



ИНСТРУКЦИЯ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ТИОПИРАМ

Торговое название препарата: Тиопирам

Действующие вещества (МНН): тиазотная кислота + пирацетам

Лекарственная форма: раствор для инъекций

Состав:

1 мл раствора содержит:

активные вещества: морфолиниевая соль тиазотной кислоты – 25 мг, пирацетам – 100 мг

вспомогательное вещество: вода для инъекций – до 1 мл

Описание: прозрачный, бесцветный или слегка желтоватого цвета раствор.

Фармакотерапевтическая группа: ноотроп

Код: АТХ: N06BX

Фармакологические свойства

Тиопирам относится к группе cerebroактивных средств, проявляет ноотропные, противоишемические, антиоксидантные и мембраностабилизирующие свойства. Фармакологический эффект препарата обусловлен взаимопотенцирующим действием тиазотной кислоты и пирацетама.

Тиопирам ускоряет утилизацию глюкозы в реакциях аэробного и анаэробного окисления, нормализует биоэнергетические процессы, стабилизирует метаболизм в тканях мозга и повышает стойкость организма к гипоксии.

Препарат тормозит пути образования активных форм кислорода, реактивирует ферментативную антиоксидантную систему, особенно супероксиддисмутазу, тормозит свободнорадикальные процессы в тканях мозга при ишемии, улучшает реологические свойства крови за счет активации фибринолитической системы, стабилизирует и уменьшает соответственно зоны некроза и ишемии.

Тиопирам повышает интенсивность работы метаболического ГАМК-шунта и концентрацию ГАМК в ишемизированных тканях.

Тиопирам улучшает интегративную и когнитивную деятельность мозга, способствует процессу обучения, устраняет амнезию, повышает показатели кратковременной и долговременной памяти. Тиопирам устраняет последствия стресса (чувство тревоги, фобии, депрессии, нарушение сна), уменьшает отставание в физическом и умственном развитии недоношенных детей.

Фармакокинетика

Не изучалась.

Показания к применению

Лечение ишемического инсульта и его последствий, таких как нарушение речи, психические и соматические расстройства, снижение активности, нарушение эмоциональной сферы; лечение (в восстановительном периоде) сосудистой, токсической и травматической энцефалопатии, устранение абстинентного синдрома при алкогольной интоксикации, диабетическая энцефалопатия.

Способ применения и дозы

При ишемическом инсульте и для лечения его последствий назначать по 20-30 мл препарата, предварительно разведенного в 100-150 мл 0,9% раствора натрия хлорида, и вводить внутривенно капельно 1 раз в сутки. Курс лечения составляет 2 недели.

Для лечения энцефалопатии и устранения абстинентного синдрома при алкогольной интоксикации назначать внутримышечно 5 мл препарата 1 раз в сутки в течение 10-15 суток.

При диабетической энцефалопатии по 5 мл внутримышечно 1 раз в сутки на протяжении 10 дней с дальнейшим назначением по 1 таблетке препарата Тиопирам (400 мг/100 мг) три раза в сутки на протяжении 45 дней за 30 мин до приёма пищи.

Побочные действия

При клиническом применении препарата Тиопирам раствор для инъекций, могут наблюдаться случаи побочных реакций:

со стороны центральной и периферической нервной системы: головная боль, общая слабость;

со стороны пищеварительного тракта: тошнота, рвота;

со стороны иммунной системы: аллергические реакции, включая высыпания, зуд, крапивницу, ангионевротический отек, анафилактический шок;

со стороны сердечно-сосудистой системы: снижение артериального давления;

со стороны вестибулярной системы: головокружение;

общие нарушения и нарушения в месте введения: гиперемия кожи и зуд в месте введения.

У больных-возможно развитие побочных реакций, обусловленных отдельными компонентами препарата:

-пирацетамом:

со стороны крови и лимфы: геморрагические нарушения;

со стороны иммунной системы: гиперчувствительность, анафилактоидные реакции;

психические расстройства: нервозность, депрессия, повышенная возбудимость, тревожность, спутанность сознания, галлюцинации;

со стороны нервной системы: гиперкинезия, сонливость, атаксия, нарушения равновесия, повышение частоты приступов эпилепсии, головная боль, бессонница, тремор;

со стороны органов слуха и лабиринта: головокружение;

со стороны пищеварительной системы: абдоминальная боль, боль в верхней части живота, диарея, тошнота, рвота;

со стороны кожи и подкожных тканей: ангионевротический отек, дерматиты, сыпь, крапивница, зуд;

со стороны репродуктивной системы: повышение сексуальной активности;

сосудистые нарушения: гипотензия, тромбоз, тромбофлебит;

общие нарушения и нарушения в месте введения: астения, боль в месте введения, лихорадка, увеличение массы тела обусловленных.

- тиазотной кислотой:

у пациентов, преимущественно пожилого возраста, в частности на фоне приема других препаратов, описаны случаи:

аллергические реакции: гиперемия кожи, лихорадка;

со стороны центральной и периферической нервной системы: головокружение, шум в ушах;

со стороны сердечно-сосудистой системы: тахикардия, повышение артериального давления;

со стороны желудочно-кишечного тракта: сухость во рту, вздутие живота;

со стороны дыхательной системы: одышка, приступы удушья.

Противопоказания

гиперчувствительность к пирацетаму или тиазотной кислоте;

- терминальная стадия почечной недостаточности;

- хорея Хантингтона;

- острое нарушение мозгового кровообращения по геморрагическому типу.

Лекарственные взаимодействия

Тиопирам нельзя назначать с препаратами, имеющими кислую рН.

За счет наличия в составе пирацетама возможны следующие виды взаимодействия:

Тиреоидные гормоны. При комбинации с тиреоидными гормонами возможна повышенная раздражительность, дезориентация и нарушение сна.

Аценокумарол. У больных с тяжелым течением рецидивирующего тромбоза применение пирацетама в высоких дозах (9,6 г/сутки) не влияло на дозировку аценокумарола для достижения значения протромбинового времени 2,5-3,5, но при его одновременном применении отмечалось значительное снижение уровня агрегации тромбоцитов, уровня фибриногена, факторов Виллебранда (коагуляционная активность (VIII: C); ко-фактор ристоцетин (VIII: vW:Rco) и протеин в плазме крови (VIII: vW Ag), вязкости крови и плазмы.

Фармакокинетические взаимодействия. Возможность изменения фармакодинамики пирацетама под воздействием других препаратов низкая, поскольку 90% препарата выводится в неизменном виде с мочой.

В опытах *in vitro* пирацетам не угнетает цитохром P450 изоформы CYP1A2, 2B6, 2C8, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1 и 4A9/11 в концентрации 142, 426, 1422 мкг/мл. При концентрации 1422 мкг/мл отмечено незначительное угнетение CYP2A6 (21%) и 3A4/5 (11%). Однако уровень К этих двух CYP-изомеров достаточный при превышении 1422 мкг/мл. Поэтому метаболическое взаимодействие с препаратами, которые подвергаются биотрансформации этими ферментами, маловероятно.

Противоэпилептические средства. Применение пирацетама в дозе 20 мг/сут в течение 4 недель и больше не меняло кривую уровня концентрации и максимальную концентрацию противоэпилептических препаратов в сыворотке крови (карбамазепин, фенитоин, фенобарбитал, натрия вальпроат) у больных эпилепсией.

Алкоголь. Совместный прием с алкоголем не влиял на уровень концентрации пирацетама в сыворотке крови, и концентрация алкоголя в сыворотке крови не изменялась при приеме 1,6 г пирацетама.

Особые указания

С осторожностью препарат следует назначать больным с хронической почечной недостаточностью.

С осторожностью следует применять препарат лицам пожилого возраста с сердечно-сосудистой патологией в связи с тем, что описанные выше побочные реакции у данной группы больных отмечаются чаще.

Аллергические реакции чаще встречаются у лиц, склонных к аллергии.

В связи с тем, что пирацетам снижает агрегацию тромбоцитов, необходимо с осторожностью назначать больным с нарушением гемостаза, состояниями, которые могут сопровождаться кровотечениями (язвы желудочно-кишечного тракта), при больших хирургических операциях (включая стоматологические вмешательства), больным с симптомами тяжелого кровотечения или больным, у которых есть в анамнезе геморрагический инсульт; пациентам, которые применяют антикоагулянты, тромбоцитарные антиагреганты, включая низкие дозы ацетилсалициловой кислоты. При длительной терапии у больных пожилого возраста рекомендуется регулярный контроль за показателями функции почек.

Дети.

Не применяют в педиатрической практике.

Применение в период беременности и лактации

Не следует применять.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или другими механизмами.

На данный момент таких сообщений нет. Однако следует соблюдать осторожность при

применении Тиопирама лицам, управляющим автотранспортом или работающим с опасными механизмами, учитывая возможные нежелательные реакции со стороны нервной системы.

Передозировка

Симптомы: усиление проявлений побочного действия препарата.

В таких случаях прекращают применение препарата и назначают симптоматическое лечение.

Форма выпуска

Раствор для инъекций в ампулах по 5 мл и 10 мл вместе с инструкцией по медицинскому применению.

Условия хранения

В защищенном от света месте, при температуре не выше 25°C.

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года.

Не использовать после истечения срока годности.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Производитель

ООО «RADIKS»,

Республика Узбекистан, 100054, г. Ташкент, ул. Лутфий, 50.

Тел: (+99871) 273-92-31, факс: (+99871) 273-80-58

Наименование и адрес организации принимающей претензии (предложения) по качеству лекарственных средств на территории Республики Узбекистан:

ООО «RADIKS»,

Республика Узбекистан, 100054, г. Ташкент, ул. Лутфий, 50

Тел: (+99871) 273-43-98, факс: (+99871) 273-80-58.

ТИББИЁТДА ҚЎЛЛАНИЛИШИГА ДОИР ЙЎРИҚНОМА ТИОПИРАМ

Препаратнинг савдо номи: Тиопирам

Таъсир этувчи моддалар (ХПН): тиазот кислотаси + пирацетам

Дори шакли: инъекция учун эритма.

Таркиби:

1 мл эритма қуйидагиларни сақлайди:

фаол моддалар: тиазот кислотасининг морфолинийли тузи – 25 мг, пирацетам – 100 мг

ёрдамчи модда: инъекция учун сув – 1 мл гача.

Таърифи: тиник, рангсиз ёки бироз сарғиш рангли эритма.

Фармакотерапевтик гуруҳи: ноотроп

АТХ коди: N06BX

Фармакологик хусусиятлари

Тиопирам цереброфаол воситалар гуруҳига мансуб, ноотроп, ишемияга қарши, антиоксидант ва мембранани барқарорлаштирувчи хусусиятларни намоён этади. Препаратнинг фармакологик самараси тиазот кислотасининг ва пирацетамнинг ўзаро потенциаловчи таъсири билан боғлиқ.

Тиопирам аэроб ва анаэроб оксидланиш реакцияларида глюкозани утилизациясини тезлаштиради, биоэнергетик жараёнларни нормаллаштиради, бош мия тўқималарида метаболизмини барқарорлаштиради ва организмнинг гипоксияга бўлган чидамлилигини оширади.

Препарат кислороднинг фаол шакллари хосил бўлиш йўллари тормозлайди, ферментатив антиоксидант тизимининг фаоллигини тиклайди, айниқса супероксиддисмутазани, ишемияда бош мия тўқималарида эркин радикал жараёнларни тормозлайди, қоннинг реологик хусусиятларини фибринолитик тизимини фаоллаштириш хисобига яхшилади ва мувофиқ некроз ва ишемия соҳаларини барқарорлаштиради ва камайтиради.

Тиопирам метаболит ГАМК - шунтини ишлаш жадаллигини ва ГАМК ни ишемияга учраган тўқималардаги концентрациясини оширади.

Тиопирам бош миянинг интегратив ва когнитив фаолиятини яхшилади, ўрганиш жараёнига ёрдам беради. амнезияни бартараф этади, қисқа муддатли ва узоқ муддатли хотиранинг кўрсаткичларини оширади. Тиопирам стресс оқибатларини (хавотирлик хисси, фобиялар, депрессиялар, уйқуни бузилиши) бартараф этади, чала туғилган болаларда жисмоний ва ақлий ривожланишини орқада қолишини камайтиради.

Фармакокинетикаси

Ўрганилмаган.

Қўлланилиши

Ишемик инсультни ва унинг нутқни бузилиши, рухий ва соматик бузилишлар, фаолликни пасайиши, эмоционал соҳани бузилиши каби оқибатларини даволаш; қон томир, токсик ва травматик энцефалопатияни (тикланиш даврида) даволаш, алкоғолли интоксикацияда абстинент синдромни бартараф этиш, диабетик энцефалопатияда қўлланади.

Қўллаш усули ва дозалари

Ишемик инсультда ва унинг оқибатларини даволаш учун олдиндан 0,9% ли натрий хлориди эритмасининг 100-150 мл да суюлтирилган 20-30 мл препарат буюрилади ва вена

ичига томчилаб суткада бир марта юборилади. Даволаш курси 2 хафтани ташкил этади. Энцефалопатияни даволаш ва алкоғолли интоксикацияда абсгинент синдромини бартараф этиш учун мушак ичига 5 мл препарат суткада бир марта 10-15 сутка давомида буюрилади.

Диабетик энцефалопатияда 5 мл дан мушак ичига суткада бир марта 10 кун давомида юборилади, кейинчалик Тиопирам препаратини 1 таблетка (400 мг/100 мг) дан суткада 3 марта 45 кун давомида овқат қабул қилишдан 30 минут олдин буюрилади.

Ножўя таъсирлари

Тиопирам инъекция учун эритма препарати клиник қўлланганида ножўя реакцияларнинг қуйидаги ҳоллари кузатилиши мумкин:

марказий ва периферик нерв тизими томонидан: бош оғриғи, умумий ҳолсизлик;

овқат ҳазм қилиш йўллари томонидан: кўнгил айланиш, қусиш;

иммун тизими томонидан: аллергия реакциялар, жумладан тошма, кичишиш, эшакеми, ангионевротик шиш, анафилактик шок;

юрак-қон томир тизими томонидан: артериал қон босимни пасайиши;

вестибуляр тизим томонидан: бош айланиши;

умумий бузилишлар ва юбориш жойидаги бузилишлар: тери гиперемияси ва юбориш жойида кичишиш.

Беморларда препаратнинг алоҳида компонентлари билан боғлиқ бўлган ножўя реакциялар ривожланиши мумкин:

-пирацетам билан боғлиқ:

қон ва лимфа томонидан: геморрагик бузилишлар;

иммун тизими томонидан: ўта юқори сезувчанлик, анафилактик реакциялар;

руҳий бузилишлар: асабийлик, депрессия, юқори кўзғалувчанлик, хавотрлик, онгни чалкашиши, галлюцинациялар;

нерв тизими томонидан: гиперкинезия, уйқучанлик, атаксия, мувозанатни бузилиши, тутқаноқ хуружлари сонини ошиши, бош оғриғи, уйқусизлик, тремор;

эшитиш аъзолари ва лабиринт томонидан: бош айланиши;

овқат ҳазм қилиш тизими томонидан: абдоминал оғрик, кориннинг юқори қисмида оғрик, диарея, кўнгил айланиш, қусиш;

тери ва тери ости тўқималари томонидан: ангионевротик шиш, дерматитлар, тошма, эшакеми, кичишиш;

репродуктив тизим томонидан: жинсий фаолликни ошиши;

қон томирлари томонидан бузилишлар: гипотензия, тромбофлебит;

умумий бузилишлар ва юбориш жойидаги бузилишлар: астения, юбориш жойида оғрик, иситма, тана вазнини ошиши;

- тиазот кислотаси билан боғлиқ:

пациентларда, асосан кекса ёшдагиларда хусусан бошқа препаратларни қабул қилиш фонида қуйидаги ҳолатлари таърифланган;

аллергик реакциялар: тери гиперемияси, иситма;

марказий ва периферик нерв тизими томонидан: бош айланиши, кулоқларни шанғиллаши;

юрак-қон томир тизими томонидан: тахикардия, артериал қон босимни ошиши;

меъда-ичак йўллари томонидан: оғизни қуриши, қоринни дам бўлиши;

нафас тизими томонидан: хансираш, бўғилиш хуружлари.

Қўллаш мумкин бўлмаган ҳолатлар

- пирацетамга ёки тиазот кислотасига ўта юқори сезувчанлик;

- буйрак етишмовчилигининг терминал босқичи;

-Хантингтон хорейси;

- бош миёда қон айланишининг геморрагик типдаги ўткир бузилишида қўллаш мумкин эмас.

Дориларнинг ўзаро таъсири

Тиопирамни кислотали рН муҳитига эга бўлган препаратлар билан буюриш мумкин эмас. *Таркибида пирацетам мавжудлиги туфайли ўзаро таъсирнинг қуйидаги турлари бўлиши мумкин.*

Тиреоид гормонлар. Тиреоид гормонлар билан мажмуада қўлланганда кучли таъсирчанлик, дезориентация ва уйқуни бузилиши юз бериши мумкин.

Аценокумарол. Қайталанувчи тромбозни оғир кечиши билан хасталанган беморларда пирацетамни юқори дозаларда (суткада 9,6 г) қўлланилиши аценокумаролнинг протромбин вақти қийматини 2,5-3,5 га эришиш учун керак бўлган дозасига таъсир қилмаган, лекин уни бир вақтда қўлланганда тромбоцитлар агрегацияси даражаси, фибриноген, Виллебранд факторларининг даражасини (коагуляцион фаоллик (VIII: C); ристоцетин ко-фактори (VIII: vW:Rco) ва қон плазмаси протеини (VIII: vW Ag), қон ва плазмани қовушқоқлигини анча пасайиши аниқланган.

Фармакокинетик ўзаро таъсирлар. Пирацетамнинг фармакодинамикасини бошқа препаратларнинг таъсири остида ўзгариш эҳтимоли паст, чунки препаратнинг 90% ўзгармаган ҳолда сийдик билан чиқарилади.

In vitro шароитида ўтказилган тажрибаларда пирацетам цитохром P450 нинг CYP1A2, 2B6, 2C8, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1 ва 4A9/11 изоформаларини 142, 426, 1422 мкг/мл концентрацияларда сусайтирмайди. 1422 мкг/мл концентрацияда CYP2A6 ни (21% га) ва 3A4/5 ни (11% га) биров сусайиши аниқланган. Бироқ 1422 мкг/мл дан ошса ушбу иккита CYP изомерларининг К даражаси етарли бўлади. Шунинг учун шу ферментлар томонидан биотрансформацияга учрайдиган препаратлар билан ўзаро таъсир эҳтимоли кам.

Тутқаноққа қарши воситалар. Пирацетамни суткада 20 мг дозада 4 ҳафта давомида ва ундан ортиқ қўлланганда тутқаноғи бўлган беморларда қон зардобидидаги тутқаноққа қарши препаратларнинг (карбамазепин, фенитоин, фенобарбитал, натрий вальпроати) концентрацияси даражасининг эгри чизиғи ва максимал концентрациясини ўзгартирмаган.

Алкоголь Алкоголь билан бирга қабул қилиш пирацетамнинг қон зардобидидаги концентрацияси даражасига таъсир қилмаган ва 1,6 г пирацетам қабул қилинганда алкогольнинг қон зардобидидаги концентрацияси ўзгармаган.

Махсус кўрсатмалар

Сурункали буйрак етишмовчилиги бўлган беморларда препаратни эҳтиёткорлик билан буюриш керак.

Препаратни кекса ёшдаги юрак-қон томир патологияси бўлган шахсларга юқорида таърифланган ножўя реакцияларни бу гуруҳ беморларида кўпроқ аниқланиши туфайли, эҳтиёткорлик билан қўллаш лозим.

Аллергияга мойиллиги бўлган шахсларда аллергия реакциялар кўпроқ учрайди. Пирацетам тромбоцитлар агрегациясини пасайтиргани туфайли уни гемостазни бузилиши, қон кетишлари билан кечувчи ҳолатлари (меъда-ичак йўллари яралари) бўлган беморларга, катта жарроҳлик операцияларида (жумладан стоматологик аралашувларида), оғир қон кетишлари симптомлари бўлган беморларга ёки анамнезида геморрагик инсульт бўлган беморларга; антикоагулянтларни, тромбоцитар антиагрегантларни, жумладан ацетилсалицил кислотасининг паст дозаларини қўллаётган пациентларга эҳтиёткорлик билан буюриш керак.

Кекса ёшдаги беморларда узоқ муддат даволашда буйрак функцияси кўрсаткичларини мунтазам назорат қилиб туриш тавсия қилинади.

Болалар.

Педиатрия амалиётида қўллаш мумкин эмас.

Ҳомиладорлик ва лактация даврида қўлланиши

Қўллаш мумкин эмас.

Автотранспортни ёки бошқа механизмларни бошқаришда реакция тезлигига таъсир этиш хусусияти.

Ҳозирги вақтгача бундан хабарлар йўқ. Бироқ Тиопирамни автотранспортни бошқараётган ёки хавфли механизмлар билан ишлаётган шахсларда қўлланиганида, нерв тизими томонидан мумкин бўлган нохуш реакцияларни ҳисобга олиб, эҳтиёткорликка риоя қилиш лозим.

Дозани ошириб юборилиши

Симптомлари: препаратнинг ножўя таъсир кўринишлари кучайиши,

Бундай ҳолларда препаратни қўллаш тўхтатилади ва симптоматик даволаш буюрилади.

Чиқарилиш шакли

Инъекция учун эритма 5 мл ва 10 мл дан ампулаларда тиббиётда қўлланилишига доир йўриқномаси билан бирга.

Сақлаш шароити

Ёруғликдан ҳимояланган жойда, 25° С дан юқори бўлмаган ҳароратида.

Препарат болалар ололмайдиган жойда сақлансин.

Яроқлилик муддати

2 йил.

Яроқлилик муддати ўтгач ишлатилмасин.

Дорихоналардан бериш тартиби

Рецепт бўйича.

Ишлаб чиқарувчи

“RADIKS” МЧЖ,

Ўзбекистон Республикаси, 100054, Тошкент ш., Лутфий кўч, 50.

Тел: (+99871) 273-92-31, факс: (+99871) 273-80-58.

Ўзбекистон Республикаси ҳудудида дори воситаларининг сифати бўйича эътирозлар (таклифлар) ни қабул қилувчи ташкилот номи ва манзили:

"RADIKS" МЧЖ,

Ўзбекистон Республикаси, 100054, Тошкент ш. Лутфий кўч., 50

Тел.: (+99871) 273-43-98, факс: (+99871) 273-80-58.