

**ИНСТРУКЦИЯ**  
по медицинскому применению лекарственного средства  
**ТРАНЕКС-ЛФ**

**Торговое название**

Транекс-ЛФ.

**Международное непатентованное название**

Tranexamic acid.

**Описание**

Прозрачная бесцветная или со светло-коричневым оттенком жидкость.

**Состав**

5 мл раствора содержат:

*Действующее вещество:* транексамовая кислота – 250 мг;

*Вспомогательные вещества:* вода для инъекций – до 5 мл.

**Форма выпуска**

Раствор для внутривенного введения.

**Фармакотерапевтическая группа**

Гемостатические средства. Аминокислоты.

**Код АТХ**

B02AA02.

**Фармакологические свойства**

**Фармакодинамика**

Транексамовая кислота – антифибринолитическое действие, специфически ингибирующее активацию профибринолизина (плазминогена) и его превращение в фибринолизин (плазмин). Обладает системным гемостатическим действием при кровотечениях, связанных с повышенным фибринолизом. В исследованиях *in vitro* транексамовая кислота в высоких концентрациях снижала активность комплемента.

*Дети старше одного года*

Обзор литературы выявил 12 исследований эффективности применения транексамовой кислоты в детской кардиохирургии, в которые было включено 1073 ребенка, из них 631 получали транексамовую кислоту. Большинство исследований были плацебо-контролируемыми. Дети, включенные в исследования, были гетерогенны по возрасту, типу перенесенных операций, режимам дозирования. Результаты исследований транексамовой кислоты свидетельствуют о снижении потери крови и снижении потребности в препаратах крови в детской кардиохирургии сердечно-легочного шунтирования (СЛШ), где существует высокий риск кровотечения, особенно у пациентов с цианозом или пациентов, подвергающихся повторной операции. Наиболее адаптированным режимом дозирования оказался следующий:

- первый болюс 10 мг/кг после введения анестезии и до разреза кожи;

- непрерывная инфузия 10 мг/кг/ч или инъекция в СЛШ-насос в дозе, адаптированной к процедуре СЛШ, либо в соответствии с весом пациента с дозой 10 мг / кг, либо в соответствии с основным объемом насоса СЛШ, последняя инъекция 10 мг/кг в конце СЛШ.

При исследовании на небольшом количестве пациентов ограниченные данные свидетельствуют о том, что непрерывная инфузия предпочтительнее, поскольку она будет поддерживать терапевтическую концентрацию в плазме во время операции.

У детей не проводилось специального исследования зависимости "доза-эффект" или исследования фармакокинетики.

#### **Фармакокинетика**

Кривая "концентрация-время" имеет трехфазную форму с  $T_{1/2}$  в терминальной фазе 2 часа. В крови около 3% связано с белком (плазминогеном). Начальный объем распределения – 9-12 л. Легко проходит через гистогематические барьеры, включая ГЭБ, плацентарный. Проникает в грудное молоко (около 1% от концентрации в плазме матери). Концентрация в цереброспинальной жидкости составляет 1/10 от плазменной. Обнаруживается в семенной жидкости, где ингибирует фибринолитическую активность, но не влияет на миграцию сперматозоидов. Незначительная часть подвергается биотрансформации.

Антифибринолитическая концентрация в различных тканях сохраняется в течение 17 часов, в плазме – до 7-8 часов.

Основной путь экскреции – гломерулярная фильтрация. Более 95% (преимущественно в неизменном виде) экскретируется с мочой в течение первых 12 часов. Общий почечный клиренс равен плазменному (7 л/ч). Идентифицировано два метаболита транексамовой кислоты: N-ацетилированная и дезаминированная производные. При нарушении функции почек существует риск кумуляции транексамовой кислоты.

#### **Показания к применению**

– Профилактика и лечение кровотечений при системных и локальных нарушениях фибринолиза у взрослых и детей от одного года:

- меноррагии и метроррагии;
- желудочно-кишечные кровотечения;
- геморрагические осложнения при урологических операциях, включая хирургические вмешательства на предстательной железе и мочевом пузыре.

– При операциях на ЛОР органах и в стоматологии (аденоидэктомия, тонзилэктомия, экстракция зуба).

– При гинекологических операциях и акушерских кровотечениях, включая послеродовые кровотечения.

– Торакальная, абдоминальная и кардиохирургия и другие крупные хирургические вмешательства.

– Геморрагические осложнения фибринолитической терапии.

#### **Способ применения и дозы**

##### **Способ применения**

Внутривенно (строго медленно, капельно, струйно).

Транексамовая кислота может применяться совместно с большинством растворов для инфузий, таких как растворы электролитов, растворы углеводов, аминокислот, раствор декстрана. Гепарин может быть использован совместно с транексамовой кислотой.

Раствор транексамовой кислоты для внутривенного введения предназначен для однократного использования. Любое количество неиспользованного раствора должно быть утилизировано.

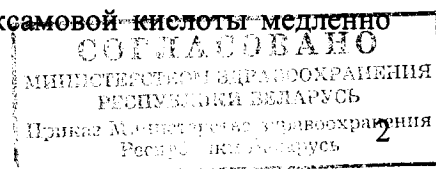
##### **Дозировка**

Если иное не установлено, рекомендованы следующие дозы:

1. Стандартная терапия локальных нарушений фибринолиза:

От 0,5 г (2 ампулы по 5 мл) до 1 г (4 ампулы по 5 мл) транексамовой кислоты медленно внутривенно (приблизительно 1 мл/мин) два-три раза в день.

2. Стандартная терапия системных нарушений фибринолиза:



1 г (4 ампулы по 5 мл) транексамовой кислоты медленно внутривенно (приблизительно 1 мл/мин) каждые 6-8 часов, что эквивалентно 15 мг/кг веса.

#### *Пациенты с нарушением функции почек*

В случае нарушения функции почек существует риск кумуляции лекарственного средства.

Пациентам с тяжелой почечной недостаточностью противопоказано применение транексамовой кислоты.

Пациентам с легкой и умеренной почечной недостаточностью дозировка транексамовой кислоты должна быть уменьшена в соответствии с уровнем креатинина в сыворотке крови:

<b>Креатинин в сыворотке крови</b>		<b>Доза внутривенно</b>	<b>Введение</b>
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
более 500	более 5,65	5 мг / кг массы тела	Каждые 24 часов

#### *Пациенты с нарушением функции печени*

Коррекции дозы пациентам с нарушением функции печени не требуется.

#### *Пациенты пожилого возраста*

При отсутствии нарушения функции почек уменьшение дозы у пациентов пожилого возраста не требуется.

#### *Применение у детей*

У детей старше 1 года доза составляет около 20 мг/кг/сутки. Данные о применении лекарственного средства у детей ограничены.

Эффективность и безопасность применения транексамовой кислоты у детей, перенесших операции на сердце, не были установлены. В настоящее время имеющиеся данные ограничены.

#### **Побочное действие**

Классификация частоты побочных эффектов: очень часто (>1/10 случаев), часто (>1/100 и <1/10 случаев), нечасто (>1/1000 и <1/100 случаев), редко (>1/10000 и <1/1000 случаев), очень редко (<1/10000 случаев), частота неизвестна (не может быть оценена на основании имеющихся данных).

*Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей:* нечасто – аллергический дерматит.

*Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта:* часто – диарея, рвота, тошнота; частота неизвестна – анорексия, изжога.

*Нарушения со стороны нервной системы:* частота неизвестна – судороги (особенно при неправильном применении).

*Нарушения со стороны органа зрения:* частота неизвестна – нарушение цветовосприятия и другие расстройства зрения.

*Нарушения со стороны сердечно-сосудистой системы:* частота неизвестна – различные расстройства (головокружение, слабость, сонливость, тахикардия, боль в грудной клетке), связанные с артериальной гипотензией, в ряде случаев с потерей сознания (как правило, вследствие слишком быстрого внутривенного введения лекарственного средства); тромбоз или тромбоэмболия любой локализации.

*Нарушения со стороны иммунной системы:* частота неизвестна – реакции гиперчувствительности (сыпь, кожный зуд, крапивница, анафилаксия).

#### **Противопоказания**

- Повышенная чувствительность к лекарственному средству.
- Субарахноидальное кровоизлияние.
- Острый венозный или артериальных тромбоз.
- Фибринолитические состояния, связанные с синдромом диссеминированного внутрисосудистого свертывания крови, за исключением состояний с преобладанием активации фибринолитической системы с острым сильным кровотечением.

- Тяжелая почечная недостаточность (возможна кумуляция).
- Судороги в анамнезе.
- Интратекальное, внутрижелудочковое введение, интрацеребральное применение (риск отека мозга и судорог).

### **Передозировка**

Основываясь на сообщениях, возможными симптомами передозировки могут быть:

Желудочно-кишечные кровотечения (тошнота, рвота, диарея); гипотензивные (ортостатическая гипотензия); тромбоэмболии (артериальные, венозные); неврологические (нарушения зрения, судороги, головная боль, изменения психического состояния; миоклонус); сыпь.

Лечение симптоматическое и патогенетическое.

### **Меры предосторожности**

Лекарственное средство следует применять строго по показаниям и в соответствии с указанным способом введения:

- Раствор вводится внутривенно очень медленно.
- Транексамовую кислоту нельзя вводить внутримышечно.

#### *Судороги*

Описаны случаи судорог, которые ассоциировались с применением транексамовой кислоты. У пациентов, которым проводилась операция аортокоронарного шунтирования, судороги, в большинстве случаев, развивались при применении транексамовой кислоты в высоких дозах. При применении лекарственного средства в более низких рекомендуемых дозах частота судорог после операции была такой же, как у пациентов, не получивших транексамовую кислоту.

#### *Нарушение зрения*

При продолжительном курсе лечения лекарственным средством, перед началом лечения и регулярно в процессе лечения необходимо проведение осмотра окулиста (острота зрения, цветовое зрение, глазное дно, поля зрения). У пациентов с нарушением цветового зрения лекарственное средство следует применять с осторожностью. При применении транексамовой кислоты возможны различные нарушения зрения, включая нечеткость зрительного восприятия, нарушение цветового зрения. В случае выявления нарушений со стороны органа зрения, следует решить вопрос о целесообразности дальнейшего лечения лекарственным средством и, при необходимости, прекратить его применение.

#### *Нарушение функции почек*

При нарушении выделительной функции почек необходима коррекция режима дозирования (см. раздел "Способ применения и дозы"). При тяжелой почечной недостаточности применение лекарственного средства противопоказано (возможна кумуляция).

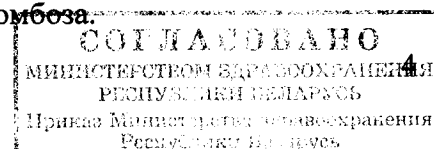
#### *Гематурия*

У пациентов с гематурией из верхних отделов мочевыводящих путей возможна обструкция кровяным сгустком. Следует соблюдать осторожность при применении лекарственного средства у данной категории пациентов.

#### *Тромбоэмболические события*

До начала применения транексамовой кислоты следует принять во внимание возможные факторы риска развития тромбоэмболических событий. Пациентам, имеющим в анамнезе тромбоэмболические заболевания, или пациентам с повышенной частотой случаев тромбоэмболических событий в семейном анамнезе (пациенты с высоким риском тромбофилии) лекарственное средство должно назначаться только по строгим медицинским показаниям после консультации со специалистом по гемостазу. Применение лекарственного средства у таких пациентов должно осуществляться под тщательным медицинским наблюдением.

Транексамовую кислоту следует с осторожностью назначать пациентам, получающим пероральные контрацептивы, вследствие повышенного риска тромбоза.



### *Синдром диссеминированного внутрисосудистого свертывания (ДВС) крови*

Применение транексамовой кислоты у пациентов с синдромом диссеминированного внутрисосудистого свертывания крови, в большинстве случаев, противопоказано. Транексамовая кислота может быть назначена таким пациентам только в случае, если у пациента имеются симптомы преобладания активации фибринолитической системы с острым сильным кровотечением. Для таких пациентов, в целом, характерны такие данные гематологического профиля: укорочение времени лизиса эуглобулинового сгустка, удлинение протромбинового времени, уменьшение концентрации в плазме фибриногена, факторов V и VIII, плазминогена и его активаторов, альфа-2 макроглобулина; нормальные концентрации в плазме фактора II (протромбина), факторов VIII и X; повышение концентрации в плазме продуктов деградации фибрина; нормальное количество тромбоцитов. Предполагается, что основное заболевание не модифицирует отдельные показатели гематологического профиля. В таких острых случаях однократного введения транексамовой кислоты в дозе 1 г часто бывает достаточно для прекращения кровотечения. Назначение транексамовой кислоты при синдроме ДВС крови должно производиться только при наличии соответствующих данных лабораторного обследования и после экспертизы этих данных специалистом.

### *Применение у детей*

Данные по эффективности и безопасности применения лекарственного средства у детей ограничены.

### **Применение при беременности и в период кормления грудью**

Транексамовая кислота проникает через плацентарный барьер и в грудное молоко (около 1% от концентрации в плазме матери).

При назначении лекарственного средства следует тщательно оценить предполагаемую пользу и потенциальный риск терапии, т.к. данные о клинических исследованиях безопасности применения транексамовой кислоты во время беременности отсутствуют.

### **Влияние на способность к управлению транспортными средствами или потенциально опасными механизмами**

Данные о влиянии лекарственного средства на способность управлять транспортом или другими механизмами отсутствуют.

### **Взаимодействие с другими лекарственными средствами**

Специальные исследования не проводились.

Одновременное применение с антикоагулянтами возможно только под контролем специалиста в области гемостазиологии. Лекарственные средства, влияющие на гемостаз, следует с осторожностью применять у пациентов, получающих транексамовую кислоту. Например, при одновременном применении с эстрогенами теоретически имеется повышенный риск тромбообразования. В свою очередь, лекарственные средства с антифибринолитическим действием могут проявлять антагонизм в отношении лекарственных средств с тромболитическим действием. При совместном применении с гемостатическими лекарственными средствами и гемокоагулазой возможна активация тромбообразования.

Фармацевтически несовместим с препаратами крови, растворами, содержащими пенициллин, урокиназой, гипертензивными средствами (норэпинефрином, дезоксиэпинефрином), тетрациклинами, дипиридамолом, диазепамом.

### **Условия хранения**

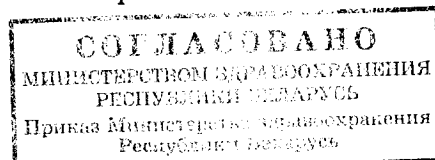
В защищенном от света месте при температуре не выше 25°C. Не замораживать.

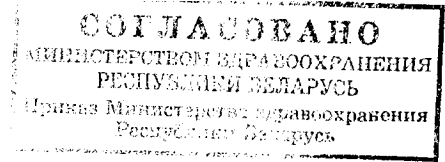
Хранить в недоступном для детей месте.

### **Срок годности**

2 года.

Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.





**Упаковка**

По 5 мл раствора для внутривенного введения в ампулы из бесцветного стекла с кольцом излома.

По 5 ампул в ячейковую упаковку из поливинилхлорида. По 1 или 2 ячейковые упаковки вместе с инструкцией по медицинскому применению в пачку из картона.

**Условия отпуска**

По рецепту.

**Информация о производителе**

СООО "Лекфарм", Республика Беларусь, 223141, г. Логойск, ул. Минская, д. 2а

Тел./факс: (01774)-53801 e-mail: office@lekpharm.by