ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению препарата

ТРИФТАЗИН

Регистрационный номер:

Торговое название: ТРИФТАЗИН

Международное непатентованное или группировочное название: Трифлуоперазин.

Лекарственная форма: таблетки, покрытые оболочкой.

Состав: в 1 таблетке, покрытой оболочкой, содержится:

активное вещество: трифлуоперазина гидрохлорида в пересчете на трифлуоперазин–5 мг;

вспомогательные вещества: сахароза, крахмал картофельный, кремния диоксид коллоидный (аэросил), магния стеарат, кальция карбонат (осажденный), желатин, индигокармин, воск пчелиный, парафин жидкий (масло вазелиновое), тальк, глицерол (глицерин).

Описание

Круглые таблетки двояковыпуклой формы, покрытые оболочкой, синего или синего с зеленым оттенком цвета. На поверхности таблеток допускается мраморность. На поперечном разрезе видны два слоя.

Фармакотерапевтическая группа: антипсихотическое средство (нейролептик).

Код АТХ N05AB06.

Фармакодинамика

Антипсихотическое средство (нейролептик), пиперазиновое производное фенотиазина. Обладает также седативным, противорвотным, противоикотным, каталептическим, гипотензивным, гипотермическим и слабым м-холиноблокирующим действием.

Антипсихотическое действие обусловлено блокадой D_2-дофаминовых рецепторов мезолимбической и мезокортикальной системы. Оказывает блокирующее действие на альфа-адренорецепторы и подавляет высвобождение гормонов гипоталамуса и гипофиза, при этом блокада дофаминовых рецепторов приводит к увеличению выделения гипофизом пролактина.

Седативное действие обусловлено блокадой адренорецепторов ретикулярной формации ствола головного мозга. Противорвотное действие – блокадой периферических и центральных (хеморецепторной триггерной зоны рвотного центра мозжечка) D_2-дофаминовых рецепторов, а также блокадой окончаний блуждающего нерва в желудочно-

кишечном тракте. Гипотермическое действие – блокадой дофаминовых рецепторов гипоталамуса.

Трифлуоперазин структурно схож с хлорпромазином, имеет более высокую активность, лучше переносится, при его применении дольше не развивается толерантность к антипсихотическому действию. Седативное действие и влияние на вегетативную нервную систему выражено слабее, чем у других фенотиазинов, экстрапирамидное и противорвотное – сильнее.

Фармакокинетика

Степень абсорбции трифлуоперазина высокая, биодоступность составляет 35 % (обладает эффектом «первого прохождения» через печень). Связь с белками плазмы достигает 95 - 99 %. Максимальная концентрация в крови достигается через 2–4 ч после приема внутрь. Проходит через гематоэнцефалический барьер, через плаценту и в грудное молоко. Интенсивно метаболизируется в печени с образованием фармакологически неактивных метаболитов. Период полувыведения 15-30 ч. Экскретируется преимущественно почками (в виде метаболитов) и с желчью.

При проведении диализа – слабо диализируется из-за высокой степени связывания с белками.

Показания к применению

Психозы, шизофрения, галлюцинаторное и аффективно-бредовое состояние, психомоторное возбуждение различной этиологии. Рвота центрального генеза.

Противопоказания

Повышенная индивидуальная чувствительность к компонентам препарата; тяжелые сердечно-сосудистые заболевания (декомпенсированная сердечная недостаточность, тяжелая артериальная гипотензия); выраженные угнетения функции центральной нервной системы и коматозные состояния любой этиологии; травмы мозга, прогрессирующие заболевания головного и спинного мозга. Беременность, период лактации, детский возраст.

С осторожностью

Алкоголизм (повышенная предрасположенность к гепатотоксическим реакциям), стенокардия, клапанные поражения сердца, лимитирующие величину минутного обращения крови (возможно развитие тяжелой артериальной гипертензии); патологические изменения крови (нарушение кроветворения), рак молочной железы (в результате индуцированной фенотиазином секреции пролактина возрастает потенциальный риск прогрессирования болезни и резистентности к лечению

эндокринными и цитостатическими препаратами), 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 (повышен риск гепатотоксичности у детей и подростков); кахексия, рвота (противорвотное действие фенотиазинов может маскировать рвоту, связанную с передозировкой других препаратов); пожилой возраст; воздействие высоких температур.

Беременность и лактация

Препарат противопоказан в период беременности и в период лактации. При необходимости применения в период лактации грудное кормление следует прекратить.

Способ применения и дозы

Принимают внутрь после еды. Дозы подбираются индивидуально в соответствии с тяжестью состояния. При достижении максимального терапевтического эффекта дозу постепенно снижают до поддерживающей дозы.

При психических нарушениях обычно назначают по 5 мг 2 раза в сутки, далее в течение 2-3 недель дозу постепенно увеличивают до 15-20 мг в сутки деленные на 2-3 приема. Для получения желаемого терапевтического эффекта и улучшения состояния пациента обычно необходимо 2-3 недели. Максимальная суточная доза 40 мг.

На первом этапе подбора дозы у пожилых, истощенных, ослабленных больных и детей целесообразно использовать лекарственные формы с меньшей дозировкой трифлуоперазина. Пожилым, а также истощенным и ослабленным больным требуется меньшая первоначальная доза, которую при необходимости с учетом переносимости постепенно увеличивают.

В качестве противорвотного средства препарат назначают взрослым по 5 мг/сутки.

Побочное действие

Со стороны центральной нервной системы: сонливость, головокружение, бессонница (в начале лечения), сухость во рту, при длительном применении высоких доз – акатизия, дистонические экстрапирамидные расстройства (спазмы мышц лица, шеи и спины, тикоподобные движения или подергивания, изгибающиеся движения туловища, невозможность двигать глазами, слабость в руках и ногах), паркинсонизм (затруднение при разговоре и глотании, потеря контроля равновесия, маскообразное лицо, шаркающая

походка, тугоподвижность рук и ног, дрожание кистей и пальцев), поздняя дискинезия (причмокивание и сморщивание губ, надувание щек, быстрые или червеобразные движения языка, неконтролируемые жевательные движения, неконтролируемые движения рук и ног). Дискинезии купируют подкожным введением 2 мл 20 % раствора кофеина натрия и 1 мл 0,1 % раствора атропина), нейролептический злокачественный синдром (судороги, затрудненное или учащенное дыхание, учащенное сердцебиение или неритмичный пульс, гипертермия, нестабильное артериальное давление, потливость, утрата контроля за мочеиспусканием, выраженная регидность мышц, необычно бледная кожа, необычная усталость и слабость), явления психической индеферентности, запоздалой реакции на внешние раздражения и другие изменения психики, в единичных случаях – судороги (в качестве корректоров применяют противопаркинсонические средства – тропацин, циклодол и др.); парадоксальные реакции – галлюцинации, психомоторное возбуждение.

Со стороны органов чувств: нечеткость зрительного восприятия, парез аккомодации (в начале лечения), при длительном применении – ретинопатия, помутнение хрусталика и роговицы.

Со стороны пищеварительной системы: снижение аппетита, анорексия, запоры (в начале лечения), булимия, тошнота, рвота, диарея, гастралгия, редко – холестатическая желтуха, гепатит, парез кишечника.

Со стороны мочеполовой системы: задержка мочи, снижение потенции и либидо, фригидность (в начале лечения), нарушения эякуляции, приапизм, олигурия.

Со стороны эндокринной системы: гипо- или гипергликемия, глюкозурия, аменорея, гиперпролактинемия, дисменорея, галакторея, набухание или боль в молочных железах, гинекомастия, увеличение массы тела.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: тахикардия, учащение приступов стенокардии (на фоне увеличения физической активности), в начале лечения - снижение артериального давления (в том числе, ортостатическая гипотензия) особенно у пожилых больных и лиц, страдающих алкоголизмом; нарушения ритма сердца, изменения на электрокардиограмме (удлинение интервала QT, снижение или инверсия зубца Т).

Аллергические реакции: кожная сыпь, крапивница, ангионевротический отек, эксфолиативный дерматит.

Лабораторные показатели: лейкопения, тромбоцитопения, анемия, агранулоцитоз (на 4-10 день лечения), панцитопения, эозинофелия (реже, чем у других фенотиазинов),

гемолитическая анемия, ложноположительные тесты на фенилкетонурию, ложноположительные тесты на беременность.

Прочие: фотосенсибилизация, окрашивание кожи и конъюнктивы, обесцвечивание склер и роговицы, снижение переносимости воздействия высоких температур (вплоть до развития теплового удара – горячая сухая кожа, утрата способности к потоотделению, слабость мышц, спутанность сознания), миастения.

При приеме нейролептиков фенотиазинового ряда отмечены случаи внезапной смерти (в том числе возможно вызванные кардиологическими причинами).

Передозировка

Симптомы: злокачественный нейролептический синдром (судороги, угнетение дыхание, аритмии, гипертермия, нестабильное артериальное давление, потливость, утрата контроля за мочеиспусканием, выраженная регидность мышц, необычно бледная кожа, спутанность сознания и др.), коллапс, гипотермия, кома, токсический гепатит.

Лечение: симтоматическое. Неврологические осложнения обычно уменьшаются при снижении дозы, а также назначением циклодола, при развитии нейролептической депрессии применяют антидепрессанты и психостимуляторы. Дискинезии купируются кофеином (2 мл 20 % раствора подкожно) и атропином (1 мл 0,1 % раствора). При аритмии вводят внутривенно фенитоин (9-11 мг/кг), при сердечной недостаточности – сердечные гликозиды, при выраженном снижении артериального давления – внутривенно вводят жидкости или вазопрессорные средства (норэпинефрин, фенилэфрин), следует избегать назначения альфа- и бета-адреномиметиков, таких как эпинефрин, поскольку возможно парадоксальное снижение артериального давления за счет блокады альфа-адренорецепторов трифлуоперазином. При судорогах применяют диазепам, следует избегать назначения барбитуратов вследствие возможного угнетения центральной нервной системы и дыхания. Диализ малоэффективен.

Контроль функции сердечно-сосудистой системы, дыхания, измерение температуры тела и наблюдение психиатра проводят в течение не менее 5 суток.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

При одновременном применении с препаратами, угнетающими центральную нервную систему (средства для наркоза, опиоидные анальгетики, барбитураты, анксиолитики, этанол и этанолсодержащие препараты и др.), возможно усиление депрессии центральной нервной системы и угнетение дыхания. При одновременном применении с трициклическими антидепрессантами, мапротилином, ингибиторами моноаминооксидазы возможно удлинение и усиление седативного и антихолинергического эффектов,

увеличение риска злокачественного нейролептического синдрома; с противосудорожными препаратами (в том числе с барбитуратами) – возможно понижение судорожного порога; с препаратами для лечения гипертиреоза – повышается риск развития агранулоцитоза; с препаратами, вызывающими экстрапирамидные реакции, – возможно увеличение частоты и тяжести экстрапирамидных нарушений; с антигипертензивными препаратами – возможна ортостатическая гипотензия. При сочетании с бета-адреноблокаторами усиливается гипотензивный эффект, повышается риск развития необратимой ретинопатии, аритмии и поздней дискинезии; при сочетании с диуретиками – усиление гипонатриемии; при сочетании с прохлорперазином – возможна длительная потеря сознания. Трифлуоперазин усиливает действие атропина, снижает эффект непрямых антикоагулянтов.

При одновременном применении с препаратами лития снижается всасывание в желудочно-кишечном тракте, увеличивается скорость выведения лития почками, усиливается выраженность экстрапирамидных расстройств, причем ранние признаки интоксикации литием (тошнота и рвота) могут маскироваться противорвотным эффектом трифлуоперазина.

Одновременное назначение альфа- и бета-адреностимуляторов (эпинефрин) и симпатомиметиков (эфедрин) может привести к парадоксальному снижению артериального давления. Трифлуоперазин ослабляет эффекты леводопы и фенаминов, последние снижают антипсихотическую активность трифлуоперазина. Алюминий и магний-содержащие антациды или антидиарейные адсорбенты снижают всасывание трифлуоперазина, амитриптилин, амантадин, антигистаминные и другие препараты с холиноблокирующим эффектом повышают его антихолинергическую активность. Трифлуоперазин уменьшает эффект средств, снижающих аппетит (за исключением фенфлурамина); снижает эффективность рвотного действия апоморфина, усиливая его угнетающее действие на центральную нервную систему; повышает концентрацию в плазме пролактина и препятствует действию бромкриптина. Пробукол, астемизол, цизарид, дизопирамид, эритромицин, пимозид, прокаинамид, хинидин способствуют дополнительному удлинению интервала QT, что увеличивает риск развития желудочковой тахикардии.

При одновременном назначении фенотиазидов с пропранололом отмечается увеличение концентрации обоих лекарственных средств.

Особые указания

Во время лечения необходимо осуществлять регулярный контроль функции сердечно-сосудистой системы, печени, почек и системы кроветворения. В период лечения не допускается применение алкоголя. Следует избегать воздействия высоких температур (возможно нарушение теплорегуляции).

При проведении миелографии препарат следует отменить не менее чем за 48 ч до процедуры и не возобновлять лечение в течение последующих 24 ч. Не следует использовать препарат для предотвращения рвоты перед миелографией.

Противорвотное действие препарата может маскировать признаки и симптомы токсичности, вызванные передозировкой других лекарственных средств, а также затруднять диагностику таких заболеваний, как кишечная непроходимость, опухоль мозга, синдром Рейе.

В случае развития симптомов экстрапирамидных расстройств в зависимости от степени их выраженности следует снизить дозу препарата или отменить терапию, а затем рассмотреть вопрос о возобновлении лечения, возможно, в меньших дозах.

При появлении признаков поздней дискинезии, нейролептического злокачественного синдрома лечение следует отменить.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами.

В период лечения препаратом пациенту следует воздерживаться от управления транспортными средствами и выполнения работ, требующих повышенного внимания, быстроты психических и двигательных реакций.

Форма выпуска

Таблетки, покрытые оболочкой, 5 мг.

По 10 или 50 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой для упаковки.

1 контурную ячейковую упаковку по 50 таблеток или 5 контурных ячейковых упаковок по 10 таблеток вместе с инструкцией по медицинскому применению помещают в пачку из картона.

Допускается, для стационаров, упаковка по 100 или по 300 контурных ячейковых упаковок по 50 таблеток или 450 контурных ячейковых упаковок по 10 таблеток, без вложения в пачку, вместе с соответствующим количеством инструкций по медицинскому применению.

Условия хранения

Список Б. В сухом, защищенном от света месте, при температуре от 15 °С до 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года. Не использовать препарат после окончания срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Производитель:

ООО "Фармацевтическая компания "Здоровье", Украина.

Претензии потребителей направлять в адрес производителя:

61013, г. Харьков, ул. Шевченко, 22.

Генеральный директор ООО «Фармацевтическая компания «Здоровье» **А. В. Доровской**

УКРАЇНА Товариство з обмеженою відповідальністю Фармацевтична компанія «Здоров'я» №31437750 місто Харків

РОСЗДРАВНАДЗОРА ЭКСПЕРТНЫЙ ОТЧЕТ ДЕЙСТВИТЕЛЕН ДЛЯ ДАННОЙ ВЕРСИИ ДОКУМЕНТА 0 0 0 00 0 0 0 3