Тропиндол



Код АТХ:

- A04AA03

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Трописетрон

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Капсулы	**1 капс.**
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 S-HT_3-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-НТ3- рецепторов, что предотвращает выделение серотонина из энтерохромаффинных клеток слизистой желудочно-кишечного тракта. Трописетрон, кроме того, оказывает прямое блокирующее действие на 5-HT_3-рецепторы, расположенные в ЦНС, в том числе в areapostrema, 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

Всасысание

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 неизмененного 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 удлиняться 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 биодоступностъ 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-HT_3-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_3-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 Р450. 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 удлинен (в 4-5 раз по сравнению с лицами, интенсивно метаболизируюшими 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

концентрации трописетрона в плазме могут превышать (максимально на 50%) те показатели, которые выявляются у здоровых добровольцев, относящихся к труппе 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.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Tropindol