МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ И СОЦИАЛЬНОГО РАЗВИТИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению лекарственного препарата

Трифтазин-Дарница

Регистрационный номер:

Торговое название препарата: Трифтазин-Дарница

Международное непатентованное название (МНН): трифлуоперазин

Лекарственная форма. Раствор для внутримышечного введения.

Состав:

1 мл раствора содержит:

действующее вещество: трифтазина (трифлуоперазина дигидрохлорида) в пересчете на 100% сухое вещество 2,00 мг;

вспомогательные вещества: натрия цитрат дигидрат 1 мг, вода для инъекций до 1 мл.

Описание: прозрачная бесцветная или слегка желтоватая жидкость.

Фармакотерапевтическая группа: антипсихотические средства. Пиперазиновые производные фенотиазина.

Код АТХ: N05A B06.

Фармакологические свойства

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 блокаде дофаминовых рецепторов увеличивается выделение пролактина гипофизом). Блокада альфа-адренорецепторов сосудов определяет его гипотензивный эффект. 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 n.vagus в желудочно-кишечном тракте.

Гипотермическое действие – блокадой дофаминовых рецепторов гипоталамуса. Структурно схож с хлорпромазином, имеет более высокую активность, лучше переносится. Седативное действие и влияние на вегетативную нервную систему выражено слабее, чем у других фенотиазинов, экстрапирамидное и противорвотное действие – сильнее.

Фармакокинетика

Абсорбция – высокая. Биодоступность после перорального приема – 35% (имеет эффект "первого прохождения" через печень). Связь с белками плазмы – 95%. TC_{max} – 2-4 часа, при внутримышечном введении – 1-2 часа. Проникает через гематоэнцефалический баоьер, плаценту и в грудное молоко.

Интенсивно метаболизируется в печени, метаболиты фармакологически неактивны. $T_{1/2}$ – 15-30 часов. Выводится в основном почками (в виде метаболитов) и с желчью. При проведении гемодиализа диализируется слабо (высокая связь с белками плазмы).

Показания к применению

Психотические расстройства, в т.ч. шизофрения. Психомоторное возбуждение. Неврозы с преобладанием тревоги и страха. Симптоматическое лечение тошноты и рвоты.

Противопоказания

Гиперчувствительность (в т.ч. к другим фенотиазинам), тяжелые сердечно-сосудистые заболевания (декомпенсированная хроническая сердечная недостаточность, артериальная гипотензия), выраженное угнетение функции центральной нервной системы (в т.ч. на фоне лекарственного средства) и коматозные состояния любой этиологии, черепно-мозговая травма, прогрессирующие заболевания головного и спинного мозга, угнетение костномозгового кроветворения, тяжелая печеночная недостаточность, детский возраст (до 3 лет), беременность, период лактации.

С осторожностью

Алкоголизм (повышенная предрасположенность к гепатотоксическим реакциям), стенокардия, клапанные поражения сердца, лимитирующие величину минутного объема кровообращения (возможно развитие тяжелой артериальной гипотензии), патологические изменения крови (нарушение кроветворения), рак молочной железы (в результате индуцированной фенотиазинами 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 12-перстной 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 развития проявлений гепатотоксичности у детей и подростков); кахексия, рвота (противорвотное действие фенотиазинов может маскировать рвоту, связанную с передозировкой других лекарственных средств), пожилой возраст. Пациенты, подвергаемые действию высоких температур.

Способ применения и дозы

Взрослым: внутримышечно по 1-2 мг, при необходимости каждые 4-6 часов. При более частых инъекциях возможны явления кумуляции. Максимальная суточная доза – 10мг/сут. При депрессивно-галлюцинаторных и депрессивно-бредовых состояниях Трифтазин-Дарница применяют совместно с антидепрессантами.

В качестве противорвотного средства Трифтазин-Дарница назначается в дозах 1-4 мг в день.

Детям старше 6 лет (при маниакально-депрессивном психозе) – по 1 мг 1-2 раза в сутки.

Пожилым, а также истощенным и ослабленным пациентам начальную дозу уменьшают в 2 раза.

Лечение Трифтазином-Дарница должно быть строго индивидуализировано в зависимости от течения заболевания. Сроки лечения могут составлять 3-9 месяцев, а в отдельных случаях и более того.

Побочное действие

Со стороны центральной и периферической нервной системы: головная боль, сонливость, головокружение, бессонница, акатизия, дистонические экстрапирамидные реакции, псевдопаркинсонизм, поздняя дисамнезия, нейролептический злокачественный синдром, явления психической индифферентности, запоздалая реакция на внешние раздражители, акинетико-ригидные явления, гиперкинезы, тремор, вегетативные нарушения, поздняя дискинезия лицевых мышц, дистония, нарушение терморегуляции.

Со стороны органов системы чувств: парез аккомодации, ретинопатия, помутнение хрусталика и роговицы.

Со стороны желудочно-кишечного тракта: сухость во рту, анорексия, булимия, тошнота, рвота, диарея, запоры, гастралгия.

Со стороны печени и желчевыводящих путей: холестатическая желтуха, гепатотоксичность.

Со стороны эндокринной системы и метаболические нарушения: гипо- или гипергликемия, глюкозурия, нарушения менструального цикла (дисменорея, аменорея),

гинекомастия, увеличение массы тела, галакторея, боль в груди, лактация, нарушение либидо.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: тахикардия, снижение артериального давления (ортостатическая гипотензия), нарушения ритма сердца, изменения на электрокадиограмме (удлинение интервала QT, сглаживание зубца Т), остановка сердца.

Со стороны системы крови: тромбоцитопения, агранулоцитоз, анемия (гемолитическая, апластическая), панцитопения, лейкопения, тромбоцитопеническая пурпура, эозинфилия.

Со стороны мочеполовой системы: снижение потенции, нарушения эякуляции, приапизм, задержка мочи, олигурия, нарушение мочевыделения.

Дерматологические нарушения: фотодермия, покраснение кожи, депигментация кожи.

Аллергические реакции: кожные высыпания, крапивница, ангионевротический отек, анафилактический шок.

Передозировка

Симптомы: злокачественный нейролептический синдром, коллапс, гипотермия, кома, токсический гепатит.

Лечение: симптоматическое: при коллапсе вводят никетамид, кофеин, фенилэфрин. Неврологические осложнения обычно уменьшаются при снижении дозы, а также назначением циклодола; при развитии нейролептической депрессии применяют антидепрессанты и психостимуляторы. Диализ малоэффективен.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

Средства, угнетающие функции центральной нервной системы (средства для наркоза, опиоидные аналгетики, барбитураты, анксиолитики, этанол, этанолсодержащие препараты) – усиливается эффект препарата, усиливается депрессия центральной нервной системы и угнетается дыхание.

Индукторы CYP1A2 (карбамазепин, фенобарбитал, рифампицин, аминоглютетимид) – снижают концентрацию и эффект Трифтазина-Дарница.

Ингибиторы CYP1A2 (амиодарон, ципрофлоксацин, флувоксамин, кетоконазол, норфлоксацин, офлоксацин, рофекоксиб) – повышают концентрацию и эффект Трифтазина-Дарница.

α-адреноблокаторы – повышают гипотензивные эффекты препарата.

Леводопа и фенамины – снижают эффект препарата.

Противоэпилептические средства – при одновременном применении снижается эффект противоэпилептических препаратов.

Антитиреоидные препараты – увеличивается риск развития агранулоцитоза.

Астемизол, дизопирамид, эритромицин, прокаинамид – увеличивается риск развития тахикардии.

Трициклические антидепрессанты, мапротилин, ингибиторы моноаминооксидазы – возможны удлинение и усиление седативного и антихолинергического эффектов Трифтазина-Дарница.

Препараты лития – возможно усиление экстрапирамидных нарушений, раннее наступление признаков интоксикации литием.

Адреномиметики и симпатомиметики – одновременное применение может привести к парадоксальному снижению артериального давления.

Взаимно усиливаются эффекты при одновременном приеме этанола.

Противосудорожные препараты – возможно снижение судорожного порога.

Препараты, вызывающие экстрапирамидные реакции (метоклопрамид) – возможно увеличение частоты и тяжести экстрапирамидных нарушений.

Антигипертензивные препараты – возможно развитие ортостатической артериальной гипотензии.

Прохлорперазин – возможна длительная потеря сознания.

Препарат может ослаблять сосудосуживающий эффект эфедрина и эпинефрина, усиливать антихолинергические эффекты других препаратов, угнетать действие амфетаминов, леводопы, клонидина, гуанетидина.

Бромокриптин – фенотиазины угнетают способность бромокриптина снижать концентрацию пролактина в сиворотке крови.

Пропранолол, сульфадоксин – увеличивают концентрацию Трифтазина-Дарница в плазме крови.

Полипептидные антибиотики – одновременное применение может вызвать паралич дыхательных мышц.

Тразодон – наблюдается аддитивный гипотензивный эффект.

Вальпроиновая кислота – при одновременном применении наблюдается увеличение концентрации вальпроиновой кислоты в плазме крови.

Особые указания

Нейролептический злокачественный синдром может возникнуть в любое время в процессе лечения нейролептиками и привести к летальному исходу.

Введение эпинефрина для купирования вызванной трифлуоперазином гипотензии нецелесообразно, поскольку альфа-адренергический эффект эпинефрина может быть блокирован, а стимуляция бета-адренорецепторов может способствовать дальнейшему снижению АД и развитию тахикардии.

У пожилых больных возможно развитие необратимых дискинезий. При появлении признаков поздней дискинезии, нейролептического злокачественного синдрома лечение следует отменить.

Следует избегать воздействия высоких температур (возможно нарушение терморегуляции).

На фоне терапии фенотиазинами возможно получение ложноположительных тестов на фенилкетонурию.

Назначение фенотиазинов должно быть прекращено не менее чем за 48 часов до предполагаемого проведения миелографии (возобновление возможно через 24 часа).

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций, не допускать употребления этанола.

Форма выпуска

Раствор для внутримышечного введения.

По 1 мл в ампулу из прозрачного стекла.

По 5 ампул с ножом для вскрытия ампул или скарификатором ампульным в контурную ячейковую упаковку (кассету).

Две контурные ячейковые упаковки с инструкцией по медицинскому применению в пачку.

По 10 ампул с инструкцией по медицинскому применению и ножом для вскрытия ампул или скарификатором ампульным в коробку с гофрированным вкладышем. Коробки оклеивают этикеткой-бандеролью.

При упаковке ампул с цветным кольцом либо точкой излома ножи для вскрытия ампул или скарификаторы ампульные не вкладываются.

Условия хранения

Хранить в недоступном для детей месте, при температуре от 5°С до 25°С.

Срок годности. 4 года.

Не применять после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска.

По рецепту.

Производитель:

ЗАО «Фармацевтическая фирма «Дарница»

Юридический адрес: 02093, Украина, г. Киев, ул. Бориспольская, 13

Адрес производства: 02093, Украина, г. Киев, ул. Бориспольская, 13

Тел./факс +38(044) 207-73-27

www.darnitsa.ua

Предприятие, принимающее претензии от потребителей.

ЗАО «Фармацевтическая фирма «Дарница»

02093, Украина, г. Киев, ул. Бориспольская, 13

Тел./факс +38(044) 207-73-27

Председатель Правления –

Генеральный директор

ЗАО «Фармацевтическая фирма «Дарница» Г.В. Загорий