

ТИРОЗОЛ® (THYROZOL)

THIAMAZOLE

зарегистрировано и произведено
MERCK KGaA (Германия)**ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА, СОСТАВ И УПАКОВКА**

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, светло-желтые, круглые, двояковыпуклые, с рисками с обеих сторон; на поперечном разрезе ядро белого или почти белого цвета.

1 таб.

тиамазол 5 мг

Вспомогательные вещества: кремния диоксид коллоидный – 2 мг, карбоксиметилкрахмал натрия – 2 мг, магния стеарат – 2 мг, гипромеллоза 2910/15 – 3 мг, тальк – 6 мг, порошок целлюлозы – 10 мг, крахмал кукурузный – 20 мг, лактозы моногидрат – 200 мг.

Состав пленочной оболочки: краситель железа оксид желтый – 0.04 мг, диметикон 100 – 0.16 мг, макрогол 400 – 0.79 мг, титана диоксид – 1.43 мг, гипромеллоза 2910/15 – 3.21 мг.

10 шт. – блистеры (2) – пачки картонные.

10 шт. – блистеры (4) – пачки картонные.

10 шт. – блистеры (5) – пачки картонные.

10 шт. – блистеры (10) – пачки картонные.

25 шт. – блистеры (2) – пачки картонные.

25 шт. – блистеры (4) – пачки картонные.

25 шт. – блистеры (5) – пачки картонные.

25 шт. – блистеры (10) – пачки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, серо-оранжевые, круглые, двояковыпуклые, с рисками с обеих сторон; на поперечном разрезе ядро белого или почти белого цвета.

1 таб.

тиамазол 10 мг

Вспомогательные вещества: кремния диоксид коллоидный – 2 мг, карбоксиметилкрахмал натрия – 2 мг, магния стеарат – 2 мг, гипромеллоза 2910/15 – 3 мг, тальк – 6 мг, порошок целлюлозы – 10 мг, крахмал кукурузный – 20 мг, лактозы моногидрат – 195 мг.

Состав пленочной оболочки: краситель железа оксид желтый – 0.54 мг, краситель железа оксид красный – 0.004 мг, диметикон 100 – 0.16 мг, макрогол 400 – 0.79 мг, титана диоксид – 0.89 мг, гипромеллоза 2910/15 – 3.21 мг.

10 шт. – блистеры (2) – пачки картонные.

10 шт. – блистеры (4) – пачки картонные.

10 шт. – блистеры (5) – пачки картонные.

10 шт. – блистеры (10) – пачки картонные.

25 шт. – блистеры (2) – пачки картонные.

25 шт. – блистеры (4) – пачки картонные.

25 шт. – блистеры (5) – пачки картонные.

25 шт. – блистеры (10) – пачки картонные.

Номер и дата регистрации: П N014893/01 от 31.07.08

Код АТХ: N03BB02

Клинико-фармакологическая группа:

Антитиреоидный препарат

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКОЕ ДЕЙСТВИЕ

Антитиреоидный препарат. Нарушает синтез гормонов щитовидной железы, блокируя фермент пероксидазу, участвующую в йодировании тиронина в щитовидной железе с образованием трийод- и тетраiodтиронина. Поэтому препарат эффективен при симптоматической терапии тиреотоксикоза (за исключением случаев развития заболевания вследствие высвобождения гормонов после разрушения клеток щитовидной железы после лечения радиоактивным йодом или при тиреоидите).

Тирозол® не влияет на процесс высвобождения синтезированных тиронинов из фолликулов щитовидной железы. Этим объясняется латентный период различной продолжительности, который может предшествовать нормализации уровня T₃ и T₄ в плазме крови, т.е. улучшению клинической картины.

Препарат снижает основной обмен, ускоряет выведение из щитовидной железы йодидов, повышает реципрокную активацию синтеза и секреции гипофизом ТТГ, что может сопровождаться некоторой гиперплазией щитовидной железы.

Продолжительность действия препарата после однократного приема составляет почти 24 ч.

ФАРМАКОКИНЕТИКА

Всасывание

После приема препарата внутрь тиамазол быстро и практически полностью всасывается. C_{\max} в плазме достигается в течение 0.4-1.2 ч.

Распределение

Практически не связывается с белками плазмы крови. Кумулирует в щитовидной железе.

Небольшие количества тиамазола обнаруживают в грудном молоке.

Метаболизм

Медленно метаболизируется в щитовидной железе, а также в почках и печени.

Выведение

$T_{1/2}$ составляет около 3-6 ч. Тиамазол выводится с мочой (в течение 24 ч 70% препарата, причем 7-12% в неизменном виде) и желчью.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

У пациентов с печеночной недостаточностью $T_{1/2}$ увеличивается.

Фармакокинетические показатели препарата не зависят от функционального состояния щитовидной железы.

ПОКАЗАНИЯ

- тиреотоксикоз;
- подготовка к хирургическому лечению тиреотоксикоза;
- подготовка к лечению тиреотоксикоза радиоактивным йодом;
- терапия в латентный период действия радиоактивного йода – проводится до начала действия радиоактивного йода (в течение 4-6 мес);
- в исключительных случаях длительная поддерживающая терапия тиреотоксикоза, когда в связи с общим состоянием или по индивидуальным причинам невозможно выполнить радикальное лечение;
- профилактика тиреотоксикоза при назначении препаратов йода (включая случаи применения йодсодержащих рентгеноконтрастных средств) при наличии латентного тиреотоксикоза, автономных аденом или тиреотоксикоза в анамнезе.

РЕЖИМ ДОЗИРОВАНИЯ

Препарат принимают внутрь после приема пищи. Таблетки следует принимать не разжевывая, запивая достаточным количеством жидкости.

Суточную дозу назначают в 1 прием или разделяют на 2-3 разовые дозы. В начале лечения разовые дозы принимают в течение дня в строго определенное время. Поддерживающую дозу следует принимать в один прием после завтрака.

При *тиреотоксикозе* в зависимости от тяжести заболевания препарат назначают в дозе 20-40 мг/сут в течение 3-6 нед. После нормализации функции щитовидной железы (обычно через 3-8 недель) переходят на прием поддерживающей дозы 5-20 мг/сут. С этого времени рекомендуется дополнительный прием левотироксина натрия.

При *подготовке к хирургическому лечению тиреотоксикоза* назначают 20-40 мг/сут до достижения эутиреоидного состояния. С этого времени рекомендуется дополнительный прием левотироксина натрия. С целью сокращения времени, необходимого для подготовки к операции, дополнительно назначают бета-адреноблокаторы и препараты йода.

При *подготовке к лечению радиоактивным йодом* назначают 20-40 мг/сут до достижения эутиреоидного состояния.

При *терапии в латентный период действия радиоактивного йода* в зависимости от тяжести заболевания назначают 5-20 мг/сут до наступления действия радиоактивного йода (4-6 мес).

При *длительной тиреостатической поддерживающей терапии* Тирозол® назначают в дозах 1.25-2.5-10 мг/сут с дополнительным приемом левотироксина натрия в небольших дозах. При лечении тиреотоксикоза длительность терапии составляет от 1.5 до 2 лет.

С целью *профилактики тиреотоксикоза при назначении препаратов йода (включая случаи применения йодсодержащих рентгеноконтрастных средств) при наличии латентного тиреотоксикоза, автономных аденом или тиреотоксикоза в анамнезе* Тирозол® назначают в дозе 10-20 мг/сут и перхлорат калия 1 г/сут в течение 8-10 дней перед приемом йодсодержащих средств.

Детям в возрасте от 3 до 17 лет Тирозол® назначают в начальной дозе 0.3-0.5 мг/кг массы тела в 2-3 равных разделенных дозах ежедневно. Максимальная рекомендуемая доза для **детей с массой тела более 80 кг** – 40 мг/сут. Поддерживающая доза – 0.2-0.3 мг/кг/сут. При необходимости дополнительно назначают левотироксин натрия.

Не рекомендуется применение у **детей в возрасте от 0 до 3 лет**.

При **беременности** препарат назначают в минимальных дозах: разовая – 2.5 мг, суточная – 10 мг.

При **печеночной недостаточности** препарат назначают в минимальной эффективной дозе под тщательным врачебным контролем.

При *подготовке к операции пациентов с тиреотоксикозом* лечение препаратом проводится до достижения эутиреоидного состояния в течение 3-4 недель до запланированного дня операции (в отдельных случаях – более длительно) и заканчивается за день до нее.

ПОБОЧНОЕ ДЕЙСТВИЕ

Определение частоты побочных эффектов: 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 ($< 1/10\ 000$).

Со стороны системы кроветворения: нечасто – агранулоцитоз (симптомы могут появиться даже спустя недели и месяцы после начала лечения и привести к необходимости отмены препарата); очень редко – генерализованная лимфаденопатия, тромбоцитопения, панцитопения.

Со стороны эндокринной системы: очень редко – инсулиновый аутоиммунный синдром с гипогликемией.

Со стороны нервной системы: редко – обратимое изменение вкусовых ощущений, головокружение; очень редко – неврит, полиневропатия.

Со стороны пищеварительной системы: очень редко – увеличение слюнных желез, рвота.

Со стороны печени и желчевыводящих путей: очень редко – холестатическая желтуха и токсический гепатит.

Со стороны кожи и подкожных тканей: очень редко – генерализованные высыпания на коже, алопеция, волчаночноподобный синдром.

Аллергические реакции: кожные проявления (зуд, покраснение, высыпания).

Со стороны костно-мышечной системы: часто – медленно прогрессирующая артралгия без клинических признаков артрита.

Общие реакции: редко – повышение температуры, слабость, увеличение массы тела.

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

- повышенная чувствительность к компонентам препарата и к производным тиомочевины;
- агранулоцитоз во время ранее проводившейся терапии карбимазолом или тиамазолом;
- гранулоцитопения (в т.ч. в анамнезе);
- холестаза перед началом лечения;
- терапия тиамазолом в комбинации с левотироксином при беременности;
- детский возраст до 3 лет.

Тирозол® содержит лактозу, поэтому не рекомендуется его применение у пациентов с редкими наследственными заболеваниями, связанными с непереносимостью галактозы, дефицитом лактазы или синдромом глюкозо-галактозной мальабсорбции.

С осторожностью следует применять препарат при зобе очень больших размеров с сужением трахеи (только кратковременное лечение в период подготовки к операции), при печеночной недостаточности.

БЕРЕМЕННОСТЬ И ЛАКТАЦИЯ

Отсутствие лечения гиперфункции щитовидной железы при беременности может привести к серьезным осложнениям: преждевременные роды, пороки развития плода. Тем не менее, гипотиреоз, вызванный лечением неадекватными дозами, может привести к невынашиванию беременности.

Тиамазол проникает через плацентарный барьер и в крови плода достигает такой же концентрации, как у матери. Поэтому при беременности препарат следует назначать только после полной оценки пользы и риска его применения, в минимальной эффективной дозе (до 10 мг/сут) и без дополнительного применения левотироксина натрия. Тиамазол в дозах, значительно превышающих рекомендованные, может вызвать образование зоба, гипотиреоз у плода, а у новорожденного возможна пониженная масса тела при рождении.

В период лактации лечение тиреотоксикоза препаратом Тирозол® при необходимости может быть продолжено. Поскольку тиамазол выделяется с грудным молоком и может достигать в нем концентрации, соответствующей уровню тиамазола в крови матери, у новорожденного возможно развитие гипотиреоза. Необходимо регулярно контролировать функцию щитовидной железы у новорожденных.

ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ

Пациентам со значительным увеличением щитовидной железы, сужающей просвет трахеи, Тирозол® назначают кратковременно в комбинации с левотироксином натрия, т.к. при длительном применении возможно увеличение зоба и еще большее сдавление трахеи. Необходимо проводить тщательное наблюдение за больным (контроль уровня ТТГ и трахеального просвета).

В период лечения препаратом необходим регулярный контроль картины периферической крови.

Тиамазол и производные тиомочевины могут снижать чувствительность ткани щитовидной железы к лучевой терапии.

Если во время лечения препаратом внезапно появляются боли в горле, затрудненное глотание, повышение температуры тела, признаки стоматита или фурункулез (возможные симптомы агранулоцитоза) следует прекратить прием препарата и немедленно обратиться к врачу.

При появлении во время лечения подкожных кровоизлияний или кровотечений неясного генеза, генерализованной кожной сыпи и зуда, упорной тошноты или рвоты, желтухи, сильных болей в эпигастральной области и выраженной слабости требуется отмена препарата.

В случае раннего прекращения лечения возможен рецидив заболевания.

Появление или ухудшение течения эндокринной офтальмопатии не является побочным действием адекватного лечения препаратом Тирозол®, проводимого должным образом.

В редких случаях после окончания лечения может возникнуть поздний гипотиреоз, который не является побочным действием препарата, а связан с воспалительными и деструктивными процессами в ткани щитовидной железы, протекающими в рамках основного заболевания.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Тиамазол не оказывает влияния на способность управлять транспортными средствами и механизмами.

ПЕРЕДОЗИРОВКА

Симптомы: при длительном применении препарата в высоких дозах возможно развитие субклинического и клинического гипотиреоза, а также увеличение размеров щитовидной железы вследствие повышения уровня ТТГ в крови. Этого можно избежать путем снижения дозы препарата до достижения состояния эутиреоза или, если это необходимо, дополнительным назначением препаратов левотироксина натрия. Как правило, после отмены препарата Тирозол® наблюдается спонтанное восстановление функции щитовидной железы. Прием тиамазола в очень высоких дозах (около 120 мг/сут) может приводить к развитию миелотоксических эффектов. Препарат в таких дозах следует применять только по специальным показаниям (тяжелые формы заболевания, тиреотоксический криз).

Лечение: отмена препарата, промывание желудка, симптоматическая терапия, при необходимости, переключение на анти тиреоидный препарат другой группы.

ЛЕКАРСТВЕННОЕ ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ

При назначении препарата после применения йодсодержащих рентгеноконтрастных средств в высокой дозе возможно ослабление действия тиамазола.

Недостаток йода усиливает действие тиамазола.

У пациентов, принимающих Тирозол® по поводу тиреотоксикоза, после достижения эутиреоидного состояния (нормализации содержания гормонов щитовидной железы в сыворотке крови) может возникнуть необходимость уменьшения принимаемых доз сердечных гликозидов (дигоксина и дигитоксина), аминофиллина, а также увеличения принимаемых доз варфарина и других антикоагулянтов – производных кумарина и индандиона (фармакодинамическое взаимодействие).

Препараты лития, бета-адреноблокаторы, резерпин, амиодарон повышают эффект тиамазола (требуется коррекция его дозы).

При одновременном применении с сульфаниламидами, метамизолом натрия и миелотоксическими лекарственными средствами повышается риск развития лейкопении.

Лейкоген и фолиевая кислота при одновременном применении с тиамазолом уменьшают риск развития лейкопении.

Гентамицин усиливает анти тиреоидное действие тиамазола.

Данные о влиянии других лекарственных средств на фармакокинетику и фармакодинамику препарата отсутствуют. Однако следует иметь в виду, что при тиреотоксикозе ускоряется метаболизм и элиминация веществ. Поэтому в ряде случаев необходимо корректировать дозу других препаратов.

УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ И СРОКИ ГОДНОСТИ

Препарат следует хранить в недоступном для детей, сухом месте при температуре не выше 25°C. Срок годности – 4 года.

УСЛОВИЯ ОТПУСКА ИЗ АПТЕК

Препарат отпускается по рецепту.

ООО "Мерк"

115054 Москва, Валовая ул. 35

Тел.: (495) 937-33-04

Факс: (495) 937-33-05