

Инструкция по применению препарата

Мерказолил

РЕГИСТРАЦИОННЫЙ НОМЕР: P N001150/01

ТОРГОВОЕ НАЗВАНИЕ ПРЕПАРАТА: Мерказолилн

МЕЖДУНАРОДНОЕ НЕПАТЕНТОВАННОЕ НАЗВАНИЕ (МНН): Тиамазол

ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА: таблетки

СОСТАВ:

1 таблетка содержит:

действующее вещество: тиамазол в пересчете на 100 % вещество - 5 мг;

вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая, карбоксиметилкрахмал натрия, кремния диоксид коллоидный, кальция стеарат.

ОПИСАНИЕ

Таблетки от белого до белого с желтоватым или кремоватым оттенком цвета, плоскоцилиндрические, с фаской и риской. Допускается наличие незначительной «мраморности».

ФАРМАКОТЕРАПЕВТИЧЕСКАЯ ГРУППА: анти tireоидное средство.

КОД АТХ: N03BB02

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

ФАРМАКОДИНАМИКА

Анти tireоидный препарат, нарушает синтез гормонов щитовидной железы, блокируя фермент пероксидазу, участвующую в йодировании тиронина в щитовидной железе с образованием трийод- и тетраiodтиронина. Это свойство позволяет проводить симптоматическую терапию тиреотоксикоза, за исключением случаев развития тиреотоксикоза вследствие высвобождения гормонов после разрушения клеток щитовидной железы (после лечения радиоактивным йодом или при тиреоидите). Мерказолил не влияет на процесс высвобождения синтезированных тиронинов продолжительности, который может предшествовать нормализации уровня Т3 и Т4 в плазме крови, т.е. улучшению клинической картины.

Мерказолил снижает основной обмен, ускоряет выведение из щитовидной железы йодидов, повышает из фолликулов щитовидной железы. Этим объясняется латентный период различной реципрокную активацию синтеза и выделения гипофизом тиреотропного гормона, что может сопровождаться некоторой гиперплазией щитовидной железы.

Продолжительность действия однократно принятой дозы составляет почти 24 часа.

ФАРМАКОКИНЕТИКА

Абсорбция

Тиамазол при приеме внутрь быстро и почти полностью всасывается. Максимальная концентрация в плазме достигается в течение 0,4-1,2 часов.

Распределение

С белками плазмы крови практически не связывается. Тиамазол кумулируется в щитовидной железе, где медленно метаболизируется. Небольшие количества тиамазола обнаруживаются в грудном молоке. Период полувыведения составляет около 3-6 часов, при печеночной недостаточности он увеличивается. Не выявлена зависимость кинетики от функционального состояния щитовидной железы.

Метаболизм

Метаболизм тиамазола осуществляется в почках и печени, выведение препарата осуществляется почками и с желчью.

Выведение

Почками в течение 24 часов выводится 70 % тиамазола, причем 7-12 % в неизменном виде.

ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ

- 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 месяцев);
- 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.

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

- гиперчувствительность к тиамазолу или к производным тиомочевины, и/или к любому вспомогательному веществу в составе препарата;
- агранулоцитоз во время ранее проводившейся терапии карбимазолом или тиамазолом;
- гранулоцитопения (в том числе в анамнезе);
- холестаза перед началом лечения;
- период лактации;
- терапия тиамазолом в комбинации с левотироксином натрия в период беременности;
- непереносимость лактозы, дефицит лактазы, синдром глюкозо-галактозной мальабсорбции;
- препарат Мерказолил не рекомендуется к применению у детей до 3 лет.

С осторожностью:

Следует применять с осторожностью у пациентов с зобом очень больших размеров с сужением трахеи (только кратковременное лечение в период подготовки к операции); при печеночной недостаточности.

ПРИМЕНЕНИЕ ВО ВРЕМЯ БЕРЕМЕННОСТИ И В ПЕРИОД ГРУДНОГО ВСКАРМЛИВАНИЯ

Отсутствие лечения гиперфункции щитовидной железы во время беременности может приводить к серьезным осложнениям, таким как преждевременные роды, пороки развития плода. Гипотиреоз, вызванный лечением неадекватными дозами тиамазола, может привести к невынашиванию беременности. Тиамазол проникает через плацентарный барьер и в крови плода может достигать такой же концентрации, что и у матери. Так как эмбриотоксическое действие тиамазола не может быть полностью исключено, применение препарата Мерказолил в период беременности возможно только после строгой оценки соотношения «пользы-риска» его применения в минимально эффективной дозе (до 10 мг/сут) без дополнительного приема левотироксина натрия.

Дозы тиамазола, значительно превышающие рекомендованные, могут вызывать образование зоба и гипотиреоз у плода, а также приводить к снижению массы тела ребенка при рождении.

В период грудного вскармливания лечение тиреотоксикоза препаратом Мерказолил при необходимости может быть продолжено. Так как тиамазол проникает в грудное молоко и может достигать в нем концентрации, соответствующей уровню его в крови у матери, у новорожденного возможно развитие гипотиреоза.

Необходимо регулярно контролировать функцию щитовидной железы у новорожденных. Для продолжения терапии тиамазолом в период грудного вскармливания должны применяться только низкие дозы препарата Мерказолил (до 10 мг/сут) без дополнительного приема левотироксина натрия.

СПОСОБ ПРИМЕНЕНИЯ И ДОЗЫ

Таблетки следует принимать внутрь после еды, не разжевывая, с достаточным количеством жидкости. Суточную дозу назначают в один прием или разделяют на две-три разовые дозы. В начале лечения разовые дозы принимаются в течение дня в строго определенное время. Поддерживающую дозу следует принимать в один прием после завтрака.

Тиреотоксикоз:

В зависимости от тяжести заболевания назначают 20-40 мг/сут препарата Мерказолил в течение 3-6 недель. 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 препарата Мерказолил 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 препарата Мерказолил до достижения эутиреоидного состояния.

Терапия в латентный период действия радиоактивного йода: в зависимости от тяжести заболевания назначают 5-20 мг/сут препарата Мерказолил до наступления действия радиоактивного йода (4-6 месяцев).

Длительная тиреостатическая поддерживающая терапия: 1,25 - 2,5-10 мг/сут препарата Мерказолил с дополнительным приемом небольших доз левотироксина натрия. При лечении тиреотоксикоза длительность терапии составляет от 1,5 до 2 лет.

Профилактика тиреотоксикоза при назначении препаратов йода (включая случаи применения йодсодержащих рентгеноконтрастных средств) при наличии латентного тиреотоксикоза, автономных аденом или тиреотоксикоза в анамнезе: назначают 10-20 мг/сут препарата Мерказолил и 1 г перхлората калия в день в течение 8-10 дней перед приемом йодсодержащих средств.

Дозировка у детей

Не рекомендован к применению у детей от 0 до 3 лет. Детям от 3 до 17 лет препарат Мерказолил назначают в начальной дозе 0,3-0,5 мг/кг массы тела, которую делят на две-три равные дозы ежедневно.

Максимально рекомендованная доза для детей с массой тела более 80 кг – 40 мг/день. Поддерживающая доза: 0,2-0,3 мг/кг массы тела в день. При необходимости дополнительно назначают левотироксин натрия.

Дозировка у беременных

Беременным женщинам назначают в максимально низких дозах: разовая – 2,5 мг, суточная – 10 мг.

При печеночной недостаточности назначают минимально эффективную дозу препарата 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 – длительнее) и заканчивается за день до нее.

ПОБОЧНОЕ ДЕЙСТВИЕ

Частота нежелательных реакций (НР) представлена как: очень часто $\geq 1/10$, часто $\geq 1/100$, $<1/10$, нечасто $\geq 1/1000$, $< 1/100$, редко $\geq 1/10000$, $< 1/1000$, очень редко $<1/10000$.

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы

Нечасто: в 0,3-0,6 % случаев регистрировался агранулоцитоз (может проявиться через несколько недель или месяцев после начала терапии и обусловить необходимость прекращения терапии тиамазолом), в большинстве случаев наблюдается спонтанное восстановление показателей крови.
Очень редко: тромбоцитопения, панцитопения, генерализованная лимфаденопатия.

Нарушения со стороны обмена веществ и питания.

Очень редко: аутоиммунный инсулиновый синдром (АИС), с выраженным снижением концентрации глюкозы в плазме крови.

Нарушения со стороны нервной системы

Редко: нарушения вкуса (дисгевзия, агевзия) наблюдаются редко и после прекращения терапии восстанавливаются, однако нормализация вкусовых нарушений может длиться в течение нескольких недель.
Очень редко: неврит, полинейропатия.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта

Очень редко: острый отек слюнной железы.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей

Очень редко: изолированные случаи холестатической желтухи или токсического гепатита (симптомы обычно возникают после прекращения препарата); в период терапии тиамазолом клинические проявления холестаза следуют отличать от нарушений, вызванных гипертиреозом (повышение активности гамма-глутамилтрансферазы, щелочной фосфатазы или ее изофермента).

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей

Очень часто: аллергические кожные реакции (зуд, сыпь, крапивница) различной степени тяжести, обычно с небольшой продолжительностью.
Очень редко: тяжелые формы аллергических кожных реакций вплоть до генерализованного дерматита, алопеция, лекарственно-индуцированная красная волчанка.

Нарушения со стороны скелетно-мышечной и соединительной ткани

Часто: артралгия (может развиваться медленно, возможно даже после нескольких месяцев терапии).
Общие расстройства и нарушения в месте введения
Редко: лекарственная лихорадка.

Дети и подростки

Частота, тип и тяжесть нежелательных реакций у детей и взрослых имеют сходный характер.
Очень редко у детей и подростков встречаются тяжелые реакции гиперчувствительности со стороны кожи, такие как генерализованный дерматит, включая синдром Стивенса-Джонсона.

ПЕРЕДОЗИРОВКА

При длительном приеме высоких доз препарата возможно развитие субклинического и клинического гипотиреоза, а также увеличение размеров щитовидной железы вследствие повышения уровня ТТГ. Этого можно избежать путём снижения дозы препарата до достижения состояния эутиреоза или, если это необходимо, дополнительным назначением препаратов левотироксина натрия. Как правило, после отмены препарата Мерказолил наблюдается спонтанное восстановление функции щитовидной железы.

Прием очень высоких доз тиамазола (около 120 мг в день) может приводить к развитию миелотоксических эффектов. Такие дозы препарата должны применяться только по специальным показаниям (тяжелые формы заболевания, тиреотоксический криз). Лечение: отмена препарата, промывание желудка, симптоматическая терапия, при необходимости, переключение на антитиреоидный препарат другой группы.

ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ С ДРУГИМИ ЛЕКАРСТВЕННЫМИ СРЕДСТВАМИ

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

Дефицит йода усиливает фармакологическое действие тиамазола, а избыток йода (например, на фоне одновременного приема лекарственных препаратов, содержащих большие количества йода) его ослабляет.

У пациентов, принимающих тиамазол для лечения тиреотоксикоза, после достижения эутиреоидного состояния, т.е. 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 дозы).

При одновременном применении с сульфониламидами, 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 антитиреоидное действие тиамазола.

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

ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ

Пациентам со значительным увеличением щитовидной железы, суживающей просвет трахеи, препарат Мерказолил назначают кратковременно в комбинации с левотироксином натрия, так как при длительном применении возможно увеличение зоба и еще большее сдавление трахеи. Необходимо проводить тщательное наблюдение за пациентом (контроль уровня ТТГ, 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 эпигастральных болей и выраженной слабости требуется отмена препарата.

В случае раннего прекращения лечения возможен рецидив заболевания.

Появление или ухудшение течения эндокринной офтальмопатии не является побочным действием лечения препаратом Мерказолил, 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 управлять транспортными средствами, механизмами

Прием тиамазола не оказывает влияния на способность к управлению транспортными средствами и механизмами.

ФОРМА ВЫПУСКА

Таблетки, 5 мг. По 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку.

5 или 10 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению в пачке из картона.
2, 4 или 6 блистеров вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ

В сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25 °С.
Хранить в недоступном для детей месте.

СРОК ГОДНОСТИ

5 лет. Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

УСЛОВИЯ ОТПУСКА

Отпускают по рецепту.

ВЛАДЕЛЕЦ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Акционерное общество «Химико-фармацевтический комбинат «АКРИХИН»
(АО «АКРИХИН»), Россия

ОРГАНИЗАЦИЯ, ПРИНИМАЮЩАЯ ПРЕТЕНЗИИ ПОТРЕБИТЕЛЕЙ

Акционерное общество «Химико-фармацевтический комбинат «АКРИХИН»
(АО «АКРИХИН»), Россия
142450, Московская область, Ногинский район, г. Старая Купавна, ул. Кирова, д. 29.
Телефон/факс: +7 (495) 702-95-03.