

ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА
ТИЗЕРЦИН®

Регистрационный номер: _____

Торговое наименование: Тизерцин®

Международное непатентованное или группировочное наименование: левомепромазин

Лекарственная форма: таблетки покрытые оболочкой

Состав:

действующее вещество: левомепромазина малеат 33,8 мг (эквивалентный 25,00 мг левомепромазина), вспомогательные вещества: магния стеарат 1 мг, натрия крахмала гликолят 2 мг, повидон К-25 8 мг, целлюлоза микрокристаллическая 10 мг, крахмал картофельный 15,2 мг, лактоза 40 мг, оболочка [титана диоксид 0,758 мг, гипромеллоза 2,632 мг, диметикон 0,355 мг, магния стеарат 0,255 мг].

Описание: Круглые, слегка двояковыпуклые таблетки покрытые оболочкой, белого цвета, без запаха.

Фармакотерапевтическая группа: антипсихотическое средство (нейролептик)

Код АТХ: N05AA02

Фармакологические свойства

Фармакодинамика:

Антипсихотическое средство (нейролептик) фенотиазинового ряда. Оказывает антипсихотическое, седативное (снотворное), анальгезирующее, умеренное противорвотное, гипотермическое, умеренное антигистаминное и М-холиноблокирующее действие. Вызывает снижение артериального давления (АД).

Антипсихотическое действие обусловлено блокадой дофаминовых D2-рецепторов мезолимбической и мезокортикальной системы.

Седативное действие обусловлено блокадой адренорецепторов ретикулярной формации ствола головного мозга; противорвотное действие - блокадой дофаминовых D2-рецепторов триггерной зоны рвотного центра; гипотермическое действие - блокадой дофаминовых рецепторов гипоталамуса.

Экстрапирамидные побочные эффекты у левомепромазина менее выражены, чем у «классических» нейролептиков. Левомепромазин повышает болевой порог. Благодаря способности усиливать эффекты анальгетиков, этот препарат можно использовать для вспомогательной терапии при остром и хроническом болевом синдроме.

Фармакокинетика:

Максимальная концентрация препарата в плазме крови достигается через 1-3 часа после приема внутрь. Проходит через гистогематические барьеры, включая гематоэнцефалический барьер, распределяется в органах и тканях.

Левомепромазин быстро метаболизируется в печени путем деметилирования с образованием сульфатных и глюкуронидных конъюгатов, которые выводятся с мочой. Метаболит, образующийся в результате деметилирования (N-дезметиломоно-метотримепразин), обладает фармакологической активностью, остальные метаболиты неактивны. Небольшая

часть введенной дозы (1%) выводится в неизменном виде с мочой и калом. Период полу-выведения – 15-30 часов.

Показания

Психомоторное возбуждение различной этиологии:

- при шизофрении (острой и хронической)
- при биполярных расстройствах
- при сенильных, интоксикационных и прочих психозах
- при олигофрении
- при эпилепсии

а также другие психические расстройства, протекающие с:

- ажитацией
- тревогой
- паникой
- фобиями
- стойкой бессонницей

Усиление действия анальгетиков, средств для общей анестезии, антигистаминных препаратов.

Болевой синдром (невралгия тройничного нерва, неврит лицевого нерва, опоясывающий лишай).

Противопоказания

- одновременный прием антигипертензивных средств,
- повышенная чувствительность к фенотиазинам,
- передозировка препаратов, вызывающих торможение ЦНС (алкоголь, общие анестетики, снотворные),
- закрытоугольная глаукома,
- задержка мочи,
- болезнь Паркинсона,
- рассеянный склероз,
- миастения, гемиплегия,
- хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации,
- выраженная почечная/печеночная недостаточность,
- выраженная артериальная гипотензия,
- угнетение костномозгового кроветворения (гранулоцитопения),
- порфирия,
- кормление грудью,
- детский возраст до 12 лет,
- дефицит лактазы, непереносимость лактозы (галактозы), глюкозо-галактозная мальабсорбция.

С осторожностью

Эпилепсия, пациенты с сердечно-сосудистыми заболеваниями в анамнезе, особенно в пожилом возрасте (нарушения проводимости сердечной мышцы, аритмии, синдром врожденного удлинения интервала QT).

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Беременность

Препарат не следует применять во время беременности, за исключением случаев, когда проведено тщательное сопоставление риска для плода и пользы для матери.

Кормление грудью

Левомепромазин проникает в грудное молоко. В связи с этим, а также при отсутствии контролируемых исследований, его применение при грудном вскармливании противопоказано. При необходимости принимать препарат в период лактации следует решить вопрос о прекращении кормления грудью.

Способ применения и дозы

Внутрь, начиная с суточной дозы 25-50 мг на несколько приёмов (максимальная часть суточной дозы должна назначаться перед сном), ежедневно увеличивая её на 25-50 мг до улучшения состояния больного. У резистентных к другим нейролептикам больных суточную дозу можно наращивать быстрее, прибавляя по 50-75 мг в сутки. Средние суточные дозы составляют 200-300 мг.

После улучшения состояния пациента дозу следует снизить до поддерживающей, величина которой определяется индивидуально.

В амбулаторной практике больным с невротическими расстройствами назначают в суточной дозе 12,5-50 мг (1/2-2 таблетки).

Больным с психозами, при выраженном психомоторном возбуждении, целесообразно начинать терапию левомепромазином с парентерального введения.

Для предупреждения развития ортостатического коллапса во время лечения требуется соблюдение постельного режима.

Побочное действие

Сердечно-сосудистая система: самый частый побочный эффект – снижение АД и ортостатическая гипотензия. Также возможны тахикардия, синдром Морганьи-Адамса-Стокса, удлинение интервала QT (аритмогенный эффект, тахикардия типа «пируэт») (см. также раздел "Противопоказания").

Кроветворная система: панцитопения, агранулоцитоз, лейкопения, эозинофилия, тромбоцитопения.

Центральная нервная система: спутанность сознания, невнятность речи, экстрапирамидные симптомы с преобладанием акинето-гипотонического синдрома, эпилептические припадки, повышение внутричерепного давления, нейролептический злокачественный синдром (НЗС).

Эндокринная система и метаболизм: галакторея, нарушения менструального цикла, похудание. У некоторых пациентов, длительно получающих фенотиазины, описано развитие аденомы гипофиза, однако для установления ее причинной связи с данными препаратами необходимы дополнительные исследования.

Мочеполовая система: обесцвечивание мочи, нарушения мочеиспускания.

Желудочно-кишечный тракт: сухость во рту, неприятные ощущения в животе, тошнота, рвота, запор, поражение печени (желтуха, холестаз).

Кожные реакции: фотосенсибилизация, эритема, пигментация.

Зрение: при длительном применении отложения в хрусталике и роговице, пигментная ретинопатия.

Аллергические реакции: отек гортани, периферические отеки, анафилактикоидные реакции, бронхоспазм, крапивница, эксфолиативный дерматит.

Другие: гипертермия (может быть первым признаком НЗС), боль и отек в местах инъекций.

Передозировка:

Симптомы: Артериальная гипотензия, нарушения проводимости в сердечной мышце (удлинение интервала QT, желудочковая тахикардия типа «пируэт», предсердно-желудочковая блокада), угнетение сознания различной степени выраженности (вплоть до комы), экстрапирамидные симптомы, седативный эффект, эпилептические припадки.

Лечение: реанимационные мероприятия, симптоматическая терапия. Специфический антитокс не известен. Форсированный диурез, гемодиализ и гемоперфузия не эффективны.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

- Следует избегать одновременного приема следующих средств:
- *Антигипертензивных* из-за риска выраженного снижения АД.
- *Ингибиторов моноаминоксидазы МАО*, т.к. возможно увеличение продолжительности эффекта препарата Тизерцин® и тяжести его побочных эффектов.
- Следует соблюдать осторожность при комбинации со следующими средствами:
- *Антихолинергические препараты* (трициклические антидепрессанты; блокаторы H₁-гистаминовых рецепторов; некоторые антипаркинсонические средства; атропин, скополамин, сукцинилхолин) из-за усиления антихолинергических эффектов (паралитическая кишечная непроходимость, задержка мочи, глаукома). При комбинации со скополамином наблюдались экстрапирамидные побочные эффекты.
- *Средства, угнетающие ЦНС* (наркотические анальгетики, средства общей анестезии, анксиолитики, седативные и снотворные, транквилизаторы, трициклические антидепрессанты) усиливают угнетающее действие препарата на ЦНС.
- *Средства, стимулирующие ЦНС* (например, производные амфетамина) - снижение психостимулирующего эффекта.
- *Леводопа*: ослабляется эффект этого препарата.
- *Пероральные противодиабетические препараты*: их эффективность снижается, что требует корректировки дозы.
- *Средства, удлиняющие интервал QT* (некоторые противоаритмические препараты, макролидные антибиотики, некоторые противогрибковые азолы, цизаприд, некоторые антидепрессанты, некоторые антигистаминные препараты, а также диуретики, снижающие уровень калия) - усиливают риск удлинения интервала QT и, следовательно, повышают риск аритмии.
- *Препараты, вызывающие фотосенсибилизацию*: этот эффект может усилиться.
- *Алкоголь*: усиливается торможение ЦНС и повышается вероятность возникновения экстрапирамидных побочных эффектов.
- *Антацидные средства*: снижают всасываемость в желудочно-кишечном тракте (лево-мепромазин следует назначать за 1 ч до или через 4 ч после приема антацидных средств).

Особые указания

- Применение препарата следует прекратить в случае возникновения аллергических реакции.
- При беременности препарат следует назначать после тщательного сопоставления риска и пользы (см. раздел "Применение при беременности и в период грудного вскармливания").

- Одновременное применение со средствами, угнетающими ЦНС, ингибиторами МАО и антихолинэргическими веществами требует особой осторожности (см. раздел "Взаимодействия с другими лекарственными средствами").
- Особая осторожность нужна при назначении препаратов пациентам с почечной и/или печеночной недостаточностью из-за риска кумуляции препарата.
- Пожилые пациенты имеют предрасположенность к ортостатической гипотензии, а также антихолинэргическим и седативным эффектам фенотиазинов. Кроме того, у них особенно часто возникают экстрапирамидные побочные эффекты. Поэтому низкие начальные дозы и постепенное их повышение особенно важны у этой категории больных.
- Во избежание развития ортостатической гипотензии пациент должен лежать в течение получаса после введения первой дозы. Если после введения препарата возникает головокружение, следует соблюдать постельный режим после введения каждой дозы.
- Если во время антипсихотической терапии возникнет гипертермия, следует обязательно исключить злокачественный нейролептический синдром (НЗС). НЗС - смертельно опасное заболевание, характеризующееся следующими симптомами: гипертермия, мышечная ригидность, спутанность сознания, нарушение функций вегетативной нервной системы (нестабильное АД, тахикардия, аритмия, усиленное потоотделение), повышение концентрации креатинфосфокиназы (КФК), миоглобинурия (рабдомиолиз) и острая почечная недостаточность. При их возникновении, а также если во время лечения возникнет гипертермия неясной этиологии без остальных клинических симптомов НЗС, введение препарата Тизерцин® следует немедленно прекратить.
- После внезапной отмены препарата, применяемого в высоких дозах или длительно, возможно появление: тошноты, рвоты, головной боли, тремора, повышенного потоотделения, тахикардии, бессонницы и беспокойства, а также развития толерантности к седативным эффектам фенотиазинов и перекрестная толерантность к различным антипсихотическим средствам. По этой причине отмену препарата следует всегда производить постепенно.
- Многие антипсихотические средства, в том числе левомепромазин, могут снижать порог судорожной готовности и вызывать эпилептиформные изменения ЭЭГ. Поэтому при подборе дозы препарата Тизерцин® у больных эпилепсией следует постоянно контролировать клинические показатели и ЭЭГ.
- Развитие холестатической желтухи зависит от индивидуальной чувствительности пациента и полностью исчезает после прекращения введения препарата. Поэтому при длительном лечении требуется регулярный контроль функции печени.
- При длительной терапии рекомендуется регулярный контроль формулы крови.
- Следует запретить употребление алкогольных напитков во время лечения и до исчезновения эффектов препарата (в течение 4-5 дней после прекращения введения препарата Тизерцин®).
- До начала и во время лечения рекомендуется регулярно контролировать следующие показатели:
 - артериальное давление,
 - функцию печени (особенно у пациентов с заболеваниями печени),
 - формулу крови,
 - ЭКГ (при сердечно-сосудистых заболеваниях и у пожилых пациентов).

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

В период лечения следует воздерживаться от вождения автомобиля и выполнения работы, связанной с повышенным риском несчастных случаев.

Форма выпуска

Таблетки покрытые оболочкой 25 мг. По 50 таблеток во флакон коричневого стекла с ПЭ крышкой, с контролем первого вскрытия и амортизатором-гармошкой. 1 флакон вместе с инструкцией по применению в картонную пачку.

Срок годности

5 лет. Не использовать препарат после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия хранения

Хранить при температуре 15-25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Держатель регистрационного удостоверения

ЗАО «Фармацевтический завод ЭГИС», Венгрия
1106 Будапешт, ул. Керестури, 30-38 ВЕНГРИЯ
Телефон: (36-1)803-5555,
Факс: (36-1)803-5529

Производитель

ЗАО «Фармацевтический завод ЭГИС», Венгрия
9900 Корменд, ул. Матяш кирай, 65 Венгрия (все стадии производства)

Претензии потребителей следует направлять по адресу:

ООО «ЭГИС-РУС», Россия 121108, г. Москва, ул. Ивана Франко, д. 8,
телефон: (495) 363-39-66

