

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Тиаприд, 100 мг, таблетки

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: тиаприда гидрохлорид

Каждая таблетка содержит 111,1 мг тиаприда гидрохлорид (в пересчете на тиаприда основание – 100,0 мг)

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: лактозы моногидрат (см. разделы 4.3., 4.4.).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки

Круглые плоскоцилиндрические таблетки белого или почти белого цвета с фаской.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1. Показания к применению

Препарат Тиаприд показан к применению у взрослых и детей старше 6 лет по показаниям:

У взрослых

Краткосрочный курс лечения (не более 4-х недель) ажитации и агрессивных состояний:

- у пожилых пациентов.
- у пациентов с алкогольной зависимостью при недостаточной эффективности или непереносимости бензодиазепинов.

У взрослых и детей старше 6 лет

Тяжелая форма хореи, тяжелая форма синдрома Жилля де ла Туретта.

У детей старше 6 лет

Расстройства поведения с ажитацией и агрессивностью

4.2. Режим дозирования и способ применения

Только для взрослых и детей старше 6 лет.

Необходимо всегда подбирать минимально эффективную дозу. Если позволяет состояние пациента, лечение следует начинать с низких доз с последующей титрацией (постепенным повышением). Суточная доза препарата делится на 2 - 3 приема.

Режим дозирования

Взрослые

Купирование психомоторного возбуждения и агрессивных состояний, особенно при хроническом алкоголизме

Препарат назначают в дозе 200-300 мг в сутки. Курс лечения 1-2 месяца.

Хорея, синдром Жилля де ла Туретта

Суточная доза составляет 300 - 800 мг в сутки.

Лечение следует начинать с очень низкой дозы - 25 мг в сутки, с ее последующим постепенным увеличением до достижения минимальной эффективной дозы.

Продолжительность лечения определяется в каждом конкретном случае врачом и зависит от клинического течения заболевания.

Особые группы пациентов

Пациенты пожилого возраста

Купирование психомоторного возбуждения и агрессивных состояний, особенно при хроническом алкоголизме

Препарат назначают в дозе 200 - 300 мг в сутки, доза должна достигаться постепенно.

Лечение следует начинать с дозы 50 мг 2 раза в сутки. Затем доза может постепенно увеличиваться на 50 - 100 мг каждые 2 - 3 дня. Средняя доза, применяемая у пациентов пожилого возраста, составляет 200 мг в сутки, а максимальная доза - 300 мг в сутки.

Пациенты с нарушениями функции почек

У пациентов с нарушениями функции почек экскреция тиаприда коррелирует с клиренсом креатинина. Поэтому при клиренсе креатинина 30 - 60 мл/мин дозу следует снижать на 25 %, при клиренсе креатинина 10 - 30 мл/мин дозу следует уменьшить в 2 раза, при клиренсе креатинина менее 10 мл/мин дозу следует уменьшить в 4 раза, по сравнению с дозами при нормальной функции почек.

Пациенты с нарушением функции печени

Препарат метаболизируется незначительно, поэтому снижения дозы не требуется.

Дети

Различные типы хореи, синдром Жилля де ла Туретта

Для детей старше 6 лет суточная доза обычно составляет 3 - 6 мг/кг массы тела в сутки.

Максимальная доза составляет 300 мг в сутки.

Продолжительность лечения определяется в каждом конкретном случае врачом и зависит от клинического течения заболевания.

Расстройства поведения с ажитацией и агрессивностью

Доза составляет 100 - 150 мг в сутки.

Способ применения

Внутрь.

4.3. Противопоказания

- гиперчувствительность к тиаприду или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1.;
- диагностированные или подозреваемые пролактинзависимые опухоли, например, пролактинома гипофиза и рак молочной железы;
- феохромоцитома, подозрение на феохромоцитому;
- детский возраст до 6 лет (риск развития удушья при попадании таблетки в дыхательные пути);
- период грудного вскармливания (см. раздел 4.6.);
- одновременный прием леводопы (см. раздел 4.5.).
- одновременный прием каберголина, хинаголида (см. раздел 4.5.).

- лактазная недостаточность, глюкозо-галактозная мальабсорбция, непереносимость лактозы.

Не рекомендуется применение препарата при болезни Паркинсона (кроме случаев настоятельной необходимости применения тиаприда, см. разделы 4.4., 4.5.).

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

С осторожностью

- У пациентов с предрасполагающими факторами для развития аритмий (с брадикардией менее 55 ударов в минуту; с электролитными нарушениями, в частности, с гипокалиемией, гипомagneмией; с врожденным удлинением интервала QT; с сопутствующей терапией препаратами, способными вызывать выраженную брадикардию (менее 55 ударов в минуту), электролитные нарушения, замедлять внутрисердечную проводимость или удлинять интервал QT, так как тиаприд может удлинять интервал QT и увеличивать риск развития тяжелых желудочковых нарушений ритма, включая развитие желудочковой тахикардии типа «пируэт» (см. подраздел «Особые указания» и раздел 4.5.).
- У пациентов с болезнью Паркинсона, принимающих агонисты дофаминовых рецепторов (амантадин, апоморфин, бромокриптин, энтакапон, лисурид, перголид, пирибедил, ропинирол, селегилин), если есть настоятельная необходимость в применении тиаприда (см. подраздел «Особые указания» и раздел 4.5.).

- У пациентов с тяжелыми сердечно-сосудистыми заболеваниями (из-за возможности усиления ишемических расстройств при снижении артериального давления).
- У пациентов пожилого возраста (повышенный риск развития снижения уровня сознания, комы, ортостатической гипотензии).
- У пациентов пожилого возраста с деменцией (см. подраздел «Особые указания»).
- У пациентов с факторами риска развития инсульта (см. подраздел «Особые указания»).
- У пациентов с почечной недостаточностью (требуется коррекция режима дозирования, см. подраздел «Особые указания» и раздел 4.2.).
- У пациентов с нарушениями функции печени (см. раздел 4.2.).
- У пациентов с эпилепсией (нейролептики могут понижать порог судорожной активности, хотя этот эффект у тиаприда не изучался).
- У пациентов с факторами риска развития тромбозов (см. подраздел «Особые указания»).
- У пациентов, имеющих в анамнезе (в том числе, семейном анамнезе) рак молочной железы (см. подраздел «Особые указания»).
- У детей (недостаточно данных о применении препарата у этой категории пациентов).
- У подростков в период полового созревания (из-за возможности развития нежелательных эффектов со стороны эндокринной системы, см. раздел 4.8.).
- Во время беременности (см. раздел 4.6.).
- При одновременном применении лекарственных средств, содержащих этанол (см. раздел 4.5.).

Особые указания

Злокачественный нейролептический синдром

Злокачественный нейролептический синдром характеризуется бледностью, гипертермией, ригидностью мышц, дисфункцией вегетативной нервной системы, нарушением сознания. Признаки дисфункции вегетативной нервной системы, такие как повышенное потоотделение и лабильность артериального давления и пульса, могут предшествовать наступлению гипертермии и, следовательно, являться ранними, предупреждающими симптомами. В случае необъяснимого повышения температуры тела лечение тиапридом должно быть прекращено. Причина развития злокачественного нейролептического синдрома остается невыясненной. Предполагается, что в его механизме играет роль блокада дофаминовых рецепторов в

полосатом теле и гипоталамусе, не исключается врожденная предрасположенность (идиосинкразия). Развитию синдрома могут способствовать интеркуррентная инфекция, нарушения водно-электролитного баланса (в частности, дегидратация, гипонатриемия), одновременное назначение препарата лития, органическое поражение мозга.

Наблюдались случаи с нетипичными проявлениями злокачественного нейролептического синдрома, например, без ригидности мышц или артериальной гипертензии и с менее выраженной гипертермией.

Удлинение интервала QT

Тиаприд может вызывать удлинение интервала QT. Известно, что этот эффект увеличивает риск развития серьезных желудочковых аритмий, таких как желудочковая тахикардия типа «пируэт» (см. раздел 4.8.).

Перед назначением терапии нейролептиками, если позволяет состояние пациента, необходимо исключить наличие факторов, предрасполагающих к развитию этих тяжелых нарушений ритма (брадикардии менее 55 ударов в минуту, гипокалиемии, гипомагниемии, замедления внутрижелудочковой проводимости и врожденного удлиненного интервала QT или удлинения интервала QT при применении других препаратов, удлиняющих интервал QT) (см. подразделы «С осторожностью» и разделы 4.3., 4.8.).

Пациентам с вышеперечисленными факторами риска, предрасполагающими к удлинению интервала QT, при необходимости назначения тиаприда, необходимо соблюдать особую осторожность. Гипокалиемия и гипомагниемия должны быть скорректированы до начала применения препарата, кроме того, следует обеспечить медицинское наблюдение, контроль электролитов крови и ЭКГ.

Экстрапирамидный синдром

При экстрапирамидном синдроме, вызванном нейролептиками, следует назначать антихолинергические препараты (а не агонисты дофаминовых рецепторов) (см. раздел 4.5).

Инсульт

В рандомизированных клинических исследованиях по сравнению некоторых атипичных нейролептиков с плацебо, проведенных у пациентов пожилого возраста с деменцией, наблюдалось трехкратное увеличение риска развития цереброваскулярных осложнений. Механизм этого риска неизвестен. Нельзя исключить увеличение такого риска при приеме других нейролептиков или в других популяциях пациентов, поэтому тиаприд следует с осторожностью назначать пациентам с факторами риска развития инсульта.

Пациенты пожилого возраста с деменцией

У пациентов пожилого возраста с психозами, связанными с деменцией, при лечении антипсихотическими препаратами наблюдалось повышение риска наступления смерти. Анализ 17-ти плацебо-контролируемых исследований (средней продолжительностью более 10 недель) показал, что большинство пациентов, получавших атипичные антипсихотические препараты, имели в 1,6 - 1,7 раз больший риск смерти, чем пациенты, получавшие плацебо. В ходе 10-недельного плацебо-контролируемого исследования частота смертельных исходов при приеме атипичных нейролептиков такими пациентами составляла 4,5 %, а при приеме плацебо - 2,6 %.

Хотя причины смерти в клинических исследованиях с атипичными антипсихотическими препаратами варьировали, большинство причин смертей было или сердечно-сосудистыми (например, сердечная недостаточность, внезапная смерть), или инфекционными (например, пневмония) по природе.

Наблюдательные исследования подтвердили, что, подобно лечению атипичными антипсихотическими средствами, лечение обычными антипсихотическими средствами также может увеличивать смертность.

Степень, до которой увеличение смертности может быть обусловлено антипсихотическим препаратом, а не некоторыми особенностями пациентов, неясна.

Венозные тромбоэмболические осложнения

При применении антипсихотических препаратов наблюдались случаи венозных тромбоэмболических осложнений (ВТО), иногда с летальным исходом (см. раздел 4.8). Поэтому тиаприд следует применять с осторожностью у пациентов с факторами риска развития ВТО. Так как у пациентов, принимающих нейролептики, часто имеются приобретенные факторы риска развития ВТО, любые потенциальные факторы риска развития ВТО должны выявляться до начала и во время лечения препаратом Тиаприд, а также во время его приема следует проводить мероприятия, направленные на профилактику тромбоэмболических осложнений.

Рак молочной железы

Тиаприд может увеличивать концентрацию пролактина в плазме крови. Поэтому при применении тиаприда у пациентов, имеющих в анамнезе (в том числе, семейном анамнезе) рак молочной железы, следует соблюдать осторожность (см. подраздел «С осторожностью»). Такие пациенты должны находиться под тщательным наблюдением.

Пациенты с эпилепсией

В связи с тем, что тиаприд может понижать порог судорожной активности, при назначении тиаприда пациентам с эпилепсией последние должны находиться под строгим медицинским наблюдением.

Пациенты с болезнью Паркинсона, принимающие агонисты дофаминовых рецепторов

Кроме исключительных случаев, препарат Тиаприд не должен применяться у пациентов с болезнью Паркинсона. Если имеется настоятельная необходимость лечения нейрелептиками пациентов с болезнью Паркинсона, принимающих агонисты дофаминовых рецепторов, следует провести постепенное снижение доз последних до полной отмены (резкая отмена агонистов дофаминовых рецепторов может повысить риск развития у пациента злокачественного нейрелептического синдрома) (см. подраздел «С осторожностью», и раздел 4.5.).

Гематологические нарушения

При применении антипсихотических препаратов, включая Тиаприд, наблюдались лейкопения, нейтропения и агранулоцитоз. Необъяснимые инфекции или лихорадка могут быть признаками гематологических нарушений (см. раздел 4.8.) и потребовать немедленного гематологического обследования.

Почечная недостаточность

При почечной недостаточности следует уменьшить дозу препарата Тиаприд (из-за возможного риска развития комы вследствие нарушения выведения тиаприда).

Этанол

Во время лечения препаратом Тиаприд нельзя принимать спиртные напитки и лекарственные препараты, содержащие этанол (см. раздел 4.5.).

Вспомогательные вещества

Препарат Тиаприд содержит лактозы моногидрат, что следует принимать во внимание у пациентов с редкой врожденной непереносимостью галактозы, глюкозо-галактозной мальабсорбцией, дефицитом лактазы (см. раздел 4.3.).

Дети

Применение тиаприда у детей изучено недостаточно. Поэтому при назначении тиаприда детям следует соблюдать осторожность. В связи с отсутствием клинических данных рекомендуется соблюдать осторожность при назначении этого лекарственного препарата

детям. Более того, рекомендуется ежегодно проверять у детей способности к обучению, так как препарат может влиять на когнитивные функции.

Необходимо регулярно корректировать дозу в зависимости от клинического состояния ребенка.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Противопоказанные комбинации

С леводопой

Взаимный антагонизм леводопы и нейролептиков.

С каберголином, хинаголидом

Взаимный антагонизм между этими дофаминергическими препаратами и нейролептиками.

Нерекомендованные комбинации

С препаратами, которые способны вызывать желудочковую тахикардию типа «пируэт» или удлинять интервал QT:

- препараты, вызывающие брадикардию, такие как бета-адреноблокаторы; урежающие число сердечных сокращений блокаторы «медленных» кальциевых каналов (верапамил, дилтиазем); клонидин, гуанфацин; сердечные гликозиды;
- препараты, вызывающие гипокалиемию, такие как калийвыводящие диуретики; слабительные, стимулирующие перистальтику кишечника;
- амфотерицин В при внутривенном применении, глюкокортикостероиды, тетракозактид (перед приемом тиаприда гипокалиемия должна быть скорректирована);
- антиаритмические средства IA класса, такие как хинидин, дизопирамид;
- антиаритмические средства III класса, такие как амиодарон, соталол, дофетилид, ибутилид;
- другие препараты, такие как пимозид, сультоприд, сульпирид, галоперидол, тиоридазин, метадон, амисульприд, дроперидол, хлорпромазин, левомепромазин, циаемемазин, пипотиазин, сертиндол, вералиприд; антидепрессанты, производные имипрамина; препараты лития; бепридил; цизаприд, дифеманила метилсульфат, вводимый внутривенно эритромицин, вводимый внутривенно спирамицин, мизоластин, вводимый внутривенно винкамин, галофантрин, лумефантрин, пентамидин, спарфлоксацин, моксифлоксацин;
- селективные ингибиторы обратного захвата серотонина (циталопрам, эсциталопрам).

Если у пациентов нельзя избежать одновременного назначения этих препаратов с тиапридом, то следует проводить тщательное клиническое лабораторное (контроль электролитного состава крови) и электрокардиографическое наблюдение.

С дофаминергическими противопаркинсоническими препаратами (амантадин, апоморфин, бромокриптин, энтакапон, лисурид, перголид, пирибедил, прамипексол, ропинирол, селегилин)

Взаимный антагонизм дофаминергических противопаркинсонических препаратов и нейролептиков. Агонисты дофаминовых рецепторов могут вызвать или усилить психотическую симптоматику (см. подраздел «Особые указания», раздел 4.4.).

С этанолом

Этанол усиливает седативное действие нейролептиков. Поэтому во время лечения тиапридом нельзя употреблять спиртные напитки и лекарственные препараты, содержащие этанол.

Комбинации, требующие соблюдения осторожности

С ингибиторами холинэстеразы (донепезилом, ривастигмином, галантамином, пиридостигмина бромидом, неостигмина бромидом)

Из-за способности этих препаратов вызывать брадикардию повышается риск развития желудочковых нарушений ритма.

Комбинации, которые следует принимать во внимание

С гипотензивными препаратами (всеми)

Аддитивное гипотензивное действие, увеличение риска ортостатической гипотензии.

С нитратами

Увеличение риска снижения артериального давления и, в частности, развития ортостатической гипотензии.

С препаратами, угнетающими функцию ЦНС: производные морфина (анальгетики, противокашлевые препараты); барбитураты; бензодиазепины и другие анксиолитики; снотворные препараты; антидепрессанты с седативным действием (амитриптилин, доксепин, миансерин, мirtазапин, тримипрамин); блокаторы H1-гистаминовых рецепторов с седативным действием; гипотензивные средства центрального действия (для клонидина и гуанфацина см. также «Нерекомендованные комбинации»); баклофен; талидомид и пизотифен.

Возможно кумулятивное угнетение центральной нервной системы и снижение реакции.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

Имеются очень ограниченные данные по применению тиаприда у беременных женщин. Тиаприд проходит через плаценту. Применение препарата не рекомендуется при беременности и у женщин репродуктивного возраста, не использующих эффективных способов контрацепции.

Новорожденные, которые во время третьего триместра беременности подвергались внутриутробному воздействию антипсихотических препаратов, включая препарат Тиаприд, имеют риск развития у них после рождения нежелательных реакций, включая экстрапирамидный синдром или синдром «отмены», которые могут варьировать по тяжести и продолжительности (см. раздел 4.8.). Сообщалось о развитии психомоторного возбуждения, мышечного гипертонуса, мышечной гипотонии, тремора, сонливости, респираторного дистресс-синдрома или затруднений при кормлении. Поэтому такие новорожденные должны находиться под регулярным медицинским наблюдением.

Кроме этого, у таких новорожденных теоретически возможно развитие вздутия живота и задержки отхождения мекония, тахикардии, гипервозбудимости, особенно, при одновременном приеме матерью во время беременности м-холиноблокирующих противопаркинсонических препаратов.

Лактация

Исследования на животных показали, что тиаприд проникает в грудное молоко, однако, проникает ли тиаприд в грудное молоко человека, неизвестно. Поэтому во время приема препарата Тиаприд грудное вскармливание не рекомендуется.

Фертильность

У животных отмечалось снижение фертильности, связанное с фармакологическими эффектами тиаприда (эффект, опосредованный пролактином).

Данные доклинических исследований

В исследованиях на животных (грызуны) тиаприд не продемонстрировал прямого или косвенного тератогенного, или эмбриотоксического действия. Исследования на кроликах продемонстрировали эмбриотоксические эффекты тиаприда в самых высоких дозах (80 и 160 мг/кг массы тела/сутки)

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

Даже при применении в рекомендованных дозах тиаприд может оказывать седативное действие, что приводит к нарушению способности управлять транспортными средствами и

заниматься потенциально опасными видами деятельности. Поэтому необходимо воздержаться от занятий этими видами деятельности во время приема препарата Тиаприд.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме нежелательных реакций

Частота возникновения нежелательных реакций (НР) была представлена в соответствии со следующими градациями, рекомендованными Всемирной Организацией Здравоохранения: очень часто ($\geq 10\%$); часто ($\geq 1\%$, $< 10\%$); нечасто ($\geq 0,1\%$, $< 1\%$); редко ($\geq 0,01\%$, $< 0,1\%$); очень редко, включая отдельные сообщения ($< 0,01\%$); частота неизвестна (по имеющимся данным частоту определить нельзя).

НР, наблюдавшиеся во время контролируемых клинических исследований

Следует отметить, что в некоторых случаях имелись трудности при дифференцировании НР и симптомов основного заболевания.

Эндокринные нарушения

Нечасто:

- тиаприд вызывает увеличение концентрации пролактина в плазме крови, являющееся обратимым после отмены препарата. Гиперпролактинемия может приводить к развитию галактореи, аменореи, гинекомастии, увеличению молочных (грудных) желез, появлению болей в молочных (грудных) железах, оргазмической дисфункции (нарушению оргазма) и импотенции.

Психические нарушения

Часто:

- сонливость/дремотное состояние/вялость, бессонница, агитация, состояние апатии (безразличия).

Нарушения со стороны нервной системы

Часто:

- головокружение/вертиго, головная боль;
- паркинсонизм и связанные с ним симптомы: тремор, мышечный гипертонус, гипокинезия и гиперсаливация. Эти симптомы обычно подвергаются обратному развитию при одновременном приеме м-холиноблокирующих противопаркинсонических средств.

Нечасто:

- акатизия, мышечная дистония (спазм, кривошея, окулогирный криз, тризм). Эти симптомы обычно подвергаются обратному развитию при одновременном приеме м-холино-

блокирующих противопаркинсонических средств.

Редко:

- острая дискинезия, обычно подвергающаяся обратному развитию при одновременном приеме м-холиноблокирующих противопаркинсонических средств.

Общие нарушения и реакции в месте введения

Часто:

- астения/повышенная утомляемость.

Нечасто:

- увеличение массы тела.

Постмаркетинговые данные

В дополнение к вышеперечисленным НР очень редко, и только из спонтанных сообщений, поступали сведения о перечисленных ниже НР.

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы

Частота неизвестна:

- лейкопения, нейтропения, агранулоцитоз (см. подраздел «Особые указания», раздел 4.4.).

Нарушения со стороны иммунной системы

Частота неизвестна:

- кожные аллергические реакции.

Нарушения метаболизма и питания

Частота неизвестна:

- гипонатриемия, синдром неадекватной секреции антидиуретического гормона.

Психические нарушения

Частота неизвестна:

- спутанность сознания;
- галлюцинации.

Нарушения со стороны нервной системы

Частота неизвестна:

- поздняя дискинезия, характеризующаяся стереотипными непроизвольными движениями, главным образом, языка и/или мимических мышц (как и при применении всех других нейрорепаративов, особенно, после их приема в течение более 3-х месяцев).

Противопаркинсонические препараты при данном состоянии неэффективны или могут привести к усилению симптомов.

- злокачественный нейролептический синдром (см. раздел 4.4, подраздел «Особые указания»), который является потенциально летальным осложнением, и возникновение которого возможно при применении любых нейролептиков;
- потеря сознания, обморок;
- судороги.

Нарушения со стороны сердца

Частота неизвестна:

- удлинение интервала QT, желудочковые нарушения ритма, такие как желудочковая тахикардия типа «пируэт», желудочковая тахикардия, способные переходить в фибрилляцию желудочков и приводить к остановке сердца и развитию внезапной смерти (см. раздел 4.4., подраздел «Особые указания»).

Нарушения со стороны сосудов

Частота неизвестна:

- венозные тромбоэмболические осложнения, включая тромбоэмболию легочной артерии, иногда со смертельным исходом, и тромбоз глубоких вен (см. раздел 4.4., подраздел «Особые указания»);
- снижение артериального давления, обычно в форме ортостатической гипотензии.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения

Частота неизвестна:

- аспирационная пневмония.

Желудочно-кишечные нарушения

Частота неизвестна:

- запор;
- кишечная непроходимость, илеус.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей

Частота неизвестна:

- повышение активности «печеночных» ферментов.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей

Частота неизвестна:

- кожная сыпь, включая эритематозную сыпь, макулопапулезную сыпь и крапивницу.

Нарушения со стороны скелетно-мышечной и соединительной ткани

Частота неизвестна:

- рабдомиолиз, повышение активности креатинфосфокиназы в сыворотке крови.

Беременность, послеродовой период и перинатальные состояния

Частота неизвестна:

- синдром «отмены» у новорожденных (см. раздел 4.6.).

Травмы, интоксикации и осложнения процедур

Частота неизвестна:

- падения, особенно у пожилых пациентов.

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации лекарственного препарата с целью обеспечения непосредственного мониторинга соотношения «польза/риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств - членов Евразийского экономического союза.

Российская Федерация

Адрес: 109012, Москва, Славянская площадь, д. 4, стр. 1

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения Российской Федерации

Телефон: +78005509903

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт: www.roszdravnadzor.gov.ru

4.9 Передозировка

Симптомы

Избыточная седация, сонливость, угнетение сознания вплоть до комы, артериальная гипотензия, экстрапирамидная симптоматика.

Лечение

Отмена препарата, симптоматическая и дезинтоксикационная терапия, мониторинг жизненно важных функций организма (особенно сердечной деятельности (риск удлинения интервала QT и развития желудочковых нарушений ритма) до полного исчезновения симптомов интоксикации. При появлении тяжелых экстрапирамидных симптомов - применение антихолинергических средств.

Поскольку тиаприд слабо подвергается диализу, для его удаления из организма не рекомендуется применять гемодиализ (см. раздел 5.2.). Специфического антидота тиаприда нет.

Имелись сообщения о смертельных исходах при передозировке главным образом, при комбинации тиаприда с другими психотропными средствами.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: психолептики; антипсихотические средства; бензамиды
Код АТХ: N05AL03

Механизм действия и фармакодинамические эффекты

Антипсихотическое средство - атипичный нейролептик, *in vitro* селективно блокирующий подтипы D2 и D3 дофаминовых рецепторов без наличия какой-либо значимой аффинности к рецепторам основных центральных нейротрансмиттеров (включая серотонин, норадреналин, гистамин). Исследования нейрхимических и поведенческих реакций, проведенные *in vivo*, подтвердили эти свойства тиаприда, показав наличие антидофаминергических эффектов при отсутствии значимых седации, катаlepsии и снижения когнитивных способностей.

Тиаприд способен воздействовать на дофаминовые рецепторы, предварительно уже сенситизированные к дофамину при применении каких-либо других антипсихотических средств, и с этим связывают его антидискинетические эффекты.

В некоторых экспериментальных моделях стресса на животных, включая алкогольную абстиненцию у мышей и приматов, была подтверждена анксиолитическая активность тиаприда.

Тиаприд не показал формирования физической или психологической зависимости.

Этим атипичным фармакодинамическим профилем объясняется клиническая эффективность тиаприда при многих расстройствах, включая гипердофаминергические состояния, такие как дискинезии и поведенческие нарушения, наблюдающиеся у пациентов с деменцией или у лиц, злоупотребляющих алкоголем, с меньшим количеством неврологических побочных эффектов по сравнению с типичными нейролептиками. Тиаприд обладает выраженным анальгезирующим (как при интероцептивной, так и при экстероцептивной боли), противорвотным за счет блокады дофаминовых D2-рецепторов триггерной зоны рвотного центра, гипотермическим действием за счет блокады дофаминовых рецепторов гипоталамуса.

5.2 Фармакокинетические свойства

Абсорбция

Абсорбция тиаприда быстрая. После приема внутрь 200 мг тиаприда максимальная концентрация препарата в плазме достигается за 1 час и составляет 1,3 мкг/мл. Биодоступность составляет 75 %. При приеме таблеток непосредственно перед приемом пищи биодоступность увеличивается на 20 %, а максимальная концентрация в плазме - на 40 %. Абсорбция в пожилом возрасте замедляется.

Распределение

Распределение в организме происходит быстро (менее 1 часа). Проникает через гематоэнцефалический барьер и через плаценту без накопления. Объем распределения составляет 1,43 л/кг. У животных отмечали проникновение препарата в грудное молоко, с соотношением концентраций в молоке и в крови, составляющим 1,2.

Не связывается с белками плазмы, очень слабо связывается с эритроцитами.

Биотрансформация

Тиаприд метаболизируется незначительно (до 15 %), метаболиты в основном неактивные. Не обнаружено конъюгированных метаболитов. 70 % введенной дозы обнаруживается в моче в неизменном виде.

Элиминация

Период полувыведения из плазмы составляет 2,9 часа у женщин и 3,6 часа у мужчин. Выведение происходит преимущественно почками путем гломерулярной фильтрации и канальцевой секреции, почечный клиренс составляет 330 мл/минуту.

Особые группы пациентов

Пациенты с нарушением функции почек

У больных с нарушенной функцией почек, выведение зависит от клиренса креатинина, при снижении которого выведение тиаприда замедляется (см. «Способ применения и дозы») (см. раздел 4.2.).

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ:

лактозы моногидрат

крахмал картофельный

повидон К-17

магния стеарат

6.2. Несовместимость

Не применимо.

6.3. Срок годности

5 лет

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Хранить в защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

По 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой.

2 или 3 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по медицинскому применению (листочком-вкладышем) помещают в пачку из картона.

6.6. Особые меры предосторожности при уничтожении использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата, и другие манипуляции с препаратом

Особые требования отсутствуют.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация

Акционерное общество «Органика» (АО «Органика»)

654034, Кемеровская область - Кузбасс, г.о. Новокузнецкий, г. Новокузнецк, район

Кузнецкий, шоссе Кузнецкое, д. 3

тел. (3843) 994-222

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

Акционерное общество «Органика» (АО «Органика»)

654034, Кемеровская область - Кузбасс, г.о. Новокузнецкий, г. Новокузнецк, район

Кузнецкий, шоссе Кузнецкое, д. 3

тел. (3843) 994-222

root@organica.su

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ:

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

Дата первичной регистрации:

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 17.06.2024 № 11956
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0002)

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата Тиаприд доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-коммуникационной сети «Интернет» <http://www.eec.eaeunion.org/>.