Тизерцин



Код АТХ:

- N05AA02

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Левомепромазин

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 оболочкой белого цвета, круглые, слегка двояковыпуклые, без запаха.

	1 таб.
левомепромазина гидромалеат	33.8 мг,
что соответствует содержанию левомепромазина	25 мг

Вспомогательные вещества: магния стеарат - 1 мг, натрия крахмала гликолат - 2 мг, повидон - 8 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 10 мг, крахмал картофельный - 15.2 мг, лактоза - 40 мг.

Состав оболочки: титана диоксид - 0.758 мг, гипромеллоза - 2.632 мг, диметикон - 0.355 мг, магния стеарат - 0.255 мг.

50 шт. - флаконы коричневого стекла с ПЭ крышкой, с контролем первого вскрытия и амортизатором-гармошкой (1) - пачки картонные.

Раствор для инфузий и в/м введения бесцветный или слегка окрашенный, прозрачный, с характерным запахом.

	1 мл
левомепромазин	25 мг

Вспомогательные вещества: лимонная кислота безводная - 9 мг, монотиоглицерол - 7.5 мг, натрия хлорид - 6 мг, вода д/и - до 1 мл.

1 мл - ампулы из бесцветного стекла типа I (5), с красным и синим кодовыми кольцами и с точкой излома - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Нейротропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антипсихотический препарат (нейролептик) фенотиазинового ряда. Оказывает антипсихотическое, седативное (снотворное), анальгезирующее, умеренное противорвотное, гипотермическое, умеренное антигистаминное и м-холиноблокирующее действие. Вызывает снижение АД.

Антипсихотическое действие обусловлено блокадой допаминовых D_2-рецепторов мезолимбической и мезокортикальной системы.

Седативное действие обусловлено блокадой адренорецепторов ретикулярной формации ствола головного мозга; противорвотное действие - блокадой допаминовых D_2-рецепторов триггерной зоны рвотного центра; гипотермическое действие - блокадой допаминовых рецепторов гипоталамуса.

Экстрапирамидные побочные эффекты у левомепромазина менее выражены, чем у "классических" нейролептиков. Левомепромазин повышает болевой порог. Благодаря способности усиливать эффекты анальгетиков, средств для общей анестезии и антигистаминных препаратов этот препарат можно использовать для вспомогательной терапии при остром и хроническом болевом синдроме.

Максимальный анальгетический эффект развивается в течение 20-40 мин после в/м введения и длится примерно 4 ч.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь C_{max} в плазме крови достигается через 1-3 ч.

После в/м введения C_{max} в плазме крови достигается через 30-90 мин.

Распределение

Проникает через гистогематические барьеры, включая ГЭБ, распределяется в органах и тканях.

Метаболизм

Левомепромазин быстро метаболизируется в печени путем деметилирования с образованием сульфатных и глюкуронидных конъюгатов, которые выводятся с мочой. Метаболит, образующийся в результате деметилирования (N-дезметиломоно-метотримепразин), обладает фармакологической активностью, остальные метаболиты неактивны.

Выведение

$T_{1/2}$ составляет 15-30 ч.

Небольшая часть введенной дозы (1%) выводится в неизменном виде с мочой и калом.

Показания к применению:

— психомоторное возбуждение различной этиологии: при шизофрении (острой и хронической), при биполярных расстройствах, при психозах (включая сенильные и интоксикационные), при олигофрении, при эпилепсии;

— другие психические расстройства, протекающие с ажитацией, тревогой, паникой, фобиями, стойкой бессонницей;

— усиление действия анальгетиков, средств для общей анестезии, блокаторов гистаминовых H_1-рецепторов;

— болевой синдром (невралгия тройничного нерва, неврит лицевого нерва, опоясывающий лишай).

Относится к болезням:

- Анестезия
- Бессонница
- Биполярное расстройство

- Болевой синдром
- Интоксикация
- Лишай
- Невралгия
- Невралгия тройничного нерва
- Неврит
- Неврит лицевого нерва
- Олигофрения
- Опоясывающий лишай
- Фобия
- Шизофрения
- Эпилепсия

Противопоказания:

— одновременный прием антигипертензивных средств;

— передозировка средств, оказывающих угнетающее действие на ЦНС (алкоголь, общие анестетики, снотворные);

— закрытоугольная глаукома;

— задержка мочи;

— болезнь Паркинсона;

— рассеянный склероз;

— миастения;

— гемиплегия;

— хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации;

— выраженная почечная недостаточность;

— выраженная печеночная недостаточность;

— выраженная артериальная гипотензия;

— угнетение костномозгового кроветворения (гранулоцитопения);

— порфирия;

— лактация;

— детский возраст до 12 лет;

— повышенная чувствительность к левомепромазину и другим фенотиазинам.

С *осторожностью* применяют при эпилепсии, у пациентов с сердечно-сосудистыми заболеваниями в анамнезе, особенно в пожилом возрасте (нарушения проводимости сердечной мышцы, аритмии, синдром врожденного удлинения интервала QT).

Способ применения и дозы:

Внутрь назначают, начиная с дозы 25-50 мг/сут в несколько приемов (максимальную часть суточной дозы следует назначать перед сном), ежедневно увеличивая ее на 25-50 мг до улучшения состояния больного. У резистентных к другим нейролептикам больных суточную дозу можно увеличивать быстрее, повышая ее на 50-75 мг/сут. Средние суточные дозы составляют 200-300 мг.

После улучшения состояния пациента дозу следует снизить до поддерживающей, величина которой определяется индивидуально.

В *амбулаторной практике больным с невротическими расстройствами* препарат назначают в суточной дозе 12.5-50 мг (1/2-2 таб.).

Парентерально препарат вводят при отсутствии возможности его приема внутрь. Суточная доза составляет 75-100 мг, разделенная на 2-3 инъекции, в условиях постельного режима под контролем АД и пульса. При необходимости суточную дозу увеличивают до 200-250 мг.

Вводят в/м (глубоко) или в/в капельно.

Для введения в виде в/в капельной инфузии Тизерцин (50-100 мг) следует разбавить в 250 мл 0.9% раствора натрия хлорида или 5% раствора декстрозы (глюкозы) и вводить медленно через капельницу.

Клинического опыта по парентеральному применению препарата у **детей в возрасте до 12 лет** недостаточно. При наличии строгих показаний детям старше 12 лет рекомендованы дозы 0.35-3 мг/кг массы тела/сут.

Побочное действие:

Со стороны сердечно-сосудистой системы: снижение АД, ортостатическая гипотензия (с сопутствующими слабостью, головокружением и потерей сознания), синдром Адамса-Стокса, тахикардия, удлинение интервала QT (аритмогенный эффект, аритмия типа "пируэт"). При приеме нейролептиков фенотиазинового ряда отмечены случаи внезапной смерти (возможно вызванные кардиологическими причинами).

Со стороны системы кроветворения: панцитопения, агранулоцитоз, лейкопения, эозинофилия, тромбоцитопения.

Со стороны ЦНС: сонливость, головокружение, повышенная утомляемость, спутанность сознания, невнятность речи, зрительные галлюцинации, кататония, нарушение ориентации, экстрапирамидные симптомы с преобладанием акинето-гипотонического синдрома (дискинезия, дистония, паркинсонизм, опистотонус, гиперрефлексия), эпилептические припадки, повышение внутричерепного давления, ЗНС.

Со стороны обмена веществ: снижение массы тела, галакторея, нарушения менструального цикла, масталгия. Сообщалось о возникновении аденомы гипофиза у некоторых пациентов, получающих производные фенотиазина, однако для установления причинно-следственной связи между применением этих препаратов и развитием опухоли необходимы дополнительные исследования.

Со стороны репродуктивной и мочевыделительной системы: затрудненное мочеиспускание, обесцвечивание мочи, нарушение сокращений маточной мускулатуры.

Со стороны пищеварительной системы: сухость во рту, неприятные ощущения в животе, тошнота, рвота, запор, поражение печени (желтуха, холестаз).

Со стороны кожных покровов: фотосенсибилизация, эритема, гиперпигментация.

Со стороны органа зрения: отложения в хрусталике и роговице, пигментная ретинопатия.

Аллергические реакции: отек гортани, периферические отеки, анафилактоидные реакции, бронхоспазм, крапивница, эксфолиативный дерматит.

Прочие: гипертермия (может быть первым признаком ЗНС), боль и отек в местах инъекций.

Передозировка:

Симптомы: снижение АД, гипертермия, нарушения проводимости в сердечной мышце (удлинение интервала QT, желудочковая тахикардия типа "пируэт", AV-блокада), угнетение сознания различной степени выраженности (вплоть до комы), экстрапирамидные симптомы, седативный эффект, эпилептические припадки, ЗНС.

Лечение: рекомендуется контролировать кислотно-щелочной баланс, баланс жидкости и электролитов, функцию почек, объем мочи, активность печеночных ферментов, показания ЭКГ, а у пациентов с ЗНС - дополнительно уровень сывороточной КФК и температуру тела. Симптоматическое лечение должно проводиться на основании результатов оценки вышеперечисленных параметров. В случае снижения АД показано в/в введение жидкости, положение Тренделенбурга, применение допамина и/или норадреналина. Ввиду проаритмогенного эффекта левомепромазина необходимо обеспечить условия для реанимации, а при введении допамина и/или норадреналина - проведение ЭКГ. При передозировке нейролептиков не рекомендуется использовать адреналин. Следует также избегать применения лидокаина и, по возможности, аритмических препаратов длительного действия. Для устранения судорог используют диазепам или, при рецидивах судорожных приступов, фенитоин. При возникновении рабдомиолиза назначают маннитол. Специфический антидот отсутствует. Принудительное мочеиспускание, гемодиализ и гемоперфузия неэффективны.

Не рекомендуется вызывать рвоту, поскольку перемежающиеся эпилептические судороги, дистонические реакции мышц головы и шеи могут привести к попаданию рвотных масс в дыхательные пути. Промывание желудка, наряду с контролем жизненно важных показателей, показано даже спустя 12 ч после приема препарата, поскольку его естественное выведение замедленно вследствие м-холиноблокирующего действия левомепромазина. Дополнительное уменьшение всасывания препарата достигается применением активированного угля и слабительных.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат не следует применять при беременности, за исключением случаев, когда ожидаемая польза терапии для матери превышает потенциальный риск для плода.

Адекватных и строго контролируемых клинических исследований по безопасности применения Тизерцина в период лактации не проводилось. Левомепромазин выделяется с грудным молоком. Учитывая эти факты, применение препарата при грудном вскармливании противопоказано. При необходимости применения препарата в период лактации следует решить вопрос о прекращении грудного вскармливания.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Следует избегать одновременного применения левомепромазина и следующих средств

— гипотензивных препаратов из-за риска выраженного снижения АД;

— ингибиторов МАО, т.к. возможно увеличение продолжительности действия левомепромазина и усиления тяжести его побочных эффектов.

Следует соблюдать осторожность при одновременном применении со следующими средствами

Средства с м-холиноблокирующей активностью (трициклические антидепрессанты; блокаторы гистаминовых H_1-рецепторов; некоторые антипаркинсонические средства; атропин, скополамин, суксаметоний) усиливают м-холиноблокирующее действие левмепромазина (паралитическая кишечная непроходимость, задержка мочи, глаукома). При одновременном применении со скополамином наблюдались экстрапирамидные побочные эффекты.

Средства, угнетающие ЦНС (опиоидные анальгетики, средства для общей анестезии, анксиолитики, седативные и снотворные средства, транквилизаторы, трициклические антидепрессанты), усиливают угнетающее действие левомепромазина на ЦНС.

Средства, стимулирующие ЦНС (например, производные амфетамина): левомепромазин снижает их психостимулирующий эффект.

Леводопа: левомепромазин ослабляет эффект леводопы.

Пероральные гипогликемические средства: при одновременном применении с левомепромазином снижается их эффективность, что требует коррекции дозы.

Средства, удлиняющие интервал QT (некоторые противоаритмические препараты, антибиотики из группы макролидов, некоторые противогрибковые производные азола, цизаприд, некоторые антидепрессанты, некоторые антигистаминные препараты, а также диуретики, снижающие концентрацию калия в крови), усиливают риск удлинения интервала QT и, следовательно, повышают риск аритмии.

Препараты, вызывающие фотосенсибилизацию, при одновременном применении с левомепромазином, увеличивают вероятность возникновения фотосенсибилизации.

Этанол усиливает торможение ЦНС и повышает вероятность возникновения экстрапирамидных побочных эффектов при одновременном применении с левомепромазином.

Антацидные средства снижают всасываемость в желудочно-кишечном тракте (левомепромазин следует назначать за 1 ч до или через 4 ч после приема антацидных средств).

Лекарственные препараты, угнетающие костномозговое кроветворение, увеличивают риск миелосупрессии.

Дилевалол, подобно левомепромазину, ингибирует обмен веществ, что приводит к взаимному усилению действия обоих лекарственных средств. В случае их одновременного применения может потребоваться уменьшение дозировок одного или обоих препаратов. Не исключено аналогичное взаимодействие с другими бета-адреноблокаторами.

Левомепромазин и его негидроксилированные метаболиты являются мощными ингибиторами CYP2D6. Совместное применение левомепромазина с лекарственными препаратами, метаболизирующимися главным образом при помощи CYP2D6, может привести к повышению концентрации этих препаратов, что может увеличить нежелательные эффекты этих препаратов.

Особые указания и меры предосторожности:

Применение препарата следует прекратить в случае возникновения аллергических реакций.

Одновременное применение со средствами, угнетающими ЦНС, ингибиторами МАО и м-холиноблокаторами требует особой осторожности.

Следует с особой осторожностью назначать препарат пациентам с нарушениями функции печени и/или почек.

Пожилые пациенты имеют предрасположенность к ортостатической гипотензии, а также м-холиноблокирующему и седативному действию фенотиазинов. Кроме того, у них особенно часто возникают экстрапирамидные побочные эффекты. Поэтому лечение этих пациентов следует начинать с низких доз с постепенным их повышением.

У пожилых людей с деменцией, которых лечили антипсихотиками, наблюдалось небольшое повышение риска смертности. Данных недостаточно для определения точной величины риска, как неизвестна и причина этого повышенного риска. Не следует применять Тизерцин для лечения нарушений поведения, связанных с деменцией. Во избежание развития ортостатической гипотензии пациент должен лежать в течение получаса после введения первой дозы. Если после введения препарата возникает головокружение, следует соблюдать постельный режим после введения каждой дозы до исчезновения головокружения.

В случаях парентерального введения препарата Тизерцин следует, при необходимости, чередовать места инъекций, поскольку препарат может вызывать местное раздражение и поражение ткани.

Необходимо также соблюдать осторожность при назначении препарата пациентам (особенно пожилым), имеющим в анамнезе сердечно-сосудистые заболевания, больным с застойной сердечной недостаточностью, нарушениями проводимости, аритмией, синдромом врожденного удлиненного интервала QT. До начала лечения препаратом Тизерцин необходимо провести ЭКГ чтобы исключить любое сердечно-сосудистое расстройство, которое может служить противопоказанием к применению препарата.

Имеются сообщения об удлинении интервала QT, возникновении аритмии и, очень редко, аритмии типа "пируэт" при терапии фенотиазинами.

При возникновении гипертермии во время терапии антипсихотиками следует исключить возможность ЗНС. Этот синдром, представляющий потенциальную угрозу жизни, характеризуется следующими симптомами: мышечная ригидность, гипертермия, спутанность сознания, нарушение функции вегетативной нервной системы (нестабильное АД, тахикардия, аритмия, повышенное потоотделение), кататония, повышение активности КФК, миоглобинурия (рабдомиолиз) и острая почечная недостаточность. При их возникновении, а также если во время лечения возникнет гипертермия неясной этиологии без остальных клинических симптомов ЗНС, применение препарата Тизерцин следует немедленно прекратить.

После внезапной отмены препарата, применяемого в высоких дозах или длительно, возможно появление: тошноты, рвоты, головной боли, тремора, повышенного потоотделения, тахикардии, бессонницы и беспокойства, а также развития толерантности к седативному действию производных фенотиазина и перекрестная толерантность к различным антипсихотическим средствам. По этой причине отмену препарата следует всегда производить постепенно.

Многие антипсихотические средства, в т.ч. левомепромазин, могут снижать порог судорожной готовности и вызывать эпилептиформные изменения ЭЭГ. По этой причине при титровании дозы препарата Тизерцин всем больным эпилепсией необходимо обеспечить тщательное клиническое наблюдение и контроль ЭЭГ.

Развитие холестатической желтухи зависит от индивидуальной чувствительности пациента и полностью исчезает после прекращения применения препарата. Поэтому при длительном лечении требуется регулярный контроль функции печени.

У некоторых пациентов, получающих фенотиазины, отмечались агранулоцитоз и лейкопения. Несмотря на редкость таких случаев, при долгосрочной терапии левомепромазином необходимо регулярно проводить контроль лейкоцитарной формулы крови. Во время лечения и до прекращения действия препарата (в течение 4-5 дней после отмены препарата) запрещается потребление алкоголя.

До начала и во время лечения рекомендуется регулярно контролировать следующие показатели: артериальное давление, функцию печени (особенно у пациентов с заболеваниями печени), лейкоцитарную формулу крови, ЭКГ (при сердечно-сосудистых заболеваниях и у пожилых пациентов), концентрацию калия в сыворотке крови. Необходим периодический контроль уровня электролитов в крови и его коррекция (особенно при планировании долгосрочной терапии).

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В начале лечения (в течение периода, длительность которого зависит от реакции пациента) запрещается управление автомобилем и выполнение работ, связанных с повышенным риском несчастных случаев. В последующем строгость запрета определяется индивидуально для каждого пациента.

При нарушениях функции почек

С особой осторожностью следует назначать препарат пациентам с почечной недостаточностью из-за риска кумуляции препарата.

Препарат противопоказан при тяжелой почечной недостаточности.

При нарушениях функции печени

С особой осторожностью следует назначать препарат пациентам с печеночной недостаточностью из-за риска кумуляции препарата.

Препарат противопоказан при тяжелой печеночной недостаточности.

Применение в пожилом возрасте

С *осторожностью* применяют у пациентов с сердечно-сосудистыми заболеваниями в анамнезе, особенно в пожилом возрасте (нарушения проводимости сердечной мышцы,

Применение в детском возрасте

Противопоказание: детский возраст до 12 лет.

Условия хранения:

Препарат относится к списку №1 сильнодействующих веществ Постоянного комитета по контролю наркотиков МЗ РФ.

Препарат в форме таблеток, покрытых оболочкой, следует хранить в недоступном для детей месте при температуре от 15° до 25°С.

Препарат в форме раствора для инфузий и инъекций следует хранить в недоступном для детей, защищенном от света месте при температуре не выше 25°С. Срок годности - 2 года.

Срок годности:

5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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