Тиодазин



Код АТХ:

- N05AC02

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Тиоридазин

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой от светло-оранжевого цвета до светло-оранжевого с розовым оттенком цвета, круглые, с делительной риской с одной стороны.

	1 таб.
тиоридазина гидрохлорид	10 мг

Вспомогательные вещества: лактоза, крахмал кукурузный, целлюлоза микрокристаллическая, метилпарагидроксибензоат натрия (метилпарабен натрия), тальк очищенный, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат.

Состав оболочки: гипромеллоза (Е5 премиум), макрогол 6000 (полиэтиленгликоль 6000), титана диоксид; красители - солнечный закат желтый, индигокармин.

10 шт. - стрипы из алюминиевой фольги (10) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой синего цвета, круглые, с делительной риской с одной стороны.

	1 таб.
тиоридазина гидрохлорид	25 мг

Вспомогательные вещества: лактоза, крахмал кукурузный, целлюлоза микрокристаллическая, метилпарагидроксибензоат натрия (метилпарабен натрия), тальк очищенный, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат.

Состав оболочки: гипромеллоза (Е5 премиум), макрогол 6000 (полиэтиленгликоль 6000), титана диоксид, краситель индигокармин.

10 шт. - стрипы из алюминиевой фольги (10) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой желтого цвета, круглые, с делительной риской с одной стороны.

	1 таб.
тиоридазина гидрохлорид	50 мг

Вспомогательные вещества: лактоза, крахмал кукурузный, целлюлоза микрокристаллическая, повидон К30 (поливинилпирролидон К30), тальк очищенный, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат.

Состав оболочки: сополимер бутилметакрилата, диметиламиноэтилметакрилата и метилметакрилата [1:2:1]

(Эудрагит Е100), макрогол 6000 (полиэтиленгликоль 6000), титана диоксид, краситель хинолиновый желтый.

10 шт. - стрипы из алюминиевой фольги (10) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Нейротропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Тиоридазин - активное вещество препарата Тиодазин - относится к группе пиперидиновых производных фенотиазина.

Основные фармакологические свойства тиоридазина аналогичны таковым других фенотиазинов, однако его клинический спектр существенно отличается от спектра других препаратов этого класса. Отличительными чертами тиоридазина являются низкая способность вызывать экстрапирамидные нарушения, его достаточно выраженная седативная и анксиолитическая активность. Обладает умеренным альфа-адреноблокирующим и м-холиноблокирующим действием. Вызывает гипотензивный и противорвотный эффекты. Препарат может удлинять интервал QT.

При применении в низких дозах тиоридазин оказывает анксиолитическое действие. Снимает чувство напряженности и тревоги; эффективен также при слабо выраженных депрессивных расстройствах. При применении тиоридазина отмечается улучшение адаптации больных к окружающей действительности.

При применении в высоких дозах тиоридазин оказывает антипсихотическое действие. Тиоридазин имеет широкий терапевтический диапазон. При применении в рекомендованном диапазоне доз препарат хорошо переносится.

Фармакокинетика

Всасывание

Тиоридазин быстро всасывается из ЖКТ. C_{max} достигаются через 2-4 ч после приема. Биодоступность составляет в среднем около 60%. Отмечена существенная межиндивидуальная вариабельность этого показателя. Связывание с белками высокое (более 95%).

Тиоридазин проникает через плаценту и выделяется в грудное молоко. Тиоридазин и его основные метаболиты (сульфоридазин и мезоридазин) проникают через ГЭБ и обнаруживаются в спинно-мозговой жидкости. Отношение концентрации метаболитов в спинно-мозговой жидкости к их концентрации в плазме выше, чем это же отношение для неизмененного препарата, что свидетельствует о существенной роли метаболитов в реализации антипсихотического действия препарата.

Выведение

Выведение осуществляется, главным образом, с калом (50%), а также через почки (менее 4% в виде неизменного препарата, около 30% - в виде метаболитов). $T_{1/2}$ составляет приблизительно 10 ч.

Показания к применению:

Шизофрения и другие психозы:

— лечение обострений шизофрении;

— лечение шизофрении хронического течения. Тиодазин показан также для длительного лечения больных, находящихся на стационарном лечении, и длительного поддерживающего лечения амбулаторных больных шизофренией.

Синдромы тревоги и депрессии:

— в психиатрической практике - в качестве монотерапии или в составе комбинированной терапии больных ажитированной депрессией;

— в общей медицинской практике - в качестве седативного средства и анксиолитика - лечение разнообразных синдромов, характеризующихся тревогой, сочетанием тревоги и депрессии, напряженностью и ажитацией, психосоматическими нарушениями и эмоциональными расстройствами;

— длительное лечение смешанных тревожно-депрессивных состояний или психотической депрессии.

Показания в гериатрической практике:

— в качестве нейролептического и антипсихотического средства - лечение тяжелых когнитивных расстройств и нарушений поведения у гериатрических пациентов с органическим поражением головного мозга различной степени тяжести;

— в качестве анксиолитика или седативного средства - лечение состояний тревоги, смешанных тревожно-депрессивных состояний, сенильной ажитации и бессонницы;

Показания в педиатрической практике:

— в качестве нейролептика - лечение детской шизофрении, а также тяжелых расстройств поведения на фоне умственной отсталости и органического поражения головного мозга;

— в качестве анксиолитика или седативного средства - лечение состояний тревоги, напряженности, ажитации; лечение нарушений концентрации внимания у детей с выраженными отклонениями в поведении; лечение случаев гиперактивности, резистентных к стимулирующим средствам; лечение расстройств сна.

Прочие показания:

— лечение выраженных нарушений поведения у умственно отсталых взрослых пациентов и пациентов с дефицитарной симптоматикой;

— для уменьшения выраженности таких психических проявлений как тревога, ажитация, враждебность и галлюцинации при синдроме алкогольной абсистенции;

— рвота центрального генеза.

Относится к болезням:

- Бессонница
- Депрессия
- Рвота
- Умственная отсталость
- Шизофрения

Противопоказания:

— повышенная индивидуальная чувствительность к тиоридазина гидрохлориду, тиоридазина основанию или любому другому компоненту препарата;

— коматозные состояния или состояния тяжелого угнетения центральной нервной системы, анамнестические сведения о серьезных гематологических заболеваниях, в частности, угнетение костно-мозгового кроветворения.

— анамнестические сведения о реакциях повышенной индивидуальной чувствительности, таких как тяжелая фотосенсибилизация или повышенная индивидуальная чувствительность к другим фенотиазинам;

— одновременный прием с лекарственными средствами, удлиняющими интервал QT;

— врожденное удлинение интервала QT, аритмии (в том числе в анамнезе);

— одновременный прием ингибиторов или субстратов изофермента CYP2D6;

— тяжелое угнетение сознания (в том числе кома) любой этиологии (в том числе после применения лекарственных средств);

— тяжелая артериальная гипертензия или артериальная гипотензия;

— тяжелые заболевания сердца, особенно клинически значимые аритмии (в частности, желудочковая тахикардия);

— дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция. Беременность, период грудного вскармливания;

— детский возраст до 3-х лет.

С *осторожностью*: алкоголизм (предрасположенность к гепатотоксическим реакциям), патологические изменения крови (нарушение кроветворения), рак молочной железы (в результате индуцированной фенотиазином секреции пролактина возрастают потенциальный риск прогрессирования болезни и резистентность к лечению эндокринными и цитостатическими лекарственными средствами), закрытоугольная глаукома, гиперплазия предстательной железы с клиническими проявлениями, печеночная и/или почечная недостаточность, язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки (в период обострения); заболевания, сопровождающиеся повышенным риском

тромбоэмболических осложнений; болезнь Паркинсона (усиливаются экстрапирамидные эффекты); эпилепсия; микседема; хронические заболевания, сопровождающиеся нарушением дыхания (особенно у детей); синдром Рейе (повышение риска развития гепатотоксичности у детей и подростков); кахексия, рвота (противорвотное действие фенотиазинов может маскировать рвоту, связанную с передозировкой другими лекарственными средствами), пожилой возраст.

Способ применения и дозы:

Дозу и время приема препарата следует подбирать индивидуально в зависимости от заболевания и тяжести симптоматики. Начинать лечение рекомендуется с доз, находящихся на нижней границе указанного диапазона. Затем в процессе лечения дозу постепенно увеличивают до достижения максимально эффективной. При достижении максимального терапевтического эффекта дозу постепенно снижают до поддерживающей. Суточную дозу делят обычно на 2-4 приема.

Шизофрения и другие психозы:

Обострения шизофрении у взрослых госпитализированных больных: 100-600 мг/сут - до максимальной дозы 800 мг/сут.

Шизофрения хронического течения: 100-600 мг/сут - у госпитализированных больных; 50-300 мг/сут - у амбулаторных больных.

Синдромы тревоги и депрессии:

В психиатрической практике больным с ажитированной депрессией: 25-200 мг/сут.

В общей медицинской практике в качестве седативного средства и анксиолитика: 10-75 мг/сут.

В гериатрической практике:

В качестве нейролептического/антипсихотического средства: 25-200 мг/сут.

В качестве анксиолитика/седативного средства: 10-75 мг/сут.

В педиатрической практике:

В качестве нейролептика для лечения тяжелых умственных и эмоциональных расстройств у детей в возрасте старше 3-х лет: 1 -4 мг/кг/сут.

В качестве анксиолитика/седативного средства у детей в возрасте старше 3-х лет: 0.5 - 2 мг/кг/сут.

Прочие показания:

Лечение выраженных нарушений поведения у умственно отсталых взрослых пациентов и пациентов с дефицитарной симптоматикой: 100-600 мг/сут; максимальная доза - 800 мг/сут.

Для уменьшения выраженности психических нарушений при синдроме алкогольной абстиненции: 100-200 мг/сут.

Лечение больных с дефицитом массы тела, нарушениями функции почек и/или печени, а также больных пожилого возраста и детей рекомендуется проводить под тщательным контролем и начинать с особенно малых доз и увеличивать их очень медленно.

У больных шизофренией, находящихся на стационарном лечении, четкий положительный эффект достигается обычно через 2-3 недели или более от начала лечения. У больных с хроническими психозами для достижения максимально выраженного эффекта может потребоваться от 6 недель до 6 месяцев. Напротив, у больных с острыми психозами улучшение состояния может быть отмечено через 24-48 ч.

В случае отмены длительной терапии Тиодазином его дозу рекомендуется снижать постепенно, в течение нескольких недель, поскольку внезапная отмена у больных, получавших препарат длительно или в высоких дозах, может привести в некоторых случаях к таким явлениям как тошнота, рвота, тремор, головокружение, беспокойство, возбуждение, бессонница, преходящие дискинезии. Эти явления могут создавать ошибочное впечатление возникновения у пациента депрессивного или психотического состояния.

Побочное действие:

Побочные эффекты Тиодазина, как и прочих фенотиазинов, зависят от дозы и, как правило, обусловлены выраженными фармакологическими эффектами препарата. При применении препарата в рекомендованном интервале доз нежелательные явления в большинстве случаев слабо выражены и носят преходящий характер. Тяжелые явления отмечаются при использовании высоких доз Тиодазина.

Со стороны ЦНС: часто - седативное действие, сонливость; головокружение; нечасто - нарушение сознания, психомоторное возбуждение, галлюцинации, повышенная раздражительность, головная боль; редко - судороги, экстрапирамидные симптомы (тремор, мышечная ригидность, акатизия, дискинезия, дистония), поздняя дискинезия; очень редко - депрессия, бессонница, злокачественный нейролептический синдром.

Со стороны вегетативной нервной системы / м-холиноблокирующие эффекты: часто - сухость во рту, нечеткость зрения, парез аккомодации, заложенность носа; нечасто - тошнота, рвота, диарея, запор, потеря аппетита, задержка или недержание мочи; редко - бледность, тремор; очень редко - паралитическая кишечная непроходимость.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - ортостатическая гипотензия; нечасто - изменения ЭКГ (удлинение интервала QT), тахикардия; редко - аритмии; очень редко - трепетание-мерцание желудочков, внезапная смерть.

Со стороны эндокринной системы: часто, при длительном приеме - гиперпролактинемия, галакторея; нечасто - аменорея, нарушения менструального цикла, изменение массы тела, нарушение эрекции и эякуляции; редко - приапизм; очень редко - нагрубание молочных желез, гинекомастия, периферические отеки.

Со стороны периферической крови: редко - лейкопения, агранулоцитоз, тромбоцитопения; очень редко - анемия, лейкоцитоз.

Со стороны печени: нечасто - отклонения от нормы активности печеночных ферментов; редко - гепатит.

Со стороны кожных покровов: редко - дерматит, кожная сыпь (в т.ч. аллергическая),крапивница, повышенная фоточувствительность, ангионевротический отек.

Прочие: редко - отек в области околоушной железы, гипертермия, угнетение дыхания.

Передозировка:

При длительной терапии Тиодазином имеются сообщения о редких случаях пигментной ретинопатии, развившейся у пациентов, получавших препарат в дозе, превышающей рекомендованную максимальную дозу 800 мг/сут.

Усиление побочных эффектов, появление острых нейролептических реакций. Особо должно настораживать повышение температуры тела, которое может быть одним из симптомов злокачественного нейролептического синдрома. В тяжелых случаях передозировки могут наблюдаться различные формы нарушения сознания, вплоть до комы.

Меры помощи: прекращение терапии Тиодазином и любыми другими антипсихотическими препаратами (нейролептиками), назначение корректоров (центральных холиноблокаторов), назначение высоких доз активированного угля, промывание желудка, при судорогах внутривенное введение диазепама, раствора глюкозы, ноотропных препаратов, витаминов группы В и С, тщательное мониторирование функций сердечно-сосудистой, дыхательной и центральной нервной системы, симптоматическая терапия.

При судорогах следует избегать применения барбитуратов, поскольку они могут усиливать угнетение дыхания, вызванное фенотиазиновым производным.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан во время беременности и в период грудного вскармливания.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Метаболизм, опосредуемый изоферментом CYP2D6: тиоридазин метаболизируется изоферментом CYP2D6, кроме того, сам является ингибитором этого изофермента. В связи с этим препараты, ингибирующие данный изофермент (например, циметидин, флуоксетин, пароксетин, моклобемид), могут усиливать и удлинять эффекты Тиодазина.

Трициклические антидепрессанты: одновременное применение трициклических антидепрессантов и производных фенотиазина может приводить к повышению концентрации в плазме этих лекарственных средств и/или производного фенотиазина, что может привести к возникновению аритмий.

Противосудорожные средства: тиоридазин, как и другие фенотиазины, может снижать порог судорожной готовности. При одновременном применении с тиоридазином возможно повышение или снижение концентрации в сыворотке фенитоина, в связи с чем может потребоваться коррекция его дозы. При совместном применении тиоридазина и карбамазепина концентрации этих препаратов в сыворотке не изменяются.

Антигипертензивные средства и бета-адреноблокаторы: вследствие подавления метаболизма совместное применение данных средств тиоридазином может привести к повышению концентраций в плазме каждого из

препаратов, что, вероятно, может привести к выраженному снижению АД, нарушениям ритма сердца или побочным эффектам со стороны центральной нервной системы.

Непрямые антикоагулянты: совместное применение с тиоридазином может вызвать усиление гипопротромбинемического действия, что связано, главным образом, с конкурентным взаимодействием на уровне изоферментов цитохрома Р450. В этом случае необходим тщательный контроль концентрации протромбина в плазме.

Средства с угнетающим воздействием на центральную нервную систему: тиоридазин может усиливать эффекты алкоголя и других средств, обладающих угнетающим воздействием на центральную нервную систему, бензодиазепинов, наркотических анальгетиков, барбитуратов, антидепрессантов и средств для наркоза.

Ингибиторы моноаминоксидазы (МАО): одновременное применение ингибиторов МАО и тиоридазина может удлинять и усиливать седативное и м-холиноблокирующее действие каждого из препаратов.

Препараты лития: возможно возникновение тяжелых нейротоксических осложнений, экстрапирамидных нарушений и сомнамбулизма у пациентов, получавших одновременно препарат лития и производное фенотиазина, включая тиоридазин.

Средства с м-холиноблокирующим действием: при одновременном применении с тиоридазином возможно усиление м-холиноблокирующих эффектов м-холиноблокаторов (атропиноподобных средств), антигистаминных препаратов и трициклических антидепрессантов, вплоть до таких проявлений как «атропиновый психоз», выраженный запор, паралитическая кишечная непроходимость, гиперпирексия с возможным тепловым ударом. В этих случаях показано тщательное наблюдение за пациентом и коррекция доз препаратов.

Противопаркинсонические средства: при одновременном применении тиоридазина и леводопы возможно ослабление эффектов каждого из препаратов.

Сосудосуживающие средства: благодаря своим α-адреноблокирующим свойствам, тиоридазин может ослаблять прессорный эффект сосудосуживающих средств (эпинефрина, допамина, эфедрина, фенилэфрина).

Хинидин: при одновременном применении хинидина и тиоридазина возможно усиление угнетающего воздействия хинидина на миокард.

Антиаритмические средства/удлинение интервала QT: учитывая, что фенотиазины, в том числе тиоридазин, могут вызывать такие изменения ЭКГ как удлинение интервала QT, следует соблюдать осторожность при их одновременном применении с препаратами, обладающими аналогичным свойством.

Тиазидные диуретики: одновременное применение тиоридазина и тиазидного диуретика может привести к выраженной артериальной гипотензии. Кроме того, вызванная диуретиком гипокалиемия может усиливать кардиотоксические эффекты тиоридазина. Гипогликемические средства: тиоридазин влияет на углеводный обмен, в связи с чем при его применении может нарушаться толерантность пациента к глюкозе, достигнутая на фоне лечения гипогликемическими средствами.

Антацидные и противодиарейные средства могут уменьшать всасывание из ЖКТ тиоридазина.

Особые указания и меры предосторожности:

С особой осторожностью применяют у пациентов с глаукомой (особенно закрытоугольная форма), с сердечно-сосудистыми заболеваниями, тяжелыми заболеваниями органов дыхания, почечной недостаточностью, болезнью Паркинсона, эпилепсией, гипертрофией предстательной железы, миастенией, феохромоцитомой.

В период лечения Тиодазином запрещается прием алкоголя, а также вождение транспортных средств, работы с механизмами и других видов деятельности, требующих быстроты реакции.

При нарушениях функции почек

С особой осторожностью применяют у пациентов с почечной недостаточностью.

При нарушениях функции печени

Применяют с осторожностью у пациентов с печеночной недостаточностью.

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью принимать данный препарат лицам пожилого возраста.

Применение в детском возрасте

Запрещено использование данного препарата для детей до 3-х лет.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25°C. Хранить в недоступном для детей месте. Не использовать после истечения срока годности.

Срок годности:

4 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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