

ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению препарата
ТРОПИСЕТРОН
(TROPISETRON)

Общая характеристика:

международное и химическое названия: Tropisetron;

основные физико-химические свойства: твердые желатиновые капсулы, корпус светло-розового цвета, крышка коричневого цвета, содержащие порошок белого или почти белого цвета, без запаха;

состав: 1 капсула содержит трописетрона гидрохлорида в пересчете на 100 % трописетрон - 0,005 г;

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, крахмал кукурузный, кремнию диоксид коллоидный безводный, магнию стеарат.

Форма выпуска. Капсулы.

Фармакотерапевтическая группа. Противорвотные средства и препараты, устраняющие тошноту. Код АТС А04А А03.

Фармакологические свойства.

Фармакодинамика. Трописетрон представляет собой высокоактивный селективный конкурентный антагонист периферических и центральных серотониновых 5-НТ₃-рецепторов. Блокируя эти рецепторы, трописетрон предупреждает возникновение рвотного рефлекса, вызываемого приемом химиотерапевтических противоопухолевых препаратов, которые стимулируют выброс серотонина с энтерохромаффинных клеток в слизистой оболочке пищеварительного тракта. Кроме того, трописетрон угнетает центральные звенья рвотного рефлекса, блокируя 5-НТ₃-рецепторы в ЦНС, в частности, в area postrema (дно IV желудочка).

Фармакокинетика. После приема внутрь препарат более чем на 95 % всасывается из пищеварительного тракта (период полуабсорбции в среднем составляет около 20 мин). Максимальная концентрация в крови достигается в течение 3 часов. Абсолютная биодоступность зависит от дозы и достигает приблизительно 60 % после приема 5 мг, увеличиваясь до 100 % после приема 45 мг. Связывание с белками плазмы составляет 71 %, объем распределения - 7,9 л/кг.

Препарат метаболизируется в печени путем гидроксилирования с последующей конъюгацией с глюкуроновой или серной кислотами и выводится с мочой или с желчью.

У лиц с ненарушенным метаболизмом, период полувыведения трописетрона составляет 8 часов, у лиц с низкой скоростью метаболизма, период полувыведения может увеличиваться до 43 ч. Общий клиренс трописетрона составляет около 1 л/мин, около 10 % приходится на почечный клиренс. Выводится из организма медленно.

У больных с нарушенным метаболизмом, общий клиренс снижен до 0,1 - 0,2 л/мин при неизменном почечном клиренсе.

Показания к применению. Профилактика тошноты и рвоты при проведении противоопухолевой химиотерапии и в послеоперационном периоде (профилактика и лечение).

Способ применения и дозы. Применяется внутрь. Трописетрон назначают курсами по 5 дней.

Детям старше двух лет рекомендуемая доза составляет 0,2 мг/кг массы тела, максимальная доза - до 5 мг в сутки; схема лечения такая: после предварительного внутривенного капельного или струйного введения инъекционного раствора препарата, вводимого в первый день лечения (используется раствор для инъекций, 1 мг/мл, ампулы по 5 мл), в последующие дни (2 – 6-й) препарат принимается внутрь в капсулах (содержимое капсулы смешивают с апельсиновым соком или с напитком типа колы).

Суточная доза *для взрослых* составляет 5 мг. Капсулы назначают со 2-го по 6-й день после предварительного внутривенного капельного или струйного введения инъекционного раствора препарата, вводимого в первый день лечения (используется раствор для инъекций, 1 мг/мл, ампулы по 5 мл). Капсулы следует принимать утром, непосредственно после пробуждения или за час до завтрака, запивая водой.

У лиц с пониженной способностью к метаболизму уменьшение стандартной суточной дозы не требуется.

Продолжительность действия Трописетрона составляет 24 ч, что позволяет применять его один раз в сутки. Назначение препарата на протяжении множественных циклов химиотерапии не влияет на его эффективность. Широкий терапевтический индекс Трописетрона обуславливает отсутствие необходимости в изменении дозы у больных пожилого возраста, у лиц с нарушением функций печени или почек.

Побочное действие. Препарат хорошо переносится. Нарушения возможны со стороны ЦНС: головная боль, головокружение, чувство усталости; со стороны пищеварительного тракта: боль в животе, запоры, диарея. В редких случаях отмечаются реакции гиперчувствительности немедленного типа (покраснение лица, распространенная крапивница, ощущение нехватки воздуха, одышка, острый бронхоспазм); в очень редких случаях - коллапс, остановка сердечной деятельности, но точной взаимосвязи с Трописетроном не установлено. Некоторые из побочных эффектов могут быть обусловлены одновременно проводимой химиотерапией или основным заболеванием.

Противопоказания. Гиперчувствительность к Трописетрону, беременность, лактация (на время приема следует приостановить грудное вскармливание), детский возраст до 2 лет.

Передозировка. При повторном приеме очень больших доз возможны следующие симптомы: зрительные галлюцинации, повышение АД (у больных с артериальной гипертензией). Лечение симптоматическое (в условиях мониторинга жизненно важных функций и внимательного наблюдения за состоянием больного).

Особенности применения. Больным с неконтролируемой артериальной гипертензией нужно избегать назначения суточных доз Трописетрона, превышающих 10 мг.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами. Рифампицин, фенобарбитал и другие препараты, индуцирующие активность ферментов печени, снижают концентрацию Трописетрона в плазме крови, что может привести к необходимости увеличения дозы у лиц с активным метаболизмом, тогда как при пониженной скорости метаболизма этого не требуется.

Препараты, ингибирующие микросомальные ферменты печени, не оказывают существенного влияния на концентрацию Трописетрона в плазме крови. Терапевтическая эффективность препарата усиливается дексаметазоном. Прием вместе с пищей может несколько увеличить биодоступность Трописетрона, что клинического значения не имеет.

Условия и срок хранения. В оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С.
Хранить в недоступном для детей месте.
Срок годности - 3 года.

Условия отпуска. По рецепту.

Упаковка. Капсулы по 0,005 г № 5 в блистере, 1 блистер в пачке.

Производитель. ОАО "Киевмедпрепарат".

Адрес. Украина, 01032, г. Киев, ул. Саксаганского, 139.

**Заместитель директора
Государственного фармакологического
центра МЗ Украины, д. м. н.**

Т. А. Бухтиарова

ТРОПИСЕТРОН
tropisetron
Капсулы 0,005 г

ЛИСТОК-ВКЛАДЫШ. ИНФОРМАЦИЯ ДЛЯ ПАЦИЕНТА

Прочитайте внимательно этот листок-вкладыш перед тем, как начать применение препарата!

Храните этот листок-вкладыш. Вам может понадобиться перечитать его.

Если у Вас возникнут дополнительные вопросы, пожалуйста, проконсультируйтесь с Вашим врачом.

Этот препарат предназначен лично Вам и не следует передавать его другим лицам. Это может навредить им, даже если симптомы их заболевания схожи с теми, которые наблюдаются у Вас.

Состав лекарственного средства:

действующее вещество: трописетрон;

1 капсула содержит трописетрона гидрохлорида в пересчете на 100 % трописетрон 0,005 г;

вспомогательные вещества: кальция стеарат, целлюлоза микрокристаллическая.

Лекарственная форма. Капсулы.

Фармакотерапевтическая группа. Противорвотные средства и препараты, устраняющие тошноту.

Фармакологические свойства. Трописетрона гидрохлорид предупреждает возникновение рвотного рефлекса, вызываемого приемом химиотерапевтических противоопухолевых препаратов.

После приема внутрь препарат более чем на 95 % всасывается из пищеварительного тракта. Максимальная концентрация его в крови достигается в течение 3 часов.

Выводится из организма медленно. Продолжительность действия - около 24 часов.

Показания. Профилактика тошноты и рвоты при проведении противоопухолевой химиотерапии и в послеоперационном периоде (профилактика и лечение).

Противопоказания. Повышенная чувствительность к Трописетрону, беременность, период кормления грудью (на время приема препарата кормление грудью необходимо прекратить), детский возраст до 2 лет.

Предостережения при применении. Не следует применять препарат во время работы водителям транспортных средств и людям, профессия которых связана с повышенной концентрацией внимания из-за возможного снижения скорости реакции.

Следует соблюдать осторожность при приеме препарата людям с неконтролируемым повышением давления.

Для больных пожилого возраста и для лиц с нарушением функции печени или почек нет необходимости в изменении дозы.

Взаимодействие с лекарственными средствами. Если Вы принимаете любые другие лекарственные средства, обязательно сообщите об этом врачу.

Рифампицин, фенобарбитал снижают концентрацию Трописетрона в плазме крови, дексаметазон усиливает терапевтическую эффективность препарата.

Во время лечения препаратом Трописетрон не принимайте других лекарственных средств без предварительной консультации с врачом. Неконтролируемое лечение может нанести вред Вашему здоровью.

Особые указания. Назначение препарата на протяжении множественных циклов химиотерапии не влияет на его эффективность.

Способ применения и дозы. Трописетрон применяют внутрь, желательно утром, непосредственно после пробуждения или за час до завтрака, запивая водой.

При необходимости применения препарата у *детей* старше двух лет необходимо обратиться к врачу для согласования дозировки. Рекомендуемая доза *детям* старше двух лет - 0,2 мг/кг массы тела, максимальная доза - до 5 мг в сутки; схема лечения такая: после предварительного внутривенного капельного или струйного введения инъекционного раствора препарата, вводимого в первый день лечения (используется раствор для инъекций, 1 мг/мл, ампулы по 5 мл) в последующие дни (2 – 6-й) препарат принимается внутрь в капсулах (содержимое капсулы смешивают с апельсиновым соком или с напитком типа колы).

Суточная доза для *взрослых* составляет 5 мг (1 капсула). Капсулы назначают со 2-го по 6-й день после предварительного внутривенного капельного или струйного введения инъекционного раствора препарата, вводимого в первый день лечения (используется раствор для инъекций, 1 мг/мл, ампулы по 5 мл). Применяют Трописетрон курсами по 5 дней.

При передозировке препарата возможны: зрительные галлюцинации, повышение артериального давления (у больных с артериальной гипертензией).

При возникновении этих и других нежелательных симптомов необходимо прекратить прием препарата и обратиться к врачу.

Побочные эффекты. Препарат хорошо переносится, однако возможны:

- со стороны центральной нервной системы: головная боль, головокружение, чувство усталости;
- со стороны пищеварительного тракта: боль в животе, запоры или понос;
- аллергические реакции (в редких случаях): покраснение лица, распространенная крапивница, ощущение нехватки воздуха.

В случае появления нежелательных влияний или других необычных реакций посоветуйтесь с врачом относительно дальнейшего применения препарата.

Срок годности - 3 года.

Запрещается пользоваться лекарственным средством после окончания даты срока годности, указанной на упаковке. Визуальные признаки непригодности препарата: деформация капсул.

Условия хранения. Хранить в сухом, защищенном от света месте при температуре от 15°C до 25°C. *Хранить в недоступном для детей месте.*

Упаковка. Капсулы по 0,005 г № 5 в контурной ячейковой упаковке, 1 контурная ячейковая упаковка в пачке.

Правила отпуска. По рецепту.

Название и адрес производителя. ОАО «Киевмедпрепарат».

01032, Украина, г. Киев, ул. Саксаганского, 139.

Тел. (044) 490 7522.

**Заместитель директора
Государственного фармакологического
центра МЗ Украины, д. м. н.**

Т. А. Бухтиарова