

პროდუქტის ზოგადი დახასიათება

1 სამკურნალო საშუალების დასახელება

ტრიფასი® 10

2 თვისებრივი და რაოდენობრივი შემადგენლობა

ტრიფასი® 10

ერთი ტაბლეტი შეიცავს 10 მგ ტორასემიდს.

დამხმარე ნივთიერება ცნობილი მოქმედებით

ერთი ტაბლეტი შეიცავს 116 მგ ლაქტოზის მონოჰიდრატს.

დამხმარე ნივთიერებების სრული ჩამონათვალი იხილეთ პარაგრაფში 6.1.

3 სამკურნალწამლო ფორმა

ტაბლეტები

ტრიფასი® 10

თეთრი, მრგვალი, ბრტყელი ტაბლეტები ჩამოჭრილი კიდეებით და გამყოფი ხაზით ერთ მხარეს.

ტაბლეტის გაყოფა შეიძლება ორ თანაბარ ნაწილად.

4 კლინიკური მახასიათებლები

4.1 გამოყენების ჩვენება

გულის უკმარისობით გამოწვეული გულის შეშუპების ან/და სითხის შეკავების მკურნალობა და რეციდივის პროფილაქტიკა.

ტრიფასი® 10 განკუთვნილია მოზრდილებში გამოსაყენებლად.

4.2 დოზირება და გამოყენების წესი

დოზირება

მკურნალობას იწყებენ 5 მგ ტორასემიდით დღე-ღამეში. ჩვეულებრივ, ამ დოზას იყენებენ შემანარჩუნებელი მკურნალობისთვისაც.

არასათანადო ეფექტის შემთხვევაში ტორასემიდის დოზის გაზრდა შეიძლება 20 მგ-მდე დღე-ღამეში, კლინიკური სურათის სიმძიმის მიხედვით.

დღე-ღამეში 5 მგ ტორასემიდზე ორგანიზმის არასათანადო რეაქციის შემთხვევაში დოზას ზრდიან 10 მგ-მდე.

ასეთ შემთხვევაში ინიშნება 10 მგ ტორასემიდი დღე-ღამეში, რომელიც, მდგომარეობის სიმძიმის მიხედვით, შეიძლება გაიზარდოს 20 მგ-მდე/დღე-ღამეში.

პედიატრიული პროფილის პაციენტები

ბავშვებსა და 18 წლამდე ასაკის მოზარდებში პრეპარატ ტრიფასი® 10-ის უსაფრთხოება და ეფექტიანობა დადგენილი არ არის. ამასთან დაკავშირებით, ბავშვებსა და 18 წლამდე ასაკის მოზარდებში ტორასემიდის უკუნაჩვენებია (იხ. პარაგრაფი 4.4).

ხანდაზმული პაციენტები

ხანდაზმულ პაციენტებში დოზის შეცვლის საჭიროება არ არსებობს. თუმცა, ახალგაზრდა და ხანდაზმულ პაციენტებში პრეპარატის მოქმედების შესადარებელი საიმედო კვლევები არ ჩატარებულა.

ღვიძლის უკმარისობა

პრეპარატი სიფრთხილით ინიშნება ღვიძლის უკმარისობის მქონე პაციენტებში, რადგან ამ შემთხვევაში შესაძლებელია ტორასემიდის პლაზმური კონცენტრაციის მომატება (იხ. პარაგრაფი 5.2).

გამოყენების წესი

პრეპარატი მიიღება დილით, მცირე რაოდენობის სითხის მიყოლებით. საკვები არ ახდენს გავლენას ტორასემიდის ბიოშელწევადობაზე.

რეკომენდაციები ტაბლეტების გაყოფასთან დაკავშირებით:

ტრიფასი® 10:

დაიჭირეთ ტაბლეტი ორივე ხელის საჩვენებელი და ცერა თითებით გამყოფი ხაზით ზემოთ, დააჭირეთ ცერა თითებით გამყოფი ხაზის გასწვრივ და გადატეხეთ ტაბლეტი.

ჩვეულებრივ, ტრიფასი® 10 გამოიყენება ხანგრძლივი დროის განმავლობაში ან შეშუპების გამოხატულების შემცირებამდე.

4.3 უკუჩვენება

- მომატებული მგრძნობელობა მოქმედი ნივთიერების ტორასემიდის, სულფონილშარდოვანას წარმოებულების ან პრეპარატ ტრიფასი® 10-ის ნებისმიერი დამხმარე ნივთიერების მიმართ, რომლებიც ჩამოთვლილია პარაგრაფში 6.1.
- თირკმელების უკმარისობა ანუროთ
- ღვიძლის კომა ან პრეკომა
- არტერიული ჰიპოტონია
- ჰიპოვოლემია
- ჰიპონატრიემია, ჰიპოკალიემია

- შარდვის გამოხატული დარღვევები (მაგალითად, წინამდებარე ჯირკვლის ჰიპერტროფიასთან დაკავშირებით)
- ლაქტაცია (იხ. პარაგრაფი 4.6)

4.4 განსაკუთრებული მითითება და სიფრთხილის ზომები გამოყენებისას

კლინიკური გამოყენების არასაკმარისი გამოცდილების გამო დღეისათვის ტორასემიდი უკუნაჩვენებია შემდეგი მდგომარეობების დროს:

- პოდაგრა
- გულის არითმია (მაგალითად, სინოატრიალური ბლოკადა, მე-2 და მე-3 ხარისხის AV-ბლოკადა)
- მჟავა-ტუტოვანი ბალანსის დარღვევები
- ლითიუმის პრეპარატებით, ამინოგლიკოზიდებით ან ცეფალოსპორინებით თანმხლები მკურნალობა
- სისხლის უჩრედული შემადგენლობის პათოლოგიური ცვლილებები (მაგალითად, თრომბოციტოპენია ან ანემია თირკმელების უკმარისობის გარეშე).
- თირკმელების უკმარისობა, დაკავშირებული ნეფროტოქსიკური ნივთიერებების მოქმედებასთან
- ბავშვები და 18 წლამდე ასაკის მოზარდები

პრეპარატ ტრიფასი® 10-ის გამოყენებამ შესაძლოა, გამოიწვიოს დოპინგის ანალიზების დადებითი შედეგი.

პრეპარატ ტრიფასი® 10-ის დოპინგის სახით არასათანადო გამოყენების შედეგების წინასწარ განსაზღვრა შეუძლებელია; ამ შემთხვევაში პრეპარატის გამოყენება შესაძლოა, მავნე იყოს ჯანმრთელობისთვის.

პრეპარატი ტრიფასი® 10 შეიცავს ლაქტოზას. პრეპარატი არ უნდა მიიღონ პაციენტებმა იშვიათი მემკვიდრეობითი დაავადებებით, როგორცაა გალაქტოზის აუტანლობა, ლაქტაზის დეფიციტი ან გლუკოზა-გალაქტოზის შეწოვის დარღვევა.

4.5 ურთიერთქმედება სხვა სამკურნალო საშუალებებთან და ურთიერთქმედების სხვა ფორმები

აღნიშნულია შემდეგი სახის ურთიერთქმედება:

ტორასემიდი აძლიერებს სხვა ჰიპოტენზიური პრეპარატების, განსაკუთრებით აგფ ინჰიბიტორების ეფექტს. აგფ ინჰიბიტორების ერთდროულად ან ტორასემიდით მკურნალობის დასრულებისთანავე დანიშნისას შესაძლებელია არტერიული წნევის ძლიერი დაქვეითება.

ტორასემიდიტ მკურნალობის ფონზე ჰიპოკალიემიამ შეიძლება გამოიწვიოს საგულე გლიკოზიდების არასასურველი მოვლენების პროვოცირება ან გაძლიერება მათი ერთდროულად გამოყენების შემთხვევაში.

ტორასემიდს შეუძლია შეასუსტოს დიაბეტის საწინააღმდეგო საშუალებების მოქმედება.

პრობენეციდს და არასტეროიდულ ანთების საწინააღმდეგო საშუალებებს (მაგალითად, ინდომეტაცინს, აცეტილსალიცილის მჟავას) შეუძლია შეამციროს ტორასემიდის შარდმდენი და ჰიპოტენზიური მოქმედება.

ტორასემიდს შეუძლია გააძლიეროს სალიცილატების მაღალი დოზების ტოქსიკური მოქმედება ცენტრალურ ნერვულ სისტემაზე.

ტორასემიდს შეუძლია გამოიწვიოს შემდეგი გვერდითი მოვლენების გაძლიერების პროვოცირება, განსაკუთრებით მაღალი დოზების გამოყენებისას:

ამინოგლიკოზიდების ჯგუფის ანტიბიოტიკების (მაგალითად, კანამიცინი, გენტამიცინი, ტობრამიცინი), პლატინის წარმოებულების ჯგუფის ციტოსტატიკების ოტო- და ნეფროტოქსიკური მოქმედება, ასევე ცეფალოსპორინების ნეფროტოქსიკური მოქმედება.

ტორასემიდს შეუძლია გააძლიეროს თეოფილინის მოქმედება და კურარეს მსგავსი პრეპარატებით გამოწვეული მიორელაქსაცია.

საფაღარათო საშუალებებს, მინერალო- და გლუკოკორტიკოიდებს შეუძლია გააძლიეროს ტორასემიდიტ გამოწვეული კალიუმის გამოყოფა.

ტორასემიდისა და ლითიუმის პრეპარატების ერთდროულად გამოყენებისას შესაძლებელია სისხლში ლითიუმის კონცენტრაციის მომატება და შედეგად მისი ტოქსიკური მოქმედების გაძლიერება.

ტორასემიდს შეუძლია შეასუსტოს კატექოლამინებით (მაგალითად, ეპინეფრინით, ნორეპინეფრინით) გამოწვეული ვაზოკონსტრიქცია.

ერთდროულად გამოყენებისას ქოლესტირამინს შეუძლია შეამციროს ტორასემიდის შეწოვა კუჭ-ნაწლავის ტრაქტში და შეასუსტოს მისი მოქმედება.

4.6 ფერტილობა, ორსულობა და ლაქტაცია

ორსულობა

ორსულებში ტორასემიდის გავლენის შესახებ ცნობები არ არსებობს ან შეზღუდულია. ლაბორატორიულ ცხოველებზე ჩატარებულ კვლევებში აღნიშნულია პრეპარატის ტოქსიკურობის ნიშნები რეპროდუქციის ორგანოების მიმართ. ამავე კვლევებში ნაჩვენებია, რომ ტორასემიდი გადის პლაცენტურ ბარიერს (იხ. პარაგრაფი 5.3). ამიტომ, ორსულობის პერიოდში პრეპარატ ტრიფასი® 10-ის გამოყენება რეკომენდებული არ არის.

ახალი ინფორმაციის მიღებამდე ორსულობის პერიოდში ტორასემიდის გამოყენება დასაშვებია მხოლოდ დასაბუთებული ჩვენების შემთხვევაში. ორსულებში პრეპარატი ინიშნება მინიმალური ეფექტიანი დოზით.

რეკომენდებული არ არის დიურეზიკების გამოყენება სტანდარტული თერაპიის სახით ორსულობის დროს არტერიული ჰიპერტენზიის და შეშუპების შემთხვევაში, რადგან ამ პრეპარატებმა შეიძლება დაარღვიოს სისხლის მიმოქცევა პლაცენტაში და გავლენა მოახდინოს ნაყოფის განვითარებაზე. ორსულებში გულის ან თირკმელების უკმარისობის სამკურნალოდ ტორასემიდის დანიშვნისას საჭიროა სისხლის ელექტროლიტური შემადგენლობის და ჰემატოკრიტის გულდასმით კონტროლი, ასევე ნაყოფის განვითარებაზე დაკვირვება.

ლაქტაცია

დღემდე დადგენილი არ არის, გამოიყოფა თუ არა ტორასემიდი ცხოველების ან ადამიანის რძეში. არ შეიძლება გამოირიცხოს ახალშობილებში/ჩვილებში პრეპარატის გამოყენების რისკი. ამიტომ, ლაქტაციის პერიოდში ტორასემიდის გამოყენება უკუნაჩვენებია (იხ. პარაგრაფი 4.3). თუ ლაქტაციის პერიოდში საჭიროა ტორასემიდით მკურნალობა, ძუძუთი კვება უნდა შეწყდეს.

ფერტილობა

ადამიანში ფერტილობაზე ტორასემიდის გავლენის თვალსაზრისით კვლევები არ ჩატარებულა. ცხოველებზე ჩატარებულ კვლევებში ტორასემიდის გავლენა ფერტილობაზე გამოვლენილი არ იყო.

4.7 ზემოქმედება სატრანსპორტო საშუალებების მართვის და მექანიზმებთან მუშაობის უნარზე

სწორად გამოყენების შემთხვევაშიც კი ტორასემიდს შეუძლია იმდენად შეცვალოს რეაქციის სიჩქარე, რომ პაციენტი ვერ შეძლებს საგზაო მოძრაობაში მონაწილეობას, მექანიკურ ტექნიკასთან ან არამყარი წონასწორობის პირობებში მუშაობას. ყველაზე ხშირად ასეთი ცვლილებები აღინიშნება მკურნალობის დასაწყისში, დოზის გაზრდისას ან პრეპარატის შეცვლისას, ასევე დამატებითი პრეპარატების დანიშვნისას ან ალკოჰოლის მოხმარებისას.

4.8 გვერდითი მოქმედება

პრეპარატ ტრიფასი® 10-ით მკურნალობისას შეიძლება გამოვლინდეს ქვემოთ მითითებული გვერდითი მოვლენები.

გვერდითი მოქმედების განვითარების სიხშირის შეფასებას საფუძვლად უდევს შემდეგი კრიტერიუმები:

ძალიან ხშირად:	$\geq 1/10$
ხშირად:	$\geq 1/100 - < 1/10$
ზოგჯერ:	$\geq 1/1000 - < 1/100$
იშვიათად:	$\geq 1/10000 - < 1/1000$
ძალიან იშვიათად:	$< 1/10000$
უცნობია:	არსებული მონაცემებით შეფასება შეუძლებელია

სისხლისა და ლიმფური სისტემის პათოლოგია

ძალიან იშვიათად: თრომბოციტების, ერითროციტების ან/და ლეიკოციტების დონის დაქვეითება.

დარღვევები იმუნური სისტემის მხრივ

ძალიან იშვიათად: ალერგიული რეაქციები (მაგალითად, კანის ქავილი, ეგზანთემა, ფოტოსენსიბილიზაცია), კანის მხრივ მძიმე რეაქციები.

კვებისა და ნივთიერებათა ცვლის დარღვევები

ხშირად: მეტაბოლური ალკალოზის გაღრმავება, კუნთების კრუნჩხვა (განსაკუთრებით მკურნალობის დასაწყისში), სისხლში შარდმჟავას, გლუკოზისა და ცხიმების (ტრიგლიცერიდების, ქოლესტერინის) კონცენტრაციების მომატება, ჰიპოკალიემია (კალიუმის დაბალი შემცველობით თანმხლები დიეტის, ღებინების, დიარეის, საფადართო საშუალებების მავნედ მოხმარების, ასევე ღვიძლის ფუნქციის ქრონიკული დარღვევის დროს).

დოზისა და მკურნალობის ხანგრძლივობის მიხედვით შესაძლებელია წყალ-ელექტროლიტური ბალანსის დარღვევები, კერძოდ, ჰიპოვოლემია, ჰიპოკალიემია ან/და ჰიპონატრიემია.

სისხლძარღვოვანი დარღვევები

ძალიან იშვიათად: შესაძლებელია, თრომბოემბოლური გართულებები, ცნობიერების არევა, არტერიული ჰიპოტენზია, ასევე გულის და ცენტრალური სისხლის მიმოქცევის დარღვევები (მიოკარდიუმისა და თავის ტვინის იშემიის ჩათვლით) ჰემოკონცენტრაციასთან დაკავშირებით. ამას შეიძლება, თან ახლდეს არითმია, სტენოკარდია, მიოკარდიუმის მწვავე ინფარქტი ან გულის წასვლა.

დარღვევები კუჭ-ნაწლავის ტრაქტის მხრივ

ხშირად: დარღვევები კუჭ-ნაწლავის ტრაქტის მხრივ (მაგალითად, უმადობა, ტკივილი კუჭის არეში, გულისრევა, ღებინება, დიარეა, შეკრულობა), განსაკუთრებით მკურნალობის დასაწყისში.

ძალიან იშვიათად: პანკრეატიტი.

დარღვევები ღვიძლისა და ნაღვლგამომყოფი გზების მხრივ

ხშირად: სისხლში ღვიძლის გარკვეული ფერმენტების (გამა-გლუტამილტრანსფერაზას) კონცენტრაციის მაჩვენებლების მომატება.

დარღვევები თირკმელებისა და საშარდე გზების მხრივ

ზოგჯერ: სისხლში კრეატინინისა და შარდოვანას კონცენტრაციის გაზრდა.

შარდვის დარღვევების დროს (მაგალითად, წინამდებარე ჯირკვლის ჰიპერტროფიის დროს) შარდის წარმოქმნის მომატებას შეიძლება თან ახლდეს შარდვის შეკავება და შარდის ბუშტის დაჭიმულობა.

ზოგადი დარღვევები და რეაქციები პრეპარატის შეყვანის ადგილზე

ხშირად: თავის ტკივილი, თავბრუსხვევა, მომატებული დაღლილობა, სისუსტე (განსაკუთრებით მკურნალობის დასაწყისში).

ზოგჯერ: ქსეროსტომია, პარესთეზია.

ძალიან იშვიათად: მხედველობის დარღვევა, ხმაური ყურებში, სმენის დარღვევა.

მითითება

ტორასემიდიით ხანგრძლივი მკურნალობისას რეკომენდებულია სისხლის ელექტროლიტური შემადგენლობის, კერძოდ კი შრატში კალიუმის კონცენტრაციის რეგულარულად კონტროლი.

ასევე, საჭიროა სისხლში გლუკოზის, შარდმჟავას, კრეატინინისა და ლიპიდების კონცენტრაციის რეგულარულად კონტროლი.

ფარული ან მანიფესტური შაქრიანი დიაბეტის მქონე პაციენტებში სისხლში გლუკოზის კონცენტრაციის შესაძლო მომატების გამო საჭიროა ნახშირწყლების ცვლის მაჩვენებლების კონტროლი.

ასევე, საჭიროა სისხლის საერთო ანალიზის (ერიტროციტები, ლეიკოციტები და თრომბოციტები) რეგულარულად ჩატარება.

მკურნალობის დასაწყისში და ხანდაზმული პაციენტების მკურნალობისას ახორციელებენ ელექტროლიტური დანაკარგებისა და ჰემოკონცენტრაციის კონტროლს.

შეტყობინება შესაძლო არასასურველი რეაქციების შესახებ

სამკურნალო საშუალების რეგისტრაციის შემდეგ შესაძლო არასასურველი რეაქციების შესახებ შეტყობინება ასრულებს მნიშვნელოვან როლს. ეს გვაძლევს შესაძლებლობას, გავაგრძელოთ დაკვირვება „სარგებელი/რისკის“ თანაფარდობაზე ამ სამკურნალო საშუალებასთან დაკავშირებით. ჯანდაცვის მუშაკებს მოეთხოვებათ შეტყობინების გაგზავნა ნებისმიერი შესაძლო არასასურველი რეაქციის შესახებ.

4.9 დოზის გადაჭარბება

ინტოქსიკაციის სიმპტომები

ტორასემიდით ტიპური ინტოქსიკაცია აღწერილი არ არის. დოზის გადაჭარბებისას შესაძლებელია დიურეზის გამოხატული გაძლიერება სითხისა და ელექტროლიტების დაკარგვით, ძილიანობა, ცნობიერების არევის ნიშნები, სიმპტომური არტერიული ჰიპოტენზია, სისხლძარღვოვანი უკმარისობა და დარღვევები საჭმლის მომნელებელი სისტემის მხრივ.

ინტოქსიკაციის მკურნალობა

სპეციფიური ანტიდოტი არ არსებობს. ინტოქსიკაციის სიმპტომების ხარისხის შემცირება ჩვეულებრივ ხდება დოზის შემცირებით ან პრეპარატის მოხსნით და ერთდროულად სითხისა და ელექტროლიტების დანაკარგის აღდგენით (საჭიროა კონტროლი!).

ტორასემიდი არ გამოიყოფა დიალიზის საშუალებით, ამიტომ ჰემოდიალიზი არ იწვევს მის უფრო სწრაფ გამოყოფას.

ჰიპოვოლემიის მკურნალობა: სითხის მოცულობის აღდგენა.

ჰიპოკალიემიის მკურნალობა: კალიუმის დანაკარგის აღდგენა.

მკურნალობა ცირკულატორული კოლაფსის დროს: შოკური მდგომარეობა, საჭიროების შემთხვევაში, შოკის მკურნალობა.

სასწრაფო თერაპია ანაფილაქსიური შოკის დროს:

შოკის პირველი ნიშნების გამოვლენისას (მაგალითად, კანის რეაქციები ჭინჭრის ციების ან ჰიპერემიის სახით, მოუსვენრობა, თავის ტკივილი, პროფუზული ოფლიანობა, გულისრევა, ციანოზი) საჭიროა:

- ვენაში წვდომის უზრუნველყოფა

- გარდა სხვა სტანდარტული ქმედებებისა, პაციენტის ზურგზე დაწვენა ფეხების მაღალ მდგომარეობაში მოთავსებით, სასუნთქი გზების გამტარობის უზრუნველყოფა, ჟანგბადის მიცემა!
- საჭიროების შემთხვევაში, შემდგომში ასევე გამოიყენეთ ინტენსიური თერაპიის საშუალებები (მათ შორის ეპინეფრინის, გლუკოკორტიკოიდების შეყვანა და მოცირკულირე სისხლის მოცულობის აღდგენა).

5 ფარმაკოლოგიური თვისებები

5.1 ფარმაკოდინამიკური თვისებები

ფარმაკოთერაპიული ჯგუფი: ძლიერი მოქმედების მარყუჟოვანი დიურეზული

ათქ კოდი: C03CA04

მოქმედების მექანიზმი

ტორასემიდი წარმოადგენს სალურეზულ საშუალებას და აქვს დიურეზული მოქმედება ჰენლეს მარყუჟის აღმავალ სეგმენტში ნატრიუმის და ქლორის იონების რეაბსორბციის დათრგუნვის ხარჯზე.

ფარმაკოდინამიკური ეფექტები

ადამიანში პრეპარატის ინტრავენური შეყვანის ან შიგნით მიღების შემდეგ დიურეზული მოქმედება ვითარდება საკმაოდ სწრაფად, მაქსიმუმს აღწევს შესაბამისად პირველი საათის და 2-3 საათის განმავლობაში და ნარჩუნდება 12 საათამდე. ჯანმრთელ მოხალისეებში აღნიშნულია დიურეზის გაძლიერება, პრეპარატის დოზის ლოგარიფმის პროპორციულად დოზების დიაპაზონში 50 მგ-დან 100 მგ-მდე (დიურეზის მარყუჟოვანი აქტივობა). დიურეზის გაძლიერება ასევე აღინიშნება სხვა შარდმდენ საშუალებებზე (მაგალითად, თიაზიდურ დიურეზულზე, რომლებიც მოქმედებენ დისტალურ მილაკებში) არასათანადო რეაქციის შემთხვევაში, ასევე თირკმელების ფუნქციის დარღვევისას.

აღწერილი თვისებების გამო, ტორასემიდი ხელს უწყობს შეშუპების შემცირებას. გულის უკმარისობის დროს ტორასემიდი ამცირებს სიმპტომების გამოხატულებას და აუმჯობესებს მიოკარდიუმის ფუნქციას პრე- და პოსტდატვირთვის დაქვეითების ხარჯზე.

ტორასემიდის შიგნით მიღების შემდეგ მისი ჰიპოტენზიური მოქმედება ვითარდება ნელა მკურნალობის დაწყებიდან პირველი კვირის განმავლობაში. მაქსიმალური ჰიპოტენზიური ეფექტი მიიღწევა მკურნალობის დაწყებიდან არაუგვიანეს 12 კვირაში. ტორასემიდი აქვეითებს არტერიულ წნევას პერიფერიული სისხლძარღვების წინააღმდეგობის დაქვეითების შედეგად.

ეს ეფექტი დაფუძნებულია დარღვეული ელექტროლიტური ბალანსის ნორმალიზებაზე, ძირითადად, არტერიების გლუკუნთოვან უჯრედებში თავისუფალი Ca^{2+} იონების აქტივობის შემცირების შედეგად, რომელიც

მომატებულია არტერიული ჰიპერტენზიის მქონე პაციენტებში. შესაძლებელია, ეს ეფექტი იწვევს სისხლძარღვების მომატებული კუმშვადობის ან/და რეაქციის დაქვეითებას ენდოგენურ ვაზოპრესორებზე - როგორცაა, მაგალითად, კატეპოლამინები.

5.2 ფარმაკოკინეტიკური თვისებები

შეწოვა და განაწილება

ტორასემიდი სწრაფად და პრაქტიკულად სრულად შეიწოვება შიგნით მიღების შემდეგ. შრატში პიკური კონცენტრაცია მიიღწევა 1-2 საათში.

პრეპარატის ბიოშელწევადობა შეადგენს დაახლოებით 80-90%-ს. სრული შეწოვის გათვალისწინებით, ღვიძლში პირველად გავლის ეფექტი არ აღემატება 10-20%-ს.

ორი კვლევის მონაცემებით საკვები ამცირებს ტორასემიდის შეწოვის სიჩქარეს (დინამიკურ შემადგენელს) (მცირდება C_{max} და იზრდება t_{max}), მაგრამ არ ახდენს გავლენას საერთო აბსორბციაზე.

ტორასემიდის პლაზმის ცილებთან შეკავშირების ხარისხი აღემატება 99%-ს, ხოლო მისი მეტაბოლიტების M1, M3 და M5 პლაზმის ცილებთან შეკავშირების ხარისხი შესაბამისად შეადგენს 86%-ს, 95%-ს და 97%-ს. განაწილების მოჩვენებითი მოცულობა (V_z) 16 ლ-ის ტოლია.

ბიოტრანსფორმაცია

ადამიანის ორგანიზმში ტორასემიდი მეტაბოლიზდება სამი მეტაბოლიტის წარმოქმნით - M1, M3 და M5. სხვა მეტაბოლიტების არსებობის მტკიცებულებები არ არსებობს. მეტაბოლიტები M1 და M5 წარმოიქმნება ფენოლის რგოლის მეთილის ჯგუფის კარბონის მჟავამდე ეტაპობრივი დაჟანგვის შედეგად. მეტაბოლიტი M3 წარმოიქმნება ფენოლის რგოლის ჰიდროქსილირების შედეგად.

ცხოველებზე ჩატარებულ კვლევებში გამოვლენილი მეტაბოლიტები M2 და M4 ადამიანში გამოვლენილი არ არის.

გამოყოფა

ჯანმრთელ ადამიანში ტორასემიდისა და მისი მეტაბოლიტების ტერმინალური ნახევარგამოყოფის პერიოდი ($t_{1/2}$) შეადგენს 3-4 საათს. ტორასემიდის საერთო კლირენსი 40 მლ/წთ-ის ტოლია, თირკმლისმიერი კლირენსი - დაახლოებით 10 მლ/წთ.

ჯანმრთელ ადამიანში შეყვანილი დოზის დახლოებით 80% გამოიყოფა შარდთან ერთად ტორასემიდისა და მისი მეტაბოლიტების სახით შემდეგი პროცენტული თანაფარდობით: ტორასემიდი დაახლოებით 24%, მეტაბოლიტი M1 დაახლოებით 12%, მეტაბოლიტი M3 დაახლოებით 3%, მეტაბოლიტი M5 დაახლოებით 41%.

ტორასემიდის ძირითად მეტაბოლიტს, M5-ს, არ აქვს დიურეზული აქტივობა. პრეპარატის საერთო ფარმაცოკინეტიკური ეფექტის დაახლოებით 10% დაკავშირებულია აქტიური მეტაბოლიტების M1 და M3-ის მოქმედებასთან.

თირკმელების უკმარისობის დროს ტორასემიდის საერთო კლირენსი და ნახევარგამოყოფის პერიოდი არ იცვლება, ხოლო M3 და M5-ის ნახევარგამოყოფის პერიოდი იზრდება. თუმცა, პრეპარატის ფარმაცოდინამიკური პროფილი რჩება უცვლელი. ტორასემიდის მოქმედების ხანგრძლივობა არ არის დამოკიდებული თირკმელების უკმარისობის სიმძიმეზე. ტორასემიდი და მისი მეტაბოლიტები პრაქტიკულად არ გამოიყოფა ჰემოდიალიზის ან ჰემოფილტრაციის დროს.

ღვიძლის ფუნქციის დარღვევის ან გულის უკმარისობის შემთხვევაში ტორასემიდისა და მეტაბოლიტის M5 ნახევარგამოყოფის პერიოდი მცირედით ხანგრძლივდება. შარდში გამოყოფილი უცვლელი ტორასემიდისა და მისი მეტაბოლიტების თანაფარდობა პრაქტიკულად არ განსხვავდება ჯანმრთელ მოხალისეებში აღნიშნულისგან.

ამასთან დაკავშირებით, ორგანიზმში ტორასემიდისა და მისი მეტაბოლიტების დაგროვება მოსალოდნელი არ არის.

ხაზოვნება

ტორასემიდს და მის მეტაბოლიტებს ახასიათებს დოზაზე დამოკიდებული ხაზოვანი კინეტიკა, ე.ი. პლაზმაში მაქსიმალური კონცენტრაცია და ფარმაცოკინეტიკური მრუდის ქვეშ ფართობი იზრდება პრეპარატის დოზის პროპორციულად.

5.3 უსაფრთხოების წინაკლინიკური მონაცემები

ცხოველებზე ჩატარებული ფარმაცოლოგიური უსაფრთხოების, ქრონიკული ტოქსიკურობის, მუტაგენურობისა და კანცეროგენულობის კვლევებით მიღებული არ არის ცნობები ადამიანში გამოყენებისას პრეპარატის მომატებული რისკის არსებობის შესახებ.

ვირთაგვებში რეპროდუქციის ორგანოების მიმართ ტოქსიკურობის კვლევებში არ არის აღნიშნული პრეპარატის ტერატოგენული მოქმედება. თუმცა, მაკე ბოცვრებსა და ვირთაგვებში, რომლებიც იღებდნენ პრეპარატს მაღალი დოზებით, აღინიშნებოდა ფეტალური ტოქსიკურობისა და დედისთვის ტოქსიკურობის გამოვლინებები. ნაჩვენებია, რომ ვირთაგვებში ტორასემიდი გადის პლაცენტურ ბარიერს. პრეპარატი არ ახდენდა გავლენას ფერტილობაზე.

6 ფარმაცევტული მახასიათებლები

6.1 დამზარე ნივთიერებების ჩამონათვალი

ლაქტოზის მონოჰიდრატი

სიმინდის სახამებელი
კოლოიდური უწყლო სილიციუმის დიოქსიდი
მაგნიუმის სტეარატი

6.2 შეუთავსებლობა

ხელმისაწვდომი არ არის

6.3 ვარგისობის ვადა

3 წელი

6.4 შენახვისას სიფრთხილის განსაკუთრებული ზომები

შენახვის განსაკუთრებულ პირობებს არ საჭიროებს.

6.5 შეფუთვის აღწერა და შიგთავსი

ტაბლეტები შეფუთულია პვე-ფირის და ალუმინის ფოლგის ბლისტერში.

ტრიფასი® 10 გამოდის ორიგინალ შეფუთვაში 10, 30, 50 და 100 ტაბლეტით.

შესაძლოა, ბაზარზე ყველა ზომის შეფუთვა არ იყოს წარმოდგენილი.

6.6 სიფრთხილის სპეციალური ზომები პრეპარატის უტილიზაციისას

ნებისმიერი გამოუყენებელი სამკურნალო საშუალების ან ნარჩენების უტილიზაცია უნდა განხორციელდეს ადგილობრივი კანონმდებლობის მოთხოვნების შესაბამისად.

გაცემის პირობა

ფარმაცევტული პროდუქტის ჯგუფი II, გაიცემა ფორმა №3 რეცეპტით

7 სარეგისტრაციო მოწმობის მფლობელი

მენარინი ინტერნეშნლ ოპერეიშნზ ლუქსემბურგი ს.ა.

დე ლა გარეს გამზირი 1

1611 ლუქსემბურგი

ლუქსემბურგი

8 სარეგისტრაციო მოწმობის ნომერი

9 პირველი რეგისტრაციის/ხელახალი რეგისტრაციის თარიღი

10. ტექსტის რედაქტირების თარიღი

06.2023