

## Тропиндол



### Код АТХ:

- [A04AA03](#)

### Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- [Трописетрон](#)

### Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#) [Апрель](#)  
[Госреестр](#)<sup>МНН</sup> [Википедия](#)<sup>МНН</sup>  
[PLC VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)<sup>англ</sup>

### Форма выпуска:

<b>Капсулы</b>	<b>1 капс.</b>
трописетрон	5 мг

5 шт. - банки темного стекла (1) - пачки картонные.  
10 шт. - банки темного стекла (1) - пачки картонные.  
5 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.  
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.

### Фармакотерапевтическая группа:

- [Интермедианты](#)
- [Органотропные средства](#)

### Фармакологические свойства:

#### Фармакодинамика

Трописетрон - сильнодействующий и высокоселективный конкурентный антагонист центральных и периферических 5-HT<sub>3</sub>-рецепторов. Эффективно предупреждает и устраняет тошноту и рвоту, возникающие при проведении противоопухолевой химиотерапии и в послеоперационном периоде. В основе механизма противорвотного действия трописетрона лежит блокада периферических пресинаптических 5-HT<sub>3</sub>- рецепторов, что предотвращает выделение серотонина из энтерохромаффинных клеток слизистой желудочно-кишечного тракта. Трописетрон, кроме того, оказывает прямое блокирующее действие на 5-HT<sub>3</sub>-рецепторы, расположенные в ЦНС, в том числе в *area postrema*, тем самым блокируя влияние блуждающего нерва на эту область.

Длительность действия Тропиндола составляет 24 ч, что позволяет применять его один раз в день. Эффективность препарата сохраняется на протяжении многократных циклов химиотерапии. Тропиндол не вызывает экстрапирамидных побочных эффектов.

#### Фармакокинетика

**Всасывание**

Тропиндол всасывается из желудочно-кишечного тракта почти полностью (более чем на 95%). Период полувыведения составляет в среднем около 20 мин; время достижения  $C_{max}$  - около 3 ч. Биодоступность препарата составляет около 60% для дозы 5 мг. С увеличением дозы биодоступность возрастает, достигая почти 100% для дозы 45 мг.

**Распределение**

Неспецифическое связывание трописетрона с белками плазмы (преимущественно с альфа 1-гликопротеинами) составляет 71%.  $V_d$  у взрослых составляет от 400 до 600 л; у детей в возрасте от 3 до 6 лет - около 145 л; у детей в возрасте от 7 до 15 лет - примерно 265 л.

**Метаболизм**

Трописетрон метаболизируется в печени путем реакций гидроксилирования с последующим глюкуронированием или сульфатированием. Метаболиты фармакологически неактивны. При повторных назначениях Тропиндола в дозах, превышающих терапевтические (по 10 мг 2 раза в день), возможно дозозависимое повышение уровней трописетрона в плазме по причине снижения его метаболизма, связанного с насыщением ферментной системы печени. Однако при соблюдении рекомендованного режима дозирования концентрации препарата в плазме не превышают переносимых значений.

Метаболизм трописетрона имеет связь с генетически детерминированным полиморфизмом спартеина/дебризохина.

**Выведение**

Трописетрон выводится преимущественно почками - 70% (в виде метаболитов) и 8% (в неизменном виде), через кишечник - 15% (в виде метаболитов). Доля неизменного препарата в моче выше у "медленных окислителей". Соотношение содержания метаболитов в моче и кале составляет 5:1. У лиц с быстрым метаболизмом трописетрона ("быстрые окислители") период полувыведения (бета-фаза) составляет около 8 ч; у "медленных окислителей" этот показатель может удлиниться до 45 ч. Общий клиренс трописетрона составляет около 1 л/мин, при этом почечный клиренс составляет около 10% от этой величины. У "медленных окислителей" общий клиренс снижен до 0.1 -0.2 л/мин (за счет уменьшения внепочечного клиренса), что приводит к 4-5- кратному удлинению периода полувыведения и к 5-7-кратному повышению значений AUC, при этом такие показатели как  $C_{max}$  и  $V_d$  не меняются.

У детей значения таких показателей как биодоступность и конечный период полувыведения сходны с таковыми у взрослых здоровых добровольцев.

**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.

**Относится к болезням:**

- [Тошнота](#)

**Противопоказания:**

- повышенная чувствительность к трописетрону, другим антагонистам 5-НТ<sub>3</sub>-рецепторов или любым другим компонентам, входящим в состав препарата;
- Тропиндол не следует применять в период беременности и лактации.

С осторожностью: артериальная гипертензия.

**Способ применения и дозы:**

*Предупреждение тошноты и рвоты, возникающих вследствие противоопухолевой химиотерапии*

**Дети**

---

У детей старше 2-х лет рекомендуемая доза Тропиндола составляет 0.2 мг/кг, причем максимальная суточная доза - 5 мг.

#### *Взрослые*

Взрослым Тропиндол рекомендуется в виде 6-дневных курсов по 5 мг/сут. Капсулы следует принимать утром, запивая водой, сразу же после вставания, за 1 ч до приема пищи.

### **Побочное действие:**

При применении препарата в рекомендуемых дозах нежелательные эффекты имеют преходящий характер. При применении Тропиндола в дозе 2 мг наиболее часто сообщалось о развитии головной боли. При использовании препарата в дозе 5 мг часто отмечался запор и реже - головокружение, повышенная утомляемость и нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта (боли в животе и диарея).

Так же как и в случае применения других антагонистов 5-HT<sub>3</sub>-рецепторов, редко наблюдались реакции гиперчувствительности ("реакции I-го типа"), характеризовавшиеся одним или несколькими следующими симптомами: чувство прилива крови к лицу и/или генерализованная крапивница, чувство тяжести за грудиной, одышка, остро развивающийся бронхоспазм, артериальная гипотензия.

Сообщалось об очень редких случаях коллапса, обморока или остановки сердца, но причинная связь этих явлений с применением Тропиндола не была установлена. Некоторые из них могли быть обусловлены сопутствующей терапией или основным заболеванием.

### **Применение при беременности и кормлении грудью:**

Тропиндол не следует применять в период беременности и лактации.

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

Прием капсулы препарата вместе с едой приводит к небольшому увеличению биодоступности трописетрона (приблизительно с 60% до 80%), что не имеет клинического значения.

Одновременное применение Тропиндола с рифампицином или с другими лекарственными средствами, индуцирующими ферментные системы печени (например, с фенобарбиталом), приводит к снижению концентраций трописетрона в плазме. Поэтому у пациентов, являющихся "быстрыми окислителями", необходимо повышение доз Тропиндола (у "медленных окислителей" этого не требуется). Влияние препаратов, ингибирующих ферментную систему цитохрома P450, например, циметидина, на концентрацию трописетрона в плазме незначительно, поэтому изменений дозирования Тропиндола в таких случаях не требуется.

Исследования взаимодействия Тропиндола со средствами для наркоза не проводились.

Удлинение интервала QTc было отмечено у нескольких пациентов, которым Тропиндол назначался в сочетании с препаратами, вызывающими удлинение этого интервала. В то же время, в тех исследованиях, где применялся только один Тропиндол в терапевтических дозах, удлинение интервала QTc отмечено не было. Тем не менее, следует соблюдать осторожность при одновременном применении Тропиндола и препаратов, вызывающих удлинение интервала QTc.

### **Особые указания и меры предосторожности:**

*Применение у лиц, относящихся к категории "медленных окислителей" спартеина/дебризохина*

У пациентов, относящихся к данной категории (они составляют примерно 8% от популяции лиц европеоидной расы), период полувыведения трописетрона удлиннен (в 4-5 раз по сравнению с лицами, интенсивно метаболизирующими спартеин/дебризохин). Однако, при в/в введении Тропиндола дважды в день в дозах до 40 мг в течение 7 дней здоровым добровольцам, относящимся к категории "медленных окислителей", серьезных нежелательных явлений отмечено не было. Эти наблюдения указывают на то, что при проведении 6-дневных курсов лечения пациентов, относящихся к категории "медленных окислителей", необходимости в снижении обычной суточной дозы препарата, составляющей 5 мг, не возникает.

*Применение у пациентов с нарушениями функции печени или почек*

У пациентов с острым гепатитом или с жировой дистрофией печени изменений фармакокинетики трописетрона не отмечается. В противоположность этому, у пациентов с циррозом печени или нарушениями функции почек

## Тропиндол

Фармакологическая база данных (<http://drugs.thead.ru>)

---

концентрации трописетрона в плазме могут превышать (максимально на 50%) те показатели, которые выявляются у здоровых добровольцев, относящихся к группе интенсивно метаболизирующих спартеин/дебризохин. Тем не менее, если таким пациентам Тропиндол назначается в виде рекомендуемых 6-дневных курсов по 5 мг/сут, уменьшать дозу препарата не требуется.

### *Применение у пациентов с артериальной гипертонией*

У пациентов с неконтролируемой артериальной гипертонией следует избегать применения Тропиндола в суточных дозах, превышающих 10 мг, так как это может привести к дальнейшему повышению АД.

### *Применение у пациентов с заболеваниями сердца*

Следует соблюдать осторожность у пациентов с нарушениями сердечного ритма и проводимости, а также у пациентов, которым проводится лечение антиаритмическими препаратами или бета-адреноблокаторами, так как имеющийся опыт одновременного применения и средств для наркоза в таких случаях ограничен.

### *Применение у детей*

Отмечено, что у детей старше 2-х лет переносимость Тропиндола была хорошей.

### *Примечание у пациентов пожилого возраста*

Нет данных, которые свидетельствовали бы о том, что у пациентов пожилого возраста (по сравнению с более молодыми пациентами) требуется применение иных доз Тропиндола, или о том, что у них могут возникать какие-либо другие побочные реакции.

### *Применение в периоды беременности и лактации*

Тропиндол не должен назначаться в период беременности, поскольку его применение у данного контингента пациентов не изучено.

Неизвестно, экскретируется ли трописетрон в грудное молоко у человека, поэтому пациентки, принимающие Тропиндол, не должны кормить грудью.

### *Влияние на способность водить автомашину и работать с механизмами*

Данных о влиянии Тропиндола на способность водить автомобиль не имеется. Следует принимать во внимание существование таких побочных действий, как головокружение и усталость.

### **При нарушениях функции почек**

У пациентов с нарушениями функции почек концентрации трописетрона в плазме могут превышать (максимально на 50%) те показатели, которые выявляются у здоровых добровольцев, относящихся к группе интенсивно метаболизирующих спартеин/дебризохин. Тем не менее, если таким пациентам Тропиндол назначается в виде рекомендуемых 6-дневных курсов по 5 мг/сут, уменьшать дозу препарата не требуется.

### **При нарушениях функции печени**

У пациентов с острым гепатитом или с жировой дистрофией печени изменений фармакокинетики трописетрона не отмечается. В противоположность этому, у пациентов с циррозом печени концентрации трописетрона в плазме могут превышать (максимально на 50%) те показатели, которые выявляются у здоровых добровольцев, относящихся к группе интенсивно метаболизирующих спартеин/дебризохин. Тем не менее, если таким пациентам Тропиндол назначается в виде рекомендуемых 6-дневных курсов по 5 мг/сут, уменьшать дозу препарата не требуется.

### **Применение в пожилом возрасте**

Нет данных, которые свидетельствовали бы о том, что у пациентов пожилого возраста (по сравнению с более молодыми пациентами) требуется применение иных доз Тропиндола, или о том, что у них могут возникать какие-либо другие побочные реакции.

### **Применение в детском возрасте**

Препарат назначается детям от 2-х лет и старше по показаниям. Отмечено, что у детей старше 2-х лет переносимость Тропиндола была хорошей.

## **Условия хранения:**

Список Б.

Препарат следует хранить в сухом, защищенном от света и недоступном для детей месте.

## **Тропиндол**

Фармакологическая база данных (<http://drugs.thead.ru>)

---

### **Срок годности:**

2 года.

### **Условия отпуска в аптеке:**

По рецепту.

**Источник:** <http://drugs.thead.ru/Тропиндол>