

VALMISTEYHTEENVETO

1. LÄÄKEVALMISTEEN NIMI

CAPRILON® 100 mg/ml -injektioneste, liuos

2. VAIKUTTAVAT AINEET JA NIIDEN MÄÄRÄT

Traneksaamihappo, 100 mg/ml

Täydellinen apuaineluettelo, ks. kohta 6.1.

3. LÄÄKEMUOTO

Injektioneste, liuos

Kirkas, väritön liuos

4. KLIINISET TIEDOT

4.1 Käyttöaiheet

Yleisesti tai paikallisesti lisääntyneen fibrinolyysin tai fibrinogenolyysin aiheuttamat vuodot ja niiden ehkäisy. Hereditaarinen angioedeema.

4.2 Annostus ja antotapa

Suosittelunormaaliantostus on 500–1000 mg (5–10 ml) Caprilon-valmistetta hitaasti (1 ml/min) laskimoon.

Annostus erikoiskäyttöaiheiden yhteydessä:

Yleinen fibrinolyysi: 10 ml laskimoon 3–4 kertaa vuorokaudessa.

Prostatektomia: 5–10 ml laskimoon 3 kertaa vuorokaudessa 3 vuorokauden ajan (hoito aloitetaan jo leikkauksen aikana). Sen jälkeen 2–3 Caprilon-tablettia 2–3 kertaa vuorokaudessa makroskooppisen hematurian loppumiseen asti.

Jos potilaalla on munuaisten vajaatoiminta, suositellaan seuraavia annostusvälejä:

Seerumin kreatiniini ($\mu\text{mol/l}$)	Traneksaamihappoannos laskimoon
120–249	10 mg painokiloa kohti x 2/vrk
250–500	10 mg painokiloa kohti/vrk

> 500	5 mg painokiloa kohti/vrk
-------	---------------------------

4.3 Vasta-aiheet

Yliherkkyys traneksaamihapolle. Caprilon-valmistetta ei pidä antaa värinäön häiriöistä kärsiville.

4.4 Varoitukset ja käyttöön liittyvät varotoimet

Varovaisuutta on syytä noudattaa munuaisten vajaatoiminnan yhteydessä kumuloitumisvaaran takia, samoin ylempien virtsateiden massiivisten vuotojen yhteydessä tukkeumariskin takia. Tapauksissa, joissa on erityisen suuri tromboosialttius, on varovaisuus tarpeen.

Kissoilla, koirilla ja rotilla on todettu paikallista retinan degeneraatiota suurten traneksaamihappoannosten jälkeen. Ihmisille tehdyissä kliinisissä kokeissa ei ole todettu retinamuutoksia. Jos potilaalla esiintyy värinäön häiriöitä hoidon aikana, tulee hoito keskeyttää.

4.5 Yhteisvaikutukset muiden lääkevalmisteiden kanssa sekä muut yhteisvaikutukset

Tiedossa ei ole kliinisesti merkittäviä yhteisvaikutuksia.

4.6 Raskaus ja imetys

Valmisteen vaarattomuutta raskauden aikana ei ole kliinisesti osoitettu. Tämän vuoksi sitä tulisi raskauden aikana käyttää vain, mikäli se on ehdottomasti tarpeen. Traneksaamihappoa erittyä vähäisessä määrin äidinmaitoon.

4.7 Vaikutus ajokykyyn ja koneiden käyttökykyyn

Traneksaamihapon farmakologisten ominaisuuksien perusteella ei ole odotettavissa, että lääke vaikuttaa haitallisesti ajokykyyn eikä koneiden käyttökykyyn.

4.8 Haittavaikutukset

Traneksaamihapon haittavaikutukset ovat harvinaisia. Osalla potilaista voi esiintyä pahoinvointia, ripulia tai vatsakipuja, mutta yleensä ne menevät ohi annosta pienentämällä. Hypotensiota on raportoitu erityisesti, jos lääkettä on annettu liian nopeasti suoneen.

Ruuan sulatuselimistö	Yleiset (> 1/100, < 1/10)	Pahoinvointi, oksentelu, ripuli, vatsakipu
Hermosto	Yleiset (> 1/100, < 1/10)	Päänsärky, huimaus

Iho ja ihonalainen kudος	Melko harvinaiset(> 1/1000, < 1/100)	Ihottuma, nokkosihottuma
Aistit	Harvinaiset (> 1/100000, < 1/1000)	Värinäön häiriöt, muut näköhäiriöt

4.9 Yliannostus

Traneksaamihapon yliannostuksesta ei ole kokemuksia. Yliannoksen oireina voi olla pahoinvointia, oksenteluja, ortostatismia ja/tai hypotensiota.

5. FARMAKOLOGISET OMINAISUUDET

5.1 Farmakodynamiikka

Farmakoterapeuttinen ryhmä: Aminohapot, traneksaamihappo

ATC-koodi: B02AA02

Traneksaamihappo on 4-aminometyylisykloheksaanikarboksyylihapon transstereoisomeeri.

Traneksaamihappo on plasminogeenin aktivaation kompetitiivinen inhibiittori. Traneksaamihappo estää plasminogeenin muuttumista plasmiiniksi. Vaikutus on samankaltainen aminokapronihapon vaikutuksen kanssa, mutta traneksaamihappo on tätä 10 kertaa voimakkaampi in vitro. Sitä käytetään fibrinolyysin lisääntymisen aiheuttamaan verenvuotoon tai vuotovaaraan.

5.2 Farmakokinetiikka

Terapeuttisina pitoisuuksina traneksaamihappo sitoutuu heikosti (n. 3 %) plasman proteiineihin. Suun kautta otetusta annoksesta traneksaamihappo imeytyy hyvin, 30–50-prosenttisesti. Samanaikaisesti nautittu ruoka ei vaikuta imeytymiseen.

Suun kautta otetulla 1 gramman annoksella plasman huippupitoisuus saavutetaan noin 3 tunnin kuluttua. Puoliintumisaika iv-annon yhteydessä on 2 tuntia. Toistettujen oraalisten annosten yhteydessä puoliintumisaika pitenee. Traneksaamihappo eliminoituu 95-prosenttisesti erittymällä muuttumattomana virtsaan. Heikentynyt munuaisten toiminta saattaa vaikuttaa traneksaamihapon eliminoitumiseen.

5.3 Prekliiniset tiedot turvallisuudesta

Yhdessä rottakannassa, joka sai päivittäin suun kautta noin 27 kertaa suuremman annoksen traneksaamihappoa (3–5 g/kg/vrk) kuin suurin ihmiselle suositeltu annos, ilmaantui biliaarista hyperplasiaa ja maksan adenokarsinoomaa, kun lääkettä oli annettu 22 kuukauden ajan. Vastaavia kasvaimia ei esiintynyt, kun rotille annettiin 6 kertaa suositeltua suurempia annoksia, eikä toisessa rottakannassa samaa annosta käytettäessä 2 vuoden altistusjakson jälkeen. Muissa kokeissa traneksaamihapolla ei

ole todettu mutageenistä aktiveettia in vitro- eikä in vivo -kokeissa. Sikiömuutoksia ei ole todettu dysmorfologia- eikä lisääntymistutkimuksissa.

6. FARMASEUTTISET TIEDOT

6.1 Apuaineet

Injektionesteisiin käytettävä vesi

6.2 Yhteensopimattomuudet

Caprilon-injektionestettä ei tule sekoittaa verivalmisteisiin eikä penisilliiniä sisältäviin infuusionesteisiin. Koska yhteensopimattomuuskokeita ei ole tehty, lääkevalmistetta ei saa sekoittaa muiden lääkevalmisteiden kanssa.

6.3 Kestoaika

3 vuotta

6.4 Säilytys

Huoneenlämmössä (+15–25 °C:ssa)

6.5 Pakkaustyyppi ja pakkauskoko

5 x 5 ml:n väritön lasinen umpiampulli, turkoosi värirengas ampullin kaulassa

6.6 Erityiset varotoimet hävittämiselle.

Ei erityisvaatimuksia

7. MYYNTILUVAN HALTIJA

Oy Leiras Finland Ab, PL 1406, 00101 Helsinki

8. MYYNTILUVAN NUMERO

8003

9. MYYNTILUVAN MYÖNTÄMISPÄIVÄMÄÄRÄ/UUDISTAMISPÄIVÄMÄÄRÄ

1.10.1980 / 25.10.2007

10. TEKSTIN MUUTTAMISPÄIVÄMÄÄRÄ

23.9.2008