

Состав

действующее вещество: транексамовая кислота;

1 мл раствора содержит транексамовой кислоты, в пересчете на 100 % вещество – 100,0 мг;

вспомогательное вещество: вода для инъекций.

Лекарственная форма

Раствор для инъекций.

Основные физико-химические свойства: прозрачная бесцветная жидкость.

Фармакотерапевтическая группа

Антигеморрагические средства. Ингибиторы фибринолиза. Аминокислоты.

Код АТХ В02А А02.

Фармакодинамика

Транексамовая кислота оказывает антигеморрагическое действие путем угнетения фибринолитических свойств плазмина.

С участием транексамовой кислоты и плазминогена создается комплекс; транексамовая кислота связывается с плазминогеном при преобразовании в плазмин.

Активность комплекса транексамовая кислота-плазмин по отношению к фибрину ниже по сравнению с активностью свободного плазмина.

Высокие дозы транексамовой кислоты снижали активность комплемента.

Дети с 1 года. Есть данные об уменьшении кровопотери и снижении потребности в продуктах крови в детской кардиохирургии с искусственным кровообращением, где есть высокий риск возникновения кровотечения, особенно в цианотичных пациентов или пациентов, которые проходят повторное хирургическое вмешательство. Выявлено, что самый оптимальный такой режим дозирования:

- первое болюсное введение 10 мг/кг после начала наркоза и перед разрезом кожи;

- непрерывная инфузия 10 мг/кг/ч или инъекция в жидкость для наполнения аппарата искусственного кровообращения в дозе, соответствующей процедуре искусственного кровообращения или в соответствии с массой тела пациента в дозе 10 мг/кг, или в соответствии с объемом наполнения аппарата искусственного кровообращения, последняя инъекция – 10 мг/кг в конце процедуры искусственного кровообращения.

Ограниченные данные позволяют предположить, что непрерывное введение является наиболее приемлемым, поскольку оно поддерживает терапевтическую концентрацию в плазме крови в течение всего периода оперативного вмешательства.

У детей не проводили никаких специфических дозозависимых исследований.

Фармакокинетика

Всасывание. Максимальная концентрация транексамовой кислоты в плазме крови быстро достигается после короткого введения, после чего снижается мультиэкспоненциально.

Распределение. Белок плазмы связывает около 3 % от терапевтического плазменного уровня транексамовой кислоты, и это обусловлено вероятно его связыванием с плазминогеном. Транексамовая кислота не связывается с альбумином сыворотки крови. Начальный объем распределения составляет около 9-12 литров.

Транексамовая кислота проникает через плацентарный барьер. После введения внутривенно в дозе 10 мг/кг беременным женщинам концентрация транексамовой кислоты в сыворотке крови колебалась в диапазоне 10-53 мкг/мл, в пуповинной крови – в диапазоне 4-31 мкг/мл. Транексамовая кислота быстро проникает в синовиальную жидкость и синовиальную оболочку. После введения внутривенно в дозе 10 мг/кг пациентам, которые перенесли операцию на колене, концентрация в синовиальной жидкости была подобна концентрации, наблюдавшейся в соответствующих образцах сыворотки крови. Концентрация транексамовой кислоты в других тканях составляла такую долю по отношению к концентрации в крови: в грудном молоке – около 1/100, в цереброспинальной жидкости – около 1/10, во внутриглазной жидкости – около 1/10. Транексамовая кислота была обнаружена в семенной жидкости, где она ингибирует фибринолитическую активность, но не влияет на миграцию сперматозоидов.

Выведение. Выводится преимущественно с мочой в неизмененном виде. Выведение с мочой путем клубочковой фильтрации является основным путем выведения. Почечный клиренс равен клиренсу плазмы (110-116 мл/мин).

Выведение транексамовой кислоты составляет около 90% в течение первых 24 часов после введения в дозе 10 мг/кг массы тела. Период полувыведения транексамовой кислоты составляет примерно 3 часа.

Особые группы. Концентрация в плазме увеличивается у пациентов с почечной недостаточностью.

Отдельных исследований фармакокинетики у детей не проводили.

Показания

Кровотечение или риск кровотечения при усилении фибринолиза, как генерализованного, так и местного, у взрослых и детей старше 1 года.

Специфические показания включают кровотечения, обусловленные повышенным общим или местным фибринолизом, такие как:

- меноррагия и метроррагия;
- желудочно-кишечные кровотечения;
- геморрагические расстройства мочевыводящих путей, возникших в связи с хирургическим вмешательством на предстательной железе или в результате оперативного вмешательства или процедур на мочевыводящих путях;
- отоларингологические (удаление аденоидов, тонзиллэктомия) и стоматологические (удаление зубов) оперативные вмешательства;
- гинекологические операции или осложнения в акушерской практике;
- торакальные, абдоминальные и другие крупные хирургические оперативные вмешательства, например сердечно-сосудистая хирургия;
- контроль кровоизлияний в связи с введением фибринолитического лекарственного средства.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к активному веществу или к любому из компонентов препарата;

- острый венозный или артериальный тромбоз;
- фибринолитические состояния с острым тяжелым кровотечением из-за введения коагулопатичных средств (антикоагулянтов), за исключением тех препаратов, которые преимущественно осуществляют активацию фибринолитической системы;
- тяжелая почечная недостаточность (существует риск накопления лекарственного средства);
- судороги в анамнезе;

- интратекальное и внутривентрикулярное инъекционное введение, интрацеребральное введение (риск отека мозга с последующим развитием судорог).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Исследование взаимодействия лекарственных средств не проводили. Параллельный (одновременный) прием антикоагулянтов должен происходить под строгим наблюдением врача, имеющего опыт в этом направлении терапии. Лекарственные препараты, действующие на гемостаз, следует применять с осторожностью пациентам, которые получили лечение с применением транексамовой кислоты. В этих случаях существует риск тромбообразования, например при применении эстрогенов. Кроме того, антифибринолитическое действие препарата может быть антагонизировано при применении тромболитиков.

Особенности применения

Следует строго соблюдать указанных показаний и способа применения:

- внутривенные инъекции следует делать очень медленно;
- транексамовую кислоту нельзя вводить внутримышечно.

Судороги: у пациентов были зарегистрированы случаи судорог, связанные с лечением транексамовой кислотой. Во время операций аортокоронарного шунтирования (АКШ) большинство из указанных случаев были зарегистрированы после внутривенного введения транексамовой кислоты в высоких дозах. При использовании рекомендованных низких доз транексамовой кислоты частота послеоперационных судорог была такой же, как у пациентов, которым не применяли этот препарат.

Нарушение зрения: должно быть уделено внимание возможным офтальмологическим осложнениям, включая нарушения зрения, помутнение зрения, нарушение цветового восприятия. В указанных случаях лечение следует прекратить. При непрерывном длительном применении транексамовой кислоты (инъекции) должны быть назначены регулярные офтальмологические обследования (в том числе проверка остроты зрения, цветового восприятия, глазного дна, поля зрения и т. д.). При наличии и при возникновении патологических офтальмологических изменений, связанных в том числе с заболеваниями сетчатки, после соответствующей консультации специалиста врач должен решить вопрос о необходимости и возможности долгосрочного

применения транексамовой кислоты (инъекции) в каждом отдельном случае индивидуально.

Гематурия: в случае гематурии с привлечением верхних мочевых путей может возникнуть опасность обструкции уретры.

Тромбоэмболические осложнения: перед назначением транексамовой кислоты следует рассмотреть факторы риска тромбоэмболических осложнений.

Пациентам с наличием в анамнезе тромбоэмболических заболеваний и больным, у которых по данным семейного анамнеза существует риск тромбоэмболических осложнений (пациенты с высоким риском тромбофилии), транексамовую кислоту (раствор для инъекций) следует вводить только в случаях, когда есть прямые жизненные показания, при этом лечение следует начинать после консультации специалиста, имеющего опыт в гемостазиологии, и проводить под строгим наблюдением врача.

Из-за наличия повышенного риска развития тромбоза транексамовую кислоту следует назначать с осторожностью пациентам, получающим пероральные контрацептивы.

Диссеминированная внутрисосудистая коагуляция (ДВК): пациенты с синдромом ДВК обычно не должны получать лечение с применением транексамовой кислоты. Если есть необходимость в применении транексамовой кислоты, она должна быть назначена исключительно при наличии подавляющей активации фибринолитической системы с острым тяжелым кровотечением. Установлено, что характерный гематологический профиль при этих состояниях приближается к следующему: уменьшается время формирования еуглобулинового сгустка; наблюдается удлиненное протромбиновое время; имеется снижение уровня в плазме крови фибриногена, факторов V и VIII, плазминогена фибринолизина и альфа-2 макроглобулина; нормальные плазменные уровни Р и Р-комплекса; то есть факторы II (протромбин), VIII и X; повышенные уровни в плазме крови продуктов распада фибриногена; нормальный уровень тромбоцитов. Вышеуказанное свидетельствует, что основное заболевание не оказывает влияния на различные элементы в этом профиле. В таких острых случаях для остановки кровотечения разовая доза 1 г транексамовой кислоты часто является достаточной. Возможность применения транексамовой кислоты при синдроме ДВК у пациента следует рассматривать только тогда, когда имеются соответствующая гематологическая лабораторная база и накопленный клинический опыт.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

Исследования оценки влияния на способность управлять автотранспортом или другими механизмами отсутствуют.

Применение в период беременности или кормления грудью

Женщины репродуктивного возраста во время лечения должны использовать эффективные средства контрацепции.

Клинических данных по применению транексамовой кислоты беременным женщинам недостаточно.

В течение I триместра беременности в качестве меры безопасности назначение транексамовой кислоты не рекомендуется.

Есть только ограниченные клинические данные по применению транексамовой кислоты при различных клинических геморрагических состояниях во время II и III триместра беременности, по которым невозможно идентифицировать вредное воздействие на плод. Транексамовую кислоту применять в период беременности возможно только в том случае, если ожидаемая терапевтическая польза превышает потенциальный риск.

Транексамовая кислота проникает в грудное молоко. Таким образом, грудное вскармливание не рекомендуется.

Отсутствуют клинические данные о влиянии транексамовой кислоты на фертильность.

Способ применения и дозы

Трамикс вводить только внутривенно (капельно, струйно).

При генерализованном фибринолизе вводить в дозе 1 г (2 ампулы по 5 мл) или 15 мг/кг массы тела каждые 6-8 часов внутривенно медленно (скорость введения – 1 мл/мин).

При местном фибринолизе рекомендуется применять препарат в дозе от 0,5 г (1 ампула по 5 мл) до 1 г (2 ампулы по 5 мл) 2-3 раза в сутки внутривенно медленно (скорость введения – 1 мл/мин).

Нарушение функции почек

В случае почечной недостаточности существует риск аккумуляции, поэтому применение транексамовой кислоты пациентам с тяжелой почечной недостаточностью противопоказано.

Для пациентов с легкой и средней формой почечной недостаточности дозировка подбирается в соответствии с уровнем креатинина в сыворотке крови.

Креатинин сыворотки		Внутривенная доза	Введение
мкмоль/л	мг/10 мл		
120-249	1,35-2,82	10 мг/кг массы тела	каждые 12 часов
250-500	2,82-5,65	10 мг/кг массы тела	каждые 24 часа
>500	>5,65	5 мг/кг массы тела	каждые 24 часа

Нарушение функции печени

При заболеваниях печени коррекция дозы не требуется.

Пациентам пожилого возраста не требуется коррекции дозы в случае отсутствия почечной недостаточности.

Трамикс можно смешивать с растворами электролитов, аминокислот и раствором глюкозы.

В раствор для инъекций можно добавлять гепарин.

Готовить раствор необходимо перед самым введением. Неиспользованный раствор следует утилизировать.

Дети

Детям с 1 года назначать в дозе 20 мг/кг/сутки. Данные по эффективности, дозировке и безопасности ограничены.

Эффективность, дозировка и безопасность транексамовой кислоты у детей, перенесших операцию на сердце, полностью не установлены.

Передозировка

Случаев передозировки не наблюдалось.

Симптомы передозировки могут включать головокружение, головную боль, гипотензию и судороги (конвульсии). Частота возникновения судорог возрастает с увеличением дозы.

Лечение передозировки симптоматическое.

Побочные реакции

Ниже указаны побочные реакции, которые систематизированы в соответствии с классификатором MedDRA (основные классы систем органов). В рамках каждого класса систем органов побочные реакции упорядочены по частоте. В каждой группе по частоте побочные реакции представлены в порядке убывания проявления. Частота была определена следующим образом: очень часто ($> 1/10$); часто ($> 1/100$ до $< 1/10$); нечасто ($> 1/1000$ до $< 1/100$), неизвестно (нельзя оценить по имеющимся данным).

Со стороны кожи и подкожной ткани.

Нечасто: аллергические дерматиты.

Со стороны пищеварительной системы.

Часто: диарея, рвота, тошнота.

Со стороны нервной системы.

Неизвестно: судороги, в частности в случае неправильного применения.

Со стороны органов зрения.

Неизвестно: нарушение зрения, включая нарушение цветового восприятия.

Со стороны системы крови и лимфатической системы.

Неизвестно: недомогание, вызванное гипотонией, с потерей сознания или без (как правило, после слишком быстрой инъекции, как исключение – после перорального приема).

Артериальная или венозная тромбоэмболия на любых участках.

Со стороны иммунной системы.

Неизвестно: реакции гиперчувствительности, включая реакции анафилактического типа.

Срок годности

2 года.

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С. Не замораживать!

Хранить в недоступном для детей месте.

Несовместимость

Это лекарственное средство не следует добавлять в кровь для переливания или в инъекционные растворы пенициллина.

Упаковка

По 5 мл в ампуле, по 5 ампул в контурной ячейковой упаковке, по 1 контурной ячейковой упаковке в пачке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

ПАО «Галичфарм».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Украина, 79024, г. Львов, ул. Опрышковская, 6/8.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).