

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування лікарського засобу

ВЕРТИНЕКС®

(VERTINEX®)

Склад:

діюча речовина: prochlorperazine maleate;

1 таблетка містить прохлорперазину малеату 5 мг;

допоміжні речовини: лактози моногідрат, целюлоза мікрокристалічна, крохмаль кукурудзяний, натрію кроскармелоза, натрію лаурилсульфат, магнію стеарат, кремнію діоксид колоїдний безводний.

Лікарська форма. Таблетки.

Основні фізико-хімічні властивості: білі або майже білі, круглі, двоопуклі таблетки, гладенькі з обох боків.

Фармакотерапевтична група.

Антипсихотичні засоби. Фенотіазини з піперазиною структурою. Код АТХ N05A B04.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Прохлорперазину малеат є похідним фенотіазину.

Прохлорперазин має широкий спектр активності завдяки його гальмівній дії на ЦНС, блокуванню альфа-адренорецепторів і слабкому антимускариновому ефекту. Він інгібує допамін- і пролактинінгібуючий фактор, стимулюючи таким чином вивільнення пролактину та прискорення метаболізму допаміну в головному мозку. Існують докази того, що терапевтичний ефект при психічних станах обумовлений антагоністичним впливом прохлорперазину на допамінергічні рецептори ЦНС.

Прохлорперазин чинить седативну дію, однак у більшості випадків до неї швидко розвивається толерантність. Прохлорперазин виявляє протиблювотний та протисвербіжний ефекти та блокує дію серотоніну. Крім того, прохлорперазин має незначний антигістамінний вплив та слабкий блокуючий вплив на ганглії. Також прохлорперазин має гальмівний вплив на центр

терморегуляції, розслаблюючий вплив на гладкі м'язи та володіє мембраностабілізуючими та місцевими анестезуючими властивостями. Вплив прохлорперазину на вегетативну нервову систему призводить до вазодилатації, артеріальної гіпотензії, тахікардії, гіпосалівації та зниження секреції шлункового соку.

Фармакокінетика.

Прохлорперазин добре всмоктується зі шлунково-кишкового тракту, але піддається значною мірою пресистемному метаболізму в стінці кишечника. Він також активно метаболізується в печінці і виводиться із сечею і жовчю. Після перорального прийому прохлорперазину його концентрація в плазмі крові значно нижча, ніж після його введення внутрішньом'язово. Не існує прямої кореляції між концентрацією прохлорперазину і його метаболітів у плазмі та терапевтичним ефектом.

Прохлорперазин може метаболізуватися шляхом гідроксилювання і кон'югації з глюкуроною кислотою, N-окиснення, окиснення атома сірки і дезалкілювання. Період напіввиведення з плазми крові становить усього кілька годин, але виведення метаболітів може бути дуже тривалим. Прохлорперазин значною мірою зв'язується з білками плазми та добре розподіляється по всьому організму, його метаболіти проникають через плацентарний бар'єр та потрапляють у грудне молоко. Швидкість метаболізму та екскреції прохлорперазину зменшується у пацієнтів літнього віку.

Клінічні характеристики.

Показання.

Запаморочення, що виникає через синдром Мен'єра, запалення внутрішнього вуха та інші причини.

Нудота та блювання, що виникають з будь-якої причини, включаючи мігрень.

Також може застосовуватися як додатковий лікарський засіб для короткострокового лікування тривожних станів.

Протипоказання.

Відома підвищена чутливість до прохлорперазину або до інших компонентів лікарського засобу.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

У разі передозування прохлорперазином не слід застосовувати адреналін (див. розділ «Передозування»).

Пригнічувальну дію прохлорперазину на ЦНС можуть посилювати (адитивно) алкоголь, барбітурати та інші седативні препарати. Можливе пригнічення дихання.

Антихолінергічні препарати можуть знизити антипсихотичний ефект прохлорперазину.

Помірна антихолінергічна дія прохлорперазину може бути посилена іншими антихолінергічними препаратами, що може призвести до запору, теплового удару і т. д.

Антациди, протипаркінсонічні засоби та препарати літію можуть погіршувати абсорбцію прохлорперазину.

У разі, якщо необхідне лікування екстрапірамідних симптомів, спричинених дією нейролептиків, слід надавати перевагу антихолінергічним протипаркінсонічним засобам перед леводопою, оскільки нейролептики протидіють протипаркінсонічному ефекту дофамінергічних засобів.

Високі дози нейролептиків знижують гіпоглікемічний ефект цукрознижувальних лікарських засобів, тому може виникати необхідність у корекції їх дози.

Нейролептичні препарати можуть посилювати гіпотензивний ефект більшості гіпотензивних лікарських засобів, особливо альфа-адреноблокаторів.

Прохлорперазин, як і інші фенотіазинові нейролептики, може пригнічувати дію деяких лікарських засобів: амфетаміну, леводопи, клонідину, гуанатедину та адреналіну.

Є дані про зміну концентрації деяких лікарських засобів у плазмі (наприклад, пропранололу, фенобарбіталу), що не має клінічного значення.

При одночасному застосуванні прохлорперазину та десфероксаміну спостерігалася транзиторна метаболічна енцефалопатія, що характеризувалася втратою свідомості на 48-72 години.

Існує підвищений ризик аритмії при одночасному застосуванні прохлорперазину та препаратів, що подовжують інтервал QT (у тому числі деяких антиаритмічних препаратів, антидепресантів та інших антипсихотичних препаратів), та лікарських засобів, що порушують електролітний баланс.

Існує підвищений ризик агранулоцитозу при одночасному застосуванні прохлорперазину та препаратів, що мають мієлосупресивний потенціал (такі як карбамазепін, певні антибіотики та цитотоксичні засоби).

Зрідка повідомлялося про нейротоксичний вплив при одночасному прийомі нейролептиків та препаратів літію.

Особливості застосування.

Прохлорперазин не слід застосовувати пацієнтам із порушеннями функції печінки або нирок, хворобою Паркінсона, гіпотиреозом, серцевою недостатністю, феохромоцитомою, міастенією гравіс та гіпертрофією передміхурової залози. Не слід призначати прохлорперазин пацієнтам із відомою підвищеною чутливістю до прохлорперазину, пацієнтам із закритокутовою глаукомою або агранулоцитозом в анамнезі.

Необхідно ретельно стежити за станом пацієнтів з епілепсією або судомами в анамнезі, тому що прохлорперазин може знижувати поріг судомної готовності.

Оскільки повідомляли про випадки агранулоцитозу при застосуванні прохлорперазину,

рекомендується регулярний моніторинг загального розгорнутого аналізу крові. Розвиток у пацієнта інфекції нез'ясованого генезу або гарячки може свідчити про дискразію крові, тому слід провести необхідні гематологічні дослідження.

Слід припинити лікування прохлорперазином у разі виникнення гарячки нез'ясованого генезу, оскільки вона може бути ознакою розвитку злоякісного нейролептичного синдрому (блідість, гіпертермія, вегетативна дисфункція, порушення свідомості, ригідність м'язів). Симптоми вегетативної дисфункції, такі як гіпергідроз та нестабільний артеріальний тиск, можуть передувати появі гіпертермії і служать ранніми ознаками злоякісного нейролептичного синдрому. Хоча даний синдром може також мати ідіосинкратичне походження, факторами, що сприяють його розвитку, є зневоднення та органічні захворювання головного мозку.

Оскільки повідомлялося про виникнення гострих симптомів відміни (включаючи нудоту, блювання, безсоння, екстрапірамідні реакції) після раптового припинення прийому великих доз нейролептиків, доцільним є поступова відміна прохлорперазину.

Прохлорперазин, як і інші нейролептичні фенотіазини, може потенціювати подовження інтервалу QT, що збільшує ризик виникнення шлуночкової тахікардії типу пірует, яка є смертельно небезпечною (раптова смерть). Ризик подовження інтервалу QT підвищується при наявності у пацієнта брадикардії, гіпокаліємії, а також вродженого або набутого (спричиненого лікарськими засобами) подовження інтервалу QT. Тому перед призначенням прохлорперазину необхідно повністю оцінити співвідношення ризик-користь. Рекомендується перед терапією прохлорперазином та протягом початкової фази лікування, а також у міру необхідності під час лікування проводити відповідні клінічні та лабораторні дослідження (наприклад, біохімічний аналіз крові і ЕКГ) для виключення можливих факторів ризику (таких як серцеві хвороби, подовження інтервалу QT у сімейному анамнезі, метаболічні розлади, такі як гіпокаліємія, гіпокальціємія або гіпомагніємія, анамнестичні дані щодо голодування, зловживання алкоголем, супутньої терапії іншими препаратами, які подовжують інтервал QT) (див. також розділи «Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій» та «Побічні реакції»).

Слід уникати супутньої терапії іншими нейролептиками (див. розділ «Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій»).

Інсульт: у рандомізованих клінічних випробуваннях, проведених у групі пацієнтів літнього віку з деменцією, які отримували лікування деякими атипичними антипсихотичними препаратами, спостерігалось триразове зростання ризику цереброваскулярних подій, порівняно з пацієнтами, які отримували плацебо. Оскільки механізм даного ризику невідомий, не можна його виключити при застосуванні інших антипсихотичних препаратів або при застосуванні серед інших груп пацієнтів. Прохлорперазин слід застосовувати з обережністю пацієнтам із факторами ризику розвитку інсульту.

Як і інші антипсихотичні препарати, прохлорперазин не слід приймати як монотерапію у разі, якщо у пацієнта домінують прояви депресії. Однак його можна додавати до антидепресивної терапії для лікування станів, коли поєднується депресія та психоз.

Через ризик виникнення фотосенсибілізації пацієнтам, які застосовують прохлорперазин, слід уникати прямої дії сонячних променів.

Для попередження сенсибілізації шкіри у осіб, які часто мають контакт із похідними фенотіазинів, їм слід уникати контакту препарату зі шкірою (див. розділ «Побічні реакції»).

Літній вік.

Препарат слід з обережністю застосовувати пацієнтам літнього віку, особливо в дуже жарку або дуже холодну погоду, через можливий ризик розвитку у них гіпер- чи гіпотермії. Крім того, пацієнти літнього віку схильні до постуральної гіпотензії. Також у пацієнтів даної вікової категорії підвищений ризик медикаментозного паркінсонізму, особливо після тривалого застосування прохлорперазину. Оскільки хворі літнього віку більш чутливі до дії лікарських засобів, що впливають на ЦНС, їм рекомендовано призначати більш низьку добову дозу прохлорперазину, особливо на початку лікування.

Підвищений рівень летальних випадків у літніх пацієнтів з деменцією.

Існують дані щодо незначного підвищення ризику летальних випадків у пацієнтів літнього віку з деменцією, які отримували лікування антипсихотичними препаратами. Оскільки недостатньо даних для оцінки величини та причин даного ризику, не слід призначати прохлорперазин для лікування порушень поведінки, пов'язаних із деменцією.

Підвищений ризик розвитку венозної тромбоемболії (ВТЕ).

Зафіксовано випадки ВТЕ при застосуванні антипсихотичних препаратів. Оскільки у пацієнтів, які отримують антипсихотичні препарати, часто наявні фактори ризику розвитку ВТЕ, до початку та під час терапії прохлорперазином їх потрібно визначити та вжити необхідних профілактичних заходів.

Гіперглікемія або порушення толерантності до глюкози.

Повідомлялося про випадки гіперглікемії або порушення толерантності до глюкози у пацієнтів, які застосовували антипсихотичні препарати із групи фенотіазинів. Пацієнти із діагностованим цукровим діабетом або особи, які мають фактори ризику виникнення діабету, потребують відповідного глікемічного контролю до та під час лікування прохлорперазином.

Допоміжні речовини.

Препарат містить лактозу. Якщо у Вас встановлено непереносимість деяких цукрів, проконсультуйтеся з лікарем, перш ніж приймати цей лікарський засіб.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Вагітність.

Адекватних доказів безпеки застосування прохлорперазину під час вагітності у людей немає. Слід уникати застосування прохлорперазину під час вагітності, за винятком випадків, коли лікар вважає це життєво необхідним. Оскільки нейрорепродуктивні ефекти можуть пролонгувати пологову діяльність, при пологах прийом препарату слід припинити до відкриття шийки матки на 3-4 см. Існує ризик небажаної дії прохлорперазину на новонароджених, що може проявлятися низькою оцінкою стану новонародженого за шкалою Апгар, летаргією чи, навпаки, парадоксальним збудженням та тремором.

Оскільки у новонароджених, матері яких приймали під час третього триместру вагітності антипсихотичні препарати, включаючи прохлорперазин, є ризик виникнення небажаних, в тому числі серйозних ефектів, включаючи екстрапірамідні симптоми та/або симптоми відміни

(збудження, гіпертонія, гіпотонія, тремор, сонливість, розлади дихання або розлади харчування), слід ретельно спостерігати за такими дітьми.

Період годування груддю.

Оскільки прохлорперазин може проникати у грудне молоко, слід припинити годування груддю під час лікування.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

Пацієнтів слід попередити про сонливість у перші дні лікування. Не рекомендується керувати автомобілем або працювати з механізмами.

Спосіб застосування та дози.

Препарат призначають дорослим. Застосовують перорально.

Профілактика нудоти і блювання

По 1-2 таблетки (5-10 мг) 2-3 рази на добу.

Лікування нудоти і блювання

4 таблетки (20 мг) застосовують негайно після появи симптомів, у разі необхідності - ще 2 таблетки (10 мг) через 2 години.

Запаморочення

По 1 таблетці (5 мг) 3 рази на добу. У разі необхідності добову дозу лікарського засобу можна збільшити до 6 таблеток (30 мг). Через декілька тижнів добову дозу можна поступово знизити до 1-2 таблеток (5-10 мг).

Як додатковий лікарський засіб для короткострокового лікування тривожних станів

По 1 таблетці (5 мг) 3-4 рази на добу на початку лікування. При необхідності добову дозу лікарського засобу можна збільшити до 8 таблеток (40 мг) за 3-4 прийоми.

Пацієнти літнього віку

Пацієнтам літнього віку рекомендована більш низька добова доза прохлорперазину.

Діти.

Немає достатніх даних щодо застосування прохлорперазину дітям, тому не слід призначати Вертинекс® цій віковій категорії пацієнтів.

Передозування.

Симптоми передозування: сонливість або втрата свідомості, артеріальна гіпотензія, тахікардія, зміни ЕКГ, шлуночкова аритмія, гіпотермія, екстрапірамідна дискінезія.

Лікування.

Перша допомога. Якщо з моменту прийому токсичної дози лікарського засобу пройшло не більше 6 годин, слід провести промивання шлунка. Не рекомендується викликання блювання за допомогою медикаментозних засобів. Необхідно дати активоване вугілля. Специфічного антидоту не існує. Рекомендується підтримуюче та симптоматичне лікування.

Артеріальна гіпотензія. У легких випадках достатнім заходом є підняття верхніх кінцівок пацієнта догори. У тяжких випадках може виникнути необхідність в інфузійній терапії для корекції загального об'єму рідини. Слід вводити попередньо підігріті інфузійні розчини (з метою попередження гіпотермії). Якщо заміщення рідини недостатньо для корекції артеріальної гіпотензії, можна застосувати засоби з позитивною інотропною дією, такі як дофамін.

Не рекомендується застосовувати судинозвужувальні засоби периферичної дії та адреналін.

Шлуночкова та надшлуночкова тахіаритмія. Зазвичай підтримка нормальної температури тіла, корекція загального об'єму циркулюючої крові та/або метаболічних розладів є ефективними заходами для лікування тахіаритмії. За неефективності вищезазначених заходів або якщо тахіаритмія загрожує життю, слід проводити необхідну антиаритмічну терапію. Не рекомендується застосовувати лідокаїн чи антиаритмічні засоби тривалої дії.

Пригнічення ЦНС. Необхідно застосовувати лікарські засоби, направлені на підтримку дихання, включаючи за необхідності штучну вентиляцію легень.

Дистонія. У тяжких випадках прояви дистонії можна коригувати за допомогою проциклідину (5-10 мг) або орфенадрину (20-40 мг) внутрішньовенно або внутрішньом'язово.

Судомний синдром. Необхідно застосовувати діазепам внутрішньовенно.

Злоякісний нейролептичний синдром. Необхідно застосовувати фізичні методи охолодження. Також можна застосувати дантролен натрію.

Побічні реакції.

З боку імунної системи: реакції підвищеної чутливості I типу, включаючи ангіоневротичний набряк та кропив'янку.

З боку крові та лімфатичної системи: лейкопенія, агранулоцитоз.

З боку ендокринної системи: гіперпролактинемія, що може призвести до галактореї; гінекомастія; аменорея; імпотенція; непереносимість глюкози; гіперглікемія.

Порушення обміну речовин: синдром порушення секреції антидіуретичного гормону, гіпонатріємія.

З боку нервової системи: гостра дистонія або дискінезія, включаючи окулогірний криз;

акатизія; симптоми паркінсонізму (тремор, ригідність, акінезія або інші); тардивна дискінезія; безсоння; тривожне збудження; судоми.

З боку органів зору: офтальмологічні зміни.

З боку серця: зміни на ЕКГ (подовження інтервалу QT, депресія сегмента ST, зміни зубців U та/чи T); порушення серцевого ритму (шлуночкова аритмія та аритмії передсердь, атріовентрикулярна блокада, шлуночкова тахікардія, що може призвести до фібриляції шлуночків або зупинки серця); раптова смерть.

З боку судин: гіпотонія, венозна тромбоемболія (у тому числі випадки легеневої емболії), тромбоз глибоких вен.

З боку травної системи: сухість у роті.

З боку дихальної системи: пригнічення дихання, закладеність носа.

З боку печінки та жовчовивідних шляхів: жовтяниця.

З боку шкіри та підшкірної клітковини: металеве сіро-лілове забарвлення шкіри; шкірні висипання; фотосенсибілізація.

Загальні порушення: злоякісний нейролептичний синдром (гіпертермія, ригідність, вегетативні дисфункції та порушення свідомості).

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання.

Зберігати при температурі не вище 25 °C.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 10 таблеток у блістері; по 1 блістеру в картонній упаковці.

По 10 таблеток у блістері; по 1 блістеру в картонній упаковці; по 10 картонних упаковок у картонній коробці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник.

КУСУМ ХЕЛТХКЕР ПБТ ЛТД/

KUSUM HEALTHCARE PVT LTD.

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.

СП-289 (А), РІІКО Індастріал ара, Чопанкі, Бхіваді, Діст. Алвар (Раджастан), Індія/

SP-289 (A), RIICO Industrial area, Chopanki, Bhiwadi, Dist. Alwar (Rajasthan), India.