

Состав

действующее вещество: tranexamic acid;

1 мл препарата содержит транексамовой кислоты 100 мг;

вспомогательные вещества: вода для инъекций.

Лекарственная форма

Раствор для инъекций.

Основные физико-химические свойства: прозрачная бесцветная или почти бесцветный раствор.

Фармакотерапевтическая группа

Антигеморрагические средства, антифибринолитические аминокислоты. Ингибиторы фибринолиза. Код АТХ В02А А02.

Фармакодинамика

Транексамовая кислота оказывает антигеморрагическое действие путем ингибирования фибринолитических свойств плазмина. Происходит формирование комплекса с участием транексамовой кислоты и плазминогена; транексамовая кислота связывается с плазминогеном при преобразовании с участием плазмина. Действие комплекса транексамовой кислоты и плазмина на активность фибрина ниже, чем действие только одного плазмина.

Данные исследований *in vitro* показали, что высокие дозы транексамовой кислоты уменьшали показатели активности указанного комплекса.

Педиатрическая популяция. Дети в возрасте от 1 года

В научной литературе описано 12 исследований эффективности в детской кардиохирургии с привлечением 1073 детей; из них 631 пациент получал транексамовую кислоту. Состояние большинства из них оценивали по сравнению с контрольной группой плацебо. Исследуемая популяция была гетерогенная по возрасту, типа хирургического вмешательства и дозировки. Результаты исследования применения транексамовой кислоты свидетельствуют об уменьшении потери крови и снижение необходимости применения препаратов крови в педиатрической кардиохирургии при использовании искусственного кровообращения (ИК) (кардиопульмональный ШК) во время операций с высоким

риском кровотечения, особенно у пациентов с цианозом или пациентов, которым проводят повторную операцию. Как было установлено, наиболее адаптированный режим дозирования может быть таким:

- первое введение (нагрузочная доза) - болюсная инфузия 10 мг/кг, вводить в период после первоначального наркоза и к разрезу кожи;
- непрерывное введение путем инфузии 10 мг/кг/ч или инъекционное введение в адаптер насоса ШК в дозе, скорректированная для процедуры указанного хирургического вмешательства или в дозе, рассчитанной в соответствии с массой тела пациентов - 10 мг/кг, или введение в адаптер насоса ШК и заключительная инъекция в дозе 10 мг/кг в конце хирургического вмешательства с применением ШК.

Некоторые данные позволяют предположить, что непрерывная инфузия является более приемлемой, поскольку она будет поддерживать терапевтическую концентрацию в плазме крови в течение операции. Не было проведено никаких специфических исследований соотношения доза/эффект с участием детей.

Фармакокинетика

Абсорбция. Максимальная концентрация транексамовой кислоты в плазме крови (C_{max}) быстро достигается после кратковременной инфузии, после чего показатели концентрации в плазме крови начинают снижаться мультиэкспоненциально.

Распределение. По терапевтическим уровням в плазме крови показатель связывания транексамовой кислоты с белками плазмы крови составляет приблизительно 3%; как считается, показатели связывания полностью объясняются связыванием с плазминогеном. Транексамовая кислота не связывается с альбумином. Начальный объем распределения составляет примерно от 9 до 12 литров.

Транексамовая кислота проникает через плацентарный барьер. После инъекции 10 мг/кг у беременных женщин концентрация транексамовой кислоты в сыворотке крови находится в диапазоне 10-53 мкг/мл, тогда как концентрация в пуповинной крови - в диапазоне 4-31 мкг/мл. Транексамовая кислота быстро проникает в синовиальную жидкость и ткани синовиальной оболочки. После инъекции 10 мг/кг у пациентов, перенесших операции на колене, показатели концентрации в суставной жидкости были подобны в сыворотке крови.

Показатели концентрации транексамовой кислоты в других тканях и жидкостях соотносятся с показателями, которые наблюдаются в крови (в грудном молоке - примерно 1/100, в цереброспинальной жидкости - примерно 1/10, во

внутриглазной жидкости - примерно 1/10). Транексамовая кислота была обнаружена в семенной жидкости, где она ингибирует фибринолитическую активность, но почти не влияет на миграцию (подвижность) сперматозоидов.

Выведение. Лекарственное средство выделяется в основном с мочой в виде неизмененного соединения. Уринарная экскреция через механизм клубочковой фильтрации является основным путем элиминации.

Почечный клиренс практически эквивалентен плазменному клиренсу (от 110 мл/мин до 116 мл/мин). Примерно 90% транексамовой кислоты выводится в течение первых 24 часов после введения препарата в дозе 10 мг/кг массы тела. Период полувыведения транексамовой кислоты составляет примерно 3 часа.

Особые группы пациентов. Плазменная концентрация увеличивается у пациентов с почечной недостаточностью. С участием детей не проводили никаких специфических фармакокинетических исследований.

Показания

Профилактика и лечение кровотечений, обусловленных генерализованным или местным фибринолизом 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 мочевых путей, возникших в связи с хирургическим вмешательством на предстательной железе или в результате оперативного вмешательства или процедур на мочевыводящих путях;
- операции в области ЛОР-органов (аденоидэктомия, тонзиллэктомия, экстракция зубов);
- 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 действующему веществу или к любому из вспомогательных веществ лекарственного средства;
- острый венозный или артериальный тромбоз (см. раздел «Особенности применения»);
- фибринолитические состояния после коагулопатии вследствие истощения, за исключением чрезмерной активации фибринолитической системы при острой тяжелой кровотоке (см. раздел «Особенности применения»);
- тяжелая почечная недостаточность (риск накопления);
- судороги в анамнезе;
- интратекальная и интравентрикулярная инъекция препарата, интрацеребральное применение (риск отека головного мозга и судом).

Несовместимость.

Это лекарственное средство не следует добавлять в кровь для переливания или в инъекционных растворов пенициллина.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Исследование взаимодействия не проводились.

Одновременный прием с антикоагулянтами необходимо осуществлять под строгим контролем врача, имеющего опыт в этой области.

Лекарственные средства, действующие на гемостаз, следует с осторожностью назначать пациентам, которые получают транексамовую кислоту.

Существует теоретический риск повышенного потенциала тромбообразования при применении с эстрогенами.

Антифибринолитическое действие препарата может быть подавлена тромболитиками.

Особенности применения

Следует строго придерживаться следующих рекомендаций:

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

Судороги

Зафиксированы случаи судорог в связи с лечением транексамовой кислотой. О большинстве из этих случаев сообщали после инъекции транексамовой кислоты в высоких дозах при операциях аортокоронарного шунтирования (АКШ). При применении в рекомендованных низких дозах транексамовой кислоты частота послеоперационных судорог была такой же, как и у пациентов, не применяли транексамовую кислоту.

Нарушение зрения

При применении препарата возможны расстройства зрения, включая снижение остроты зрения, помутнение зрения, нарушение цветового зрения. При необходимости следует прекратить. При непрерывном длительном применении раствора для инъекций транексамовой кислоты рекомендованы регулярные офтальмологические осмотры (осмотр глаз, в том числе остроты зрения, цветового зрения, глазного дна, поля зрения). При наличии патологических офтальмологических изменений, особенно при поражениях сетчатки, врач после консультации со специалистом должен определить необходимость долгосрочного применения раствора для инъекций транексамовой кислоты в каждом случае отдельно.

Гематурия

В случае гематурии из верхних мочевых путей существует риск обструкции уретры.

Тромбоэмболические осложнения

Перед применением транексамовой кислоты необходимо рассмотреть факторы риска тромбоэмболических осложнений. У пациентов с тромбоэмболические заболевания в анамнезе или с увеличенной их частотой в семейном анамнезе (пациенты с высоким риском тромбофилии) раствор для инъекций транексамовой кислоты следует назначать только тогда, когда есть строгое медицинское показания, после консультации специалиста, имеющего опыт в гемостазиологии и под строгим контролем (см. раздел «Противопоказания»).

Из-за повышенного риска тромбоза с осторожностью назначать пациентам, принимающим пероральные контрацептивы (см. Раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»).

ДВС

Пациенты с ДВС (ДВС) в большинстве случаев не должны применять препарат (см. Раздел «Противопоказания»). Применение транексамовой кислоты следует ограничить у пациентов с преобладающей активацией фибринолитической

системы при остром тяжелом кровотечении.

Обычно, гематологический профиль приближается к следующему: сокращение времени фибринолиза эуглобулинов; увеличение протромбинового времени; снижение плазменных уровней фибриногена, факторов V и VIII, плазминогена, фибринолизина и α 2-макроглобулина; нормальные плазменные уровни P и P-комплекса, то есть факторов II (протромбин), VIII и X; повышенные плазменные уровни продуктов распада фибриногена; нормальное количество тромбоцитов.

Вышеуказанное предусматривает, что патологическое состояние, лежит в основе, не меняет различные показатели этого профиля. В таких острых случаях разовой дозы транексамовой кислоты 1 г обычно достаточно, чтобы остановить кровотечение. Применение транексамовой кислоты при ДВС следует рассматривать только в случае наличия гематологического лабораторного оборудования и экспертизы.

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

Исследование влияния на способность управлять автотранспортом и другими механизмами не проводились.

Применение в период беременности или кормления грудью

Женщины репродуктивного возраста

Женщинам репродуктивного возраста следует использовать надежный метод контрацепции во время лечения.

Беременность

Существует недостаточно клинических данных по применению транексамовой кислоты беременным женщинам.

Хотя исследования на животных не указывают на тератогенное действие, препарат не рекомендуется применять во время первого триместра беременности.

Ограниченные клинические данные по применению транексамовой кислоты при различных клинических геморрагических состояниях во время II и III триместров не демонстрировали вредного влияния на плод. Транексамовую кислоту во время беременности применяют только тогда, когда ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

Период кормления грудью

Транексамовая кислота проникает в грудное молоко, поэтому кормление грудью не рекомендуется.

Фертильность

Отсутствуют клинические данные о влиянии транексамовой кислоты на фертильность.

Способ применения и дозы

Способ применения строго ограничивается медленной внутривенной инъекцией или инфузией.

Взрослые.

Если иное не предусмотрено, рекомендуются следующие дозы:

Стандартное лечение местного фибринолиза:

От 0,5 г до 1 г транексамовой кислоты вводить путем медленной инъекции или инфузии (= 1 мл/мин) 2 или 3 раза в сутки.

Стандартное лечение генерализованного фибринолиза:

1 г транексамовой кислоты вводить путем медленной инъекции или инфузии (= 1 мл/мин) каждые 6-8 часов, что эквивалентно 15 мг/кг массы тела.

Почечная недостаточность.

Применение транексамовой кислоты противопоказано пациентам с тяжелой почечной недостаточностью (см. Раздел «Противопоказания»). Для пациентов с легкой или умеренной почечной недостаточностью дозы транексамовой кислоты следует уменьшить 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 часов
>500	>5,65	5 мг/кг массы тела	каждые 24 часов

Печеночная недостаточность.

Для пациентов с печеночной недостаточностью коррекция дозы не требуется.

Пациенты пожилого возраста.

Снижение дозы не требуется при отсутствии почечной недостаточности.

Дети

Детям в возрасте от 1 года рекомендуется применение согласно текущим утвержденным терапевтическим показаниям, как описано в разделе «Показания», дозировка - примерно 20 мг/кг/сут. Данные по эффективности, дозировки и безопасности ограничены.

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

Передозировка

Не сообщалось об одном случае передозировки.

Признаки и симптомы могут включать головокружение, головная боль, артериальная гипотензия и судороги. Судороги обычно происходят чаще с увеличением дозы.

При передозировке проводят поддерживающую терапию.

Побочные реакции

Побочные реакции приведены в таблице в соответствии с классификацией по системам органов и частоте возникновения. В каждой частотной группе побочные реакции представлены в порядке уменьшения степени тяжести.

Классификация по системам органов	часто ($> 1/100$, $< 1/10$)	нечасто ($> 1/1000$, $< 1/100$)	частота неизвестна (не может быть оценена по имеющимся данным)
Со стороны иммунной системы			Реакции повышенной чувствительности, в том числе анафилаксия

Со стороны нервной системы			Судороги, особенно в случаях неправильного применения
Со стороны органов зрения			Визуальные нарушения, включая нарушения цветового зрения
Со стороны сердечно-сосудистой системы			Недомогание, вызванное гипотонией с потерей или без потери сознания (обычно после слишком быстрой инъекции, исключительно после перорального применения); артериальная или венозная тромбоэмболия любой локализации
Со стороны пищеварительной системы	Диарея, тошнота, рвота		
Со стороны кожи и подкожной клетчатки		Аллергический дерматит	

Срок годности

2 года.

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С. Не замораживать. Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 5 мл в ампулах, по 5 ампул в блистерах в коробке из картона.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

Общество с ограниченной ответственностью «Фармацевтическая компания «Здоровье».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Украина, 61013, Харьковская обл., город Харьков, улица Шевченко, дом 22.

Источник инструкции

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