность к управлению автотранспортом и другими потенциально опасными механизмами. Данных о влиянии на способность к управлению автомобилем и другими потенциально опасными механизмами не имеется, однако такие возможные побочные реакции со стороны нервной системы, как головная боль, головокружение и усталость, могут привести к замедлению скорости психомоторной реакции и снижению способности к концентрации внимания.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Индукторы микросомальных ферментов печени (рифампицин, фенobarбитал) снижают концентрацию трописетрона в крови. Поэтому у пациентов, которые быстро метаболизируют трописетрон, необходимо повышение доз (у пациентов, которые метаболизируют трописетрон медленно, этого не требуется). Влияния ингибиторов ферментной системы цитохрома P450, таких как циметидин, на уровни трописетрона в плазме незначительны; изменений дозирования лекарственного средства в таких случаях не требуется. Исследования взаимодействия трописетрона со средствами для наркоза не проводились.

Удлинение интервала QT было отмечено у нескольких пациентов, которым трописетрон назначался в сочетании с лекарственными средствами, вызывающими удлинение этого интервала. В то же время в тех исследованиях, где применялся только один трописетрон в терапевтических дозах, удлинение интервала QT отмечено не было. Тем не менее, следует соблюдать осторожность при одновременном применении трописетрона и лекарственных средств, вызывающих удлинение интервала QT.

Условия хранения

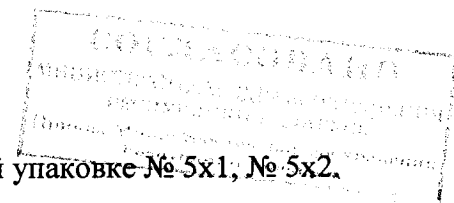
В защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.



Упаковка

По 5 мл в ампулах в упаковке № 5 или в контурной ячейковой упаковке № 5x1; № 5x2.

Условия отпуска

По рецепту.

Применять в условиях стационара.

Производитель:
РУП "Белмедпрепараты",
Республика Беларусь, 220007, г. Минск,
ул. Фабрициуса, 30, т./ф.: (+375 17) 220 37 16,
e-mail: medic@belmedpreparaty.com

