

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**

Тиаприд, 50 мг/мл, раствор для внутривенного и внутримышечного введения.

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: тиаприда гидрохлорид

Каждый мл раствора содержит 55,5 мг тиаприда гидрохлорид (в пересчете на тиаприда основание – 50,0 мг).

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: натрий (см. раздел 4.4.).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Раствор для внутривенного и внутримышечного введения.

Прозрачная бесцветная или слегка окрашенная жидкость.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ**4.1. Показания к применению**

Препарат Тиаприд показан к применению взрослым в возрасте от 18 лет.

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

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

4.2. Режим дозирования и способ примененияРежим дозирования*Взрослые*

Необходимо всегда подбирать минимальную эффективную дозу. Если позволяет состояние пациента, лечение следует начинать с низкой дозы, затем постепенно повышая ее.

Ажитация и агрессивные состояния у пожилых пациентов и у пациентов с алкогольной зависимостью

Обычная доза составляет 200 - 300 мг в сутки.

Инъекции следует проводить каждые 4 - 6 часов.

Максимальная суточная доза - 1200 мг.

В особых случаях при делирии или предделириозном состоянии: 400 - 1200 мг в сутки (максимально до 1800 мг в сутки).

Особые группы пациентов

Пациенты пожилого возраста

Препарат назначают в дозе 200 - 300 мг в сутки, суточная доза делится на 2 - 3 введения.

Максимальная разовая доза - 100 мг, максимальная суточная доза – 300 мг.

Продолжительность лечения – не более 4 недель.

Пациенты с нарушениями функции почек

У пациентов с нарушениями функции почек выведение 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 уменьшать в 2 раза, при клиренсе креатинина менее 10 мл/мин дозу следует уменьшать в 4 раза, по сравнению с дозами при нормальной функции почек.

Пациенты с нарушениями функции печени

Препарат незначительно метаболизируется в организме, однако при нарушениях функции печени препарат следует применять с осторожностью.

Дети

Препарат в данной лекарственной форме противопоказан у детей в возрасте до 18 лет (см. раздел 4.3.).

Способ применения

Парентеральное введение препарата используется только при невозможности перорального применения препарата.

Препарат может вводиться внутримышечно или внутривенно, однако предпочтительным является внутримышечный путь введения, так как при внутримышечном введении наблюдается меньше нежелательных реакций, чем при внутривенном введении.

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 и подростковый возраст (для этой лекарственной формы);

- период грудного вскармливания (см. раздел 4.6.);
- одновременный прием леводопы (см. раздел 4.5.);
- одновременный прием каберголина, хинаголида (см. раздел 4.5.);

Не рекомендуется применение препарата при болезни Паркинсона (кроме случаев настоящей необходимости применения тиаприда, см. разделы 4.4. и 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, лизурид, перголид, пирибедил, ропинирол, селегилин), если есть настоятельная необходимость в применении тиаприда (см. подраздел (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»).
- 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. разделы 4.3. и 4.8.). Пациентам с вышеперечисленными факторами риска,

предрасполагающими к удлинению интервала QT, при необходимости назначения тиаприда, необходимо соблюдать особую осторожность.

Гипокалиемия и гипомagnesия должны быть скорректированы до начала применения препарата, кроме того, следует обеспечить медицинское наблюдение, контроль электролитов крови и ЭКГ.

Прием алкоголя (этанола) может нарушать электролитный баланс и, как следствие, вызывать удлинение интервал QT.

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 троекратное 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. 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 нейролептиками 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 нейролептического синдрома) (см. разделы «С осторожностью», «Взаимодействие с другими лекарственными средствами»).

Гематологические нарушения

При применении антипсихотических препаратов, включая Тиаприд, наблюдались лейкопения, нейтропения и агранулоцитоз. Необъяснимые инфекции или лихорадка могут быть признаками гематологических нарушений (см. раздел «Побочное действие») 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 «Взаимодействие с другими лекарственными средствами»).

Вспомогательные вещества

Препарат содержит менее 1 ммоль (23 мг) натрия в разовой дозе, то есть, по сути, не содержит натрия.

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, циаемеазин, 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, ривастигнином, галантамином, пиридоистигмина 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

Исследования, проведенные на животных, не выявили прямого или непрямого негативного влияния на беременность, эмбриональное/фетальное развитие, роды или постнатальное развитие. Имеется ограниченное количество данных по применению тиаприда при беременности. 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 противопоказано.

Фертильность

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

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

Нежелательные реакции приведены в соответствие с системно-органной классификацией и распределением по частоте возникновения. В каждой частотной группе побочные действия представлены в порядке уменьшения их серьезности.

Частота побочных эффектов определена следующим образом:

очень часто: $\geq 1/10$; часто: $\geq 1/100$, $< 1/10$; нечасто: $\geq 1/1000$, $< 1/100$; редко: $\geq 1/10\ 000$, $< 1/1000$; очень редко: $< 1/10\ 000$; частота неизвестна (не может быть определена на основании имеющихся данных).

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

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы

Редко:

- лейкопения, нейтропения, агранулоцитоз (см. раздел 4.4.).

Эндокринные нарушения

Часто:

- гиперпролактинемия, которая может приводить к развитию аменореи, галактореи, гинекомастии, увеличению молочных желез, появлению болей в молочных железах, оргазмической дисфункции (нарушению оргазма) и эректильной дисфункции. Эти симптомы обратимы после отмены препарата.

Нарушения метаболизма и питания

Редко:

- гипонатриемия, синдром неадекватной секреции антидиуретического гормона.

Психические нарушения

Часто:

- сомноленция/дремота, сонливость, бессонница, ажитация, индифферентность (безразличие);

Нечасто:

- спутанность сознания, галлюцинации.

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-холиноблокирующих противопаркинсонических средств;
- судороги, обморок;

Редко:

- острая дискинезия, обычно подвергающаяся обратному развитию при одновременном приеме м-холиноблокирующих противопаркинсонических средств;
- поздняя дискинезия, характеризующаяся стереотипными непроизвольными движениями, главным образом, языка и/или мышц лица (как и при применении всех других нейролептиков, особенно, после их применения в течении более 3-х месяцев). Противопаркинсонические препараты в данном состоянии не эффективны или могут привести к усилению симптомов;
- злокачественный нейролептический синдром, который является потенциально летальным осложнением, и возникновение которого возможно при применении любых нейролептиков (см. раздел 4.4);
- потеря сознания.

Нарушения со стороны сердца

Редко:

- 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.).

Нарушения со стороны сосудов

Нечасто:

- снижение артериального давления, обычно в форме ортостатической гипотензии, тромбоз глубоких вен;

Редко:

- тромбоэмболия легочной артерии, иногда со смертельным исходом (см. раздел 4.4.).

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения

Редко:

- аспирационная пневмония, угнетение дыхания (при применении с другими средствами, угнетающими центральную нервную систему (ЦНС)).

Желудочно-кишечные нарушения

Нечасто:

- запор;

Редко:

- кишечная непроходимость, илеус.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей

Редко:

- повышение активности «печеночных» ферментов.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей

Нечасто:

- кожная сыпь, включая эритематозную сыпь, макулопапулезную сыпь;

Редко:

- крапивница.

Нарушения со стороны мышечной, скелетной и соединительной ткани

Редко:

- рабдомиолиз, повышение активности креатинфосфокиназы в сыворотке крови.

Беременность, послеродовой период и перинатальные состояния

Частота неизвестна:

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

Нарушения со стороны репродуктивной системы и молочных желез

Нечасто:

- аменорея, оргазмическая дисфункция;

Редко:

- увеличение молочных желез, боль в молочных железах, галакторея, гинекомастия, эректильная дисфункция.

Общие нарушения и реакции в месте введения

Часто:

- астения/повышенная утомляемость;

Нечасто:

- увеличение массы тела.

Травмы, интоксикации и осложнения манипуляций

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: 109074, 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 «Фармакокинетика»). Специфического антитоксика 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 нейрохимических и поведенческих реакций, проведенные *in vivo*, подтвердили эти свойства тиаприда, показав наличие антидофаминергических эффектов при отсутствии значимых седации, каталепсии и снижения когнитивных способностей.

Тиаприд способен воздействовать на дофаминовые рецепторы, предварительно уже сенсибилизированные 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 психической 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

После внутримышечной инъекции препарата в дозе 200 мг максимальная концентрация тиаприда в плазме составляет 2,5 мкг/мл и достигается за 30 минут.

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 1,2:1.

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

Биотрансформация

Тиаприд метаболизируется незначительно (до 15 %), метаболиты в основном неактивные. Не обнаружено конъюгированных метаболитов.

Элиминация

70 % введенной дозы обнаруживается в моче в неизменном виде. 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. У больных с нарушенной функцией почек, выведение зависит от клиренса креатинина, при снижении которого выведение тиаприда замедляется (см. «Способ применения и дозы»).

Тиаприд слабо удаляется из крови с помощью гемодиализа (11 ± 7 мг) в течении 4 часов после внутримышечного введения в дозе 100 мг.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ:

Натрия хлорид;

Вода для инъекций.

6.2. Несовместимость

Не применимо.

6.3. Срок годности

5 года.

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 2 мл в стеклянные ампулы.

По 5 ампул в контурной ячейковой упаковке. 1 или 2 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по применению (листком-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:

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 28.06.2024 № 13036

(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0002)

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