ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению препарата АМИНАЗИН®

Регистрационный номер:
Торговое название: Аминазин®.
Международное непатентованное название (МНН): Хлорпромазин.
Лекарственная форма: драже.
Состав на одно драже:
Активное вещество: хлорпромазина гидрохлорида в пересчете на 100 % вещество 0,025 г (25 мг), 0,05 г (50 мг) или 0,1 г (100 мг).
Вспомогательные вещества: сахароза (сахар), патока крахмальная, желатин, воск, тальк, титана диоксид, подсолнечника масло, краситель железа оксид черный (для драже 50 мг и 100 мг).
Описание: драже шарообразной формы белого цвета (для дозировки 25 мг), коричнево-розового цвета (для дозировки 50 мг) и коричневого цвета (для дозировки 100 мг). Допускаются на поверхности драже коричневого и коричнево-розового цвета вкрапления более темного цвета.

Фармакотерапевтическая группа: антипсихотическое средство (нейролептик).
Код АТХ: [N05AA01]
Фармакологические свойства
Аминазин® (хлорпромазин) - антипсихотическое средство (нейролептик), из группы алифатических производных фенотиазина
Фармакодинамика: Оказывает выраженный антипсихотический и седативный эффект, уменьшает двигательную активность, усиливает длительность и интенсивность действия снотворных, анальгетиков, местных анестетиков, противосудорожных средств и алкоголя, вызывает экстрапирамидные расстройства, усиливает секрецию пролактина гипофизом. Механизм антипсихотического действия Аминазина® связан с блокированием постсинаптических мезолимбических и мезокортикальных дофаминергических рецепторов в головном мозге. Седативное действие обусловлено блокадой адренорецепторов ретикулярной формации ствола головного мозга. Препарат обладает противорвотным действием (блокада дофаминовых D_2-рецепторов триггерной зоны рвотного центра) и успокаивает икоту. Также Аминазин® обладает гипотермическим действием (блокада дофаминовых рецепторов гипоталамуса), имеет выраженное α-адреноблокирующее действие при слабом влиянии на холинорецепторы. Он уменьшает или устраняет повышение артериального давления и другие эффекты, вызываемые эпинефрином (гипергликемический эффект эпинефрина не устраняется). Обладает сильным каталептогенным действием.
Аминазин® угнетает интероцептивные рефлексы, уменьшает проницаемость капилляров, оказывает слабое антигистаминное действие. Под влиянием Аминазина® снижается артериальное давление, часто развивается тахикардия. Аминазин® обладает местнораздражающим действием.
Фармакокинетика: После приёма внутрь всасывается не полностью. Максимальная концентрация в плазме крови отмечается через 2-4 ч после приёма внутрь. Более чем на 90 % связывается белками плазмы крови, поэтому практически не подвергается гемодиализу. Быстро выводится из кровеносной системы и неравномерно накапливается в различных органах. Легко проникает через гематоэнцефалический барьер, при этом его концентрация в мозге превышает концентрацию в плазме. Отсутствует прямая корреляция между концентрациями в плазме крови хлорпромазина и его метаболитов и терапевтическим эффектом.

Обладает эффектом "первого прохождения" через печень, где препарат интенсивно метаболизируется в результате окисления (30 %), гидроксилирования (30 %) и дезаметилирования (20 %). Фармакологической активностью обладают окисленные гидроксилированные метаболиты, которые инактивируются путем связывания с глюкуроновой кислотой, либо путем дальнейшего окисления с образованием неактивных сульфоксидов. Выводится почками и с желчью. Период полувыведения составляет в среднем 30 часов. За сутки выводится около 20 % принятой дозы, 1-6 % дозы выделяется с мочой в неизменном виде. Следы метаболитов хлорпромазина можно обнаружить в моче через 12 мес и более после прекращения лечения.

Показания к применению

В психиатрической практике Аминазин® применяют при разных видах психомоторного возбуждения и психотических состояний у больных шизофренией, маниакальном возбуждении при маниакально-депрессивном психозе и при других психических заболеваниях различного генеза, сопровождающихся страхом, тревогой, возбуждением, бессонницей; при расстройствах настроения при психопатиях, при психотических расстройствах у больных эпилепсией и органическими заболеваниями центральной нервной системы, для облегчения состояний абстиненции при алкоголизме и токсикоманиях.

Упорная икота.

Для усиления действия анальгетиков при упорных болях.

Заболевания, сопровождающиеся повышением мышечного тонуса (после нарушений мозгового кровообращения и др.).

Противопоказания

- повышенная индивидуальная чувствительность;
- угнетение функции ЦНС и коматозные состояния любой этиологии;
- травмы мозга;
- заболевания печени, почек и кроветворных органов с нарушением функций;
- прогрессирующие системные заболевания головного и спинного мозга;
- при язвенной болезни желудка и 12-перстной кишки в период обострения;
- заболевания сердца в стадии декомпенсации (пороки сердца, миокардиодистрофии, ревмокардит и др.), выраженная артериальная гипотензия, заболевания сопровождающиеся риском тромбоэмболических осложнений;
- бронхоэктатическая болезнь в стадии декомпенсации;
- закрытоугольная глаукома (риск повышения внутриглазного давления);
- гиперплазия предстательной железы;
- микседема;
- беременность, период грудного вскармливания;
- дети до 3-х лет.

С осторожностью

Болезнь Паркинсона, активный алкоголизм (риск развития гепатотоксических эффектов), рак молочной железы, эпилепсия, хронические заболевания, сопровождающиеся нарушением дыхания (особенно у детей), синдром Рейе, кахексия, пожилой возраст, рвота (противорвотное действие фенотиазинов может маскировать рвоту, связанную с передозировкой др. препаратов).

Способ применения и дозы

Драже Аминазин® назначают внутрь (после еды), не разжевывая, запивая достаточным количеством воды.

Начальная суточная доза для приёма внутрь составляет 25-100 мг/сут 1-4 раза в день, затем, с учетом переносимости, дозу постепенно увеличивают на 25-50 мг каждые 3-4 дня, до достижения желаемого терапевтического эффекта. В случае малоэффективности средних доз Аминазина®, дозу увеличивают до 700-1000 мг/сут, в некоторых, крайне резистентных случаях без соматических противопоказаний дозу можно повысить до 1200-1500 мг/сут. При лечении большими дозами, суточную дозу делят на 4 части (последняя – перед сном). Длительность курса лечения большими дозами не должна превышать 1-1,5 мес, при отсутствии эффекта целесообразно перейти к лечению другими препаратами.

Высшие дозы Аминазина® для взрослых внутрь: разовая 0,3 г, суточная 1,5 г.

Детям Аминазин® назначают в зависимости от возраста: от 3 лет и старше внутрь по 550 мкг/кг (0,55 мг/кг) или по 15 мг на 1 $м^2$ поверхности тела при необходимости каждые 6-8 ч.

Детям 3-5 лет (массой тела до 23 кг) не следует вводить более 40 мг в сутки; детям 5-12 лет (массой тела от 23 до 46 кг) не следует вводить более 75 мг в сутки.

Для применения в педиатрической практике целесообразно использовать лекарственные формы для детей.

Ослабленным и пожилым больным, в зависимости от возраста, назначают до 0,3 г/сут.

Побочное действие

После применения препарата независимо от способа введения больные должны лежать 1,5-2 часа; резкий переход в вертикальное положение может вызвать ортостатический коллапс.

Применение Аминазина® довольно часто сопровождается экстрапирамидными расстройствами (дискинезии, акипето-ригидные явления, акатизия, гиперкинезы, тремор, вегетативные нарушения), в единичных случаях судороги. В качестве корректоров применяют атипаркинсонические средства - тропацин, тригексифенидил (циклодол) и др. Дискинезии пароксизмально возникающие судороги мышц шеи, языка, дна ротовой полости, окулогирные кризы) купируются кофеин-бензоатом натрия (2 мл 20 % раствора подкожно) и атропином (1 мл, 1 % раствора подкожно).

При длительном приёме возможно развитие поздней дискинезии, реже – злокачественный нейролептический синдром.

В начале лечения могут наблюдаться сонливость, головокружение, сухость во рту, анорексия, нарушения аккомодации, умеренно выраженная ортостатическая гипотензия, тахикардия, сухость во рту, расстройства сна, затруднение мочеиспускания, запор.

Также возможны нарушения сердечного ритма (риск развития желудочковых нарушений ритма, особенно на фоне исходной брадикардии, гипокалиемии, удлиненного РТ), тошнота, рвота, диарея, гиперпролактинемия, галакторея, гинекомастия, аменорея, олигурия, импотенция, фригидность.

Могут наблюдаться аллергические реакции со стороны кожи и слизистых оболочек, ангионевротический отек, отек лица, а также фотосенсибилизация кожи (больные не должны в связи с этим подвергаться УФ облучению).

При применении Аминазина® могут возникнуть явления психической индифферентности, запоздалой реакции на внешние раздражения и другие изменения психики. При применении Аминазина® может наблюдаться, так называемая, нейролептическая депрессия. Для уменьшения нейролептической депрессии используют антидепрессанты и стимуляторы центральной нервной системы.

После длительного применения больших доз Аминазина® (0,5-1,5 г в сутки) может наблюдаться холестатическая желтуха, повышение свертываемости крови, лимфо- и лейкопения, анемия, агранулоцитоз, пигментация кожи, помутнение хрусталика и роговицы, меланоз.

Передозировка (интоксикация) препаратом

Симптомы: арефлексия или гиперрефлексия, нечеткость зрительного восприятия, кардиотоксическое действие (аритмия, сердечная недостаточность, снижение АД, шок, тахикардия, изменение зубца QRS, фибрилляция желудочков, остановка сердца), нейротоксическое действие, включая ажитацию, спутанность сознания, судороги, дезориентацию, сонливость, ступор или кому; мидриаз, сухость во рту, гиперпирексия или гипотермия, ригидность мышц, рвота, отек легких или угнетение дыхания. Лечение: промывание желудка, назначение активированного угля (избегать индукции рвоты, поскольку нарушение сознания и дистонические реакции со стороны мышц шеи и головы, обусловленные передозировкой, могут привести к аспирации рвотных масс). Симптоматическое лечение: при аритмии - в/в фенитоин 9-11 мг/кг, при сердечной недостаточности - сердечные гликозиды, при выраженном снижении АД - в/в введение жидкости или вазопрессорных средств, таких как норэпинефрин, фенилэфрин (избегать назначения альфа- и бета-адреномиметиков, таких как эпинефрин, поскольку возможно парадоксальное снижение АД, за счет блокады альфа-адренорецепторов хлорпромазином), при судорогах - диазепам (избегать назначения барбитуратов, вследствие возможной последующей депрессии ЦНС и угнетения дыхания), при паркинсонизме - дифенилтропин, дифенгидрамин. Контроль функции сердечно-сосудистой системы в течение не менее 5 сут, функции ЦНС, дыхания, измерение температуры тела, консультация психиатра. Диализ малоэффективен.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

При одновременном применении Аминазина® с другими препаратами, оказывающими угнетающее влияние на ЦНС (средства для обшей анестезии, наркотические анальгетики, этанол (алкоголь) и содержащие его препараты, барбитураты, транквилизаторы и др.) возможно усиление депрессии ЦНС, а также угнетение дыхания; нежелательно продолжительное сочетание с анальгетиками и антипиретиками - возможно развитие гипертермии с трициклическими антидепрессантами, мапротилином или ингибиторами МАО – увеличение риска развития нейролептического злокачественного синдрома; с противосудорожными препаратами - возможно понижение судорожного порога; с препаратами для лечения гипертиреоза - повышается риск развитая агранулоцитоза; с другими препаратами, вызывающими экстрапирамидные реакции - возможно увеличение частоты и тяжести экстрапирамидных нарушений;

с гипотензивными препаратами - возможна выраженная ортостатическая гипотензия; с эфедрином - возможно ослабление сосудосуживающего эффекта эфедрина.

При лечении Аминазином® следует избегать введения эпинефрина (адреналина), так как возможно извращение эффекта эпинефрина, что может привести к падению артериального давления. Антипаркинсоническое действие леводопы снижается из-за блокирования допаминовых рецепторов. Аминазин® может подавлять действие амфетаминов, клонидина, гуанетидина.

Аминазин® усиливает антихолинергические эффекты других препаратов, при этом антипсихотический эффект нейролептика может уменьшаться.

При одновременном применении Аминазина® с родственным по химической структуре прохлорперазином может наступить длительная потеря сознания.

Антациды, противопаркинсонические препараты и соли лития могут снижать всасывание хлорпромазина, кроме того, сочетание с препаратами лития увеличивает риск экстрапирамидных осложнений.
Хлорпромазин может маскировать некоторые проявления ототоксичности (шум в ушах, головокружение) лекарственных средств, оказывающих ототоксическое действие (напр. антибиотики с ототоксическим действием).
Другие гепатотоксичные препараты повышают риск развития гепатотоксичности.
Средства, угнетающие костномозговое кроветворение, увеличивают риск миелосупрессии.

Особые указания
Во время лечения необходимо осуществлять регулярный контроль артериального давления, пульса и функции печени, почек и крови.

В период лечения не допускать применения алкоголя!
В период лечения необходимо воздерживаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска
Драже 25 мг, 50 мг и 100 мг.
По 10 драже в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.
3, 5 или 10 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.
По 100 контурных ячейковых упаковок с равным количеством инструкций по применению в коробки из картона или в пакеты из пленки полиэтиленовой.
По 3200 штук ± 5 % (дозировкой 25 мг), 2285 штук ± 5 % (дозировкой 50 мг), 1600 штук ± 5 % (дозировкой 100 мг) в банки полимерные, изготовленные из полиэтилена, с пакетом из пергамента или подпергамента или бумаги парафинированной.
18 полимерных банок с инструкциями по применению в транспортную тару (для стационаров).

Условия хранения
В защищенном от влаги месте при температуре не выше 25 °С.
Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности
5 лет.
Не использовать позже срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек
По рецепту врача.

Претензии от покупателей принимает предприятие-производитель:
ОАО «Валента Фармацевтика»,
141101, г. Щелково, Московская область, ул. Фабричная, 2.
Тел. (495) 933-48-62, факс: (495) 933-48-63.

Генеральный директор
ОАО «Валента Фармацевтика» С.А.Окуньков

МЗСР РФ ЭКСПЕРТНЫЙ ОТЧЕТ ДЕЙСТВИТЕЛЕН ДЛЯ ДАННОЙ ВЕРСИИ ДОКУМЕНТА 00000 00000

60807