

Склад

діюча речовина: trifluoperazine;

1 мл розчину містить трифлуоперазину гідрохлориду 2 мг;

допоміжні речовини: натрію цитрат, вода для ін'єкцій.

Лікарська форма

Розчин для ін'єкцій.

Основні фізико-хімічні властивості: прозора безбарвна або злегка жовтувата рідина.

Фармакотерапевтична група

Антипсихотичні засоби. Піперазинові похідні фенотіазину.

Код АТХ N05A B06.

Фармакодинаміка

Трифтазин-Дарниця – антипсихотичний засіб (нейролептик), піперазинове похідне фенотіазину. Має антипсихотичну, седативну, протиблювальну, каталептичну, гіпотензивну, гіпотермічну та слабку холіноблокуючу дію, також спрямовану проти гикавки.

Антипсихотична дія пов'язана з блокадою D2-дофамінових рецепторів мезолімбічної та мезокортикальної систем, блокадою α -адренорецепторів у центральній нервовій системі (ЦНС), підвищенням вивільнення гормонів гіпоталамусу та гіпофізу.

Седативна дія розвивається внаслідок блокади адренорецепторів ретикулярної формації стовбура головного мозку.

Протиблювальна дія пов'язана з блокадою периферичних і центральних D2-дофамінових рецепторів, блокадою закінчень блукаючого нерва у шлунково-кишковому тракті.

Гіпотермічна дія розвивається за рахунок блокади дофамінових рецепторів гіпоталамусу.

Седативна дія та вплив на вегетативну нервову систему виражені слабше, ніж в інших похідних фенотіазину, екстрапірамідна та протиблювальна дія – сильніше.

Фармакокінетика

Після внутрішньом'язового введення має ефект «первинного проходження» через печінку. Міцно зв'язується з білками плазми крові, рівень зв'язування

становить 95 %. Час досягнення максимальної концентрації (T_{max}) у крові – 1–2 години. Проникає крізь гематоенцефалічний бар'єр, у грудне молоко. Інтенсивно метаболізується у печінці, продукти метаболізму фармакологічно неактивні. Період напіввиведення (T_{1/2}) становить 15–30 годин. Метаболіти виводяться з організму жовчю та нирками. Слабко діалізується у зв'язку з високим зв'язуванням з білками плазми крові.

Показання

Психотичні розлади, у тому числі шизофренія.

Протипоказання

Підвищена чутливість до компонентів лікарського засобу, інших лікарських засобів фенотіазинового ряду. Декомпенсована серцева недостатність, виражена артеріальна гіпотензія. Депресія ЦНС. Кома будь-якої етіології. Прогресуючі системні захворювання головного та спинного мозку. Стенокардія. Рак молочної залози. Закритокутова глаукома. Функціональна ниркова та печінкова недостатність, пошкодження печінки. Виразкова хвороба шлунка та дванадцятипалої кишки у період загострення. Епілепсія, хвороба Паркінсона. Порушення механізму центральної регуляції дихання (особливо у дітей), синдром Рейє. Кахексія. Феохромоцитома. Пролактинзалежна пухлина. Мікседема. Гіперплазія передміхурової залози. Патологічні зміни крові, пов'язані з порушенням кровотворення. Період вагітності або годування груддю.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій

Засоби, що пригнічують функції центральної нервової системи (засоби для наркозу, опіюєдні анагетіки, барбітурати, анксіолітики, етанол і етанолвмісні препарати) – підсилюється ефект лікарського засобу, посилюється депресія ЦНС і пригнічується дихання.

Індуктори CYP1A2 (карбамазепін, фенобарбітал, рифампіцин, аміноглютетимід) – знижують концентрацію та ефект Трифтазину-Дарниця.

Інгібітори CYP1A2 (аміодарон, ципрофлоксацин, флувоксамін, кетоконазол, норфлоксацин, офлоксацин, рофекоксиб) – підвищують концентрацію та ефект Трифтазину-Дарниця.

α-адреноблокатори – посилюють гіпотензивні ефекти лікарського засобу.

Леводопа та фенаміни – знижують ефект лікарського засобу.

Протиепілептичні засоби – при одночасному застосуванні знижується ефект протиепілептичних лікарських засобів.

Антитиреоїдні препарати – збільшується ризик розвитку агранулоцитозу.

Астемізол, дизопірамід, еритроміцин, прокаїнамід – збільшується ризик розвитку тахікардії.

Трициклічні антидепресанти, мапротилін, інгібітори MAO – можливі подовження і посилення седативного та антихолінергічного ефектів Трифтазину-Дарниця.

Препарати літію – можливе посилення екстрапірамідних порушень, ранні прояви ознак інтоксикації літієм.

Адреноміметики та симпатоміметики – одночасне застосування може призвести до парадоксального зниження артеріального тиску.

Взаємно посилюються ефекти при одночасному застосуванні етанолу.

Протисудомні препарати – можливе зниження судомного порога.

Лікарські засоби, що спричиняють екстрапірамідні реакції (метоклопрамід) – можливе збільшення частоти і тяжкості екстрапірамідних порушень.

Антигіпертензивні препарати – можливий розвиток ортостатичної артеріальної гіпотензії.

Прохлорперазин – можлива тривала втрата свідомості.

Лікарський засіб може зменшувати судинозвужувальний ефект ефедрину та епінефрину, посилювати антихолінергічні ефекти інших лікарських засобів, пригнічувати дію амфетамінів, леводопи, клонідину, гуанетидину.

Бромокриптин – фенотіазини пригнічують здатність бромокриптину знижувати концентрацію пролактину в сироватці крові.

Пропранолол, сульфадоксин – збільшують концентрацію Трифтазину-Дарниця у плазмі крові.

Поліпептидні антибіотики – одночасне застосування може спричинити параліч дихальних м'язів.

Тразодон – спостерігається адитивний гіпотензивний ефект.

Вальпроїнова кислота – при одночасному застосуванні спостерігається збільшення концентрації вальпроїнової кислоти у плазмі крові.

Лікарський засіб може зменшувати ефект пероральних антикоагулянтів.

При одночасному застосуванні з лікарськими засобами, що подовжують інтервал QT (антиаритмічні, неседативні антигістамінні, протималарійні препарати, цизаприд, діуретики, трициклічні антидепресанти), похідні фенотіазину підвищують ризик розвитку шлуночкових аритмій.

З обережністю призначати одночасно з протитуберкульозними антибактеріальними засобами.

Особливості застосування

З обережністю призначати лікарський засіб пацієнтам із глаукомою (протипоказаний при закритокутовій формі глаукоми), серцево-судинними захворюваннями, із порушенням функції печінки, нирок, цереброваскулярними, дихальними порушеннями, жовтяницею, паркінсонізмом, цукровим діабетом,

гіпотиреозом, міастенією гравіс, затримкою сечі, паралітичною непрохідністю кишечника.

Пацієнти, які отримують лікарський засіб протягом тривалого періоду, потребують уважного спостереження з метою вчасного виявлення ознак пізньої дискінезії, змін з боку очей, системи крові, печінки, порушення серцевої провідності.

При появі ознак пізньої дискінезії або злоякісного нейролептичного синдрому прийом лікарського засобу слід припинити. Клінічні прояви злоякісного нейролептичного синдрому можуть включати гіперексію, м'язову ригідність, зміни психічного стану та свідомості, вегетативну нестабільність (іррегулярний пульс, зміни артеріального тиску, тахікардія, підвищене потовиділення, серцева аритмія). Особливо важко діагностувати цей синдром у пацієнтів з тяжкими захворюваннями (наприклад з пневмонією, системною інфекцією тощо).

Необхідно провести диференційну діагностику у пацієнтів з патологією ЦНС, медикаментозною гарячкою, тепловим ударом, центральною антихолінергічною токсичністю. У деяких пацієнтів, які отримували комбіновану терапію з літієм, спостерігався енцефалопатичний синдром (слабкість, млявість, гарячка, тремтіння, сплутаність свідомості, екстрапірамідні симптоми, лейкоцитоз, підвищений рівень ферментів, азоту сечовини, глюкози крові), у деяких випадках розвивалися незворотні пошкодження головного мозку, тому слід ретельно стежити за ранніми проявами неврологічної токсичності та припинити лікування одразу при появі таких ознак.

Пацієнтам із синдромом Рейє, затримкою сечі, хронічними захворюваннями органів дихання, блюванням лікарський засіб призначати тільки після оцінки співвідношення користі і ризику лікування.

При лікуванні непсихотичної тривожності трифлуоперазин більшості пацієнтам слід призначати після застосування альтернативних лікарських засобів (наприклад, бензодіазепінів), які не мають деяких властивих трифлуоперазину побічних реакцій.

Описаний синдром відміни, що проявляється нудотою, блюванням, пітливістю, безсонням. Також можливий рецидив психотичних симптомів, поява рухових розладів (акатизія, дистонія, дискінезія). Тому відміну лікарського засобу необхідно здійснювати поступово.

Пацієнти літнього віку більш схильні до розвитку артеріальної гіпотензії і нервово-м'язової реакції; за такими пацієнтами під час лікування потрібен ретельний нагляд. Дозування лікарського засобу в нижньому діапазоні достатнє для більшості пацієнтів літнього віку. Дозування має бути пристосоване до рівня індивідуальної реакції і відповідним чином скориговане. Збільшувати дози таким пацієнтам необхідно поступово. Застосування лікарського засобу хворим літнього віку може спричинити прояви необоротної дискінезії.

Застосування лікарських засобів фенотіазинового ряду пацієнтам літнього віку з деменцією може підвищити ризик летального наслідку.

Використання в екстремальних умовах може бути небезпечним, оскільки при застосуванні фенотіазіну можливе порушення терморегуляції. Рекомендується уникати впливу прямих сонячних променів.

Застосування лікарського засобу має тривати не довше 12 тижнів, оскільки це може призвести до розвитку постійної пізньої дискінезії, яка може виявитися необоротною.

Якщо у пацієнта розвиваються реакції гіперчутливості (у т.ч. жовтяниця, патологічні зміни крові), повторно фенотіазіни призначати не слід.

При одночасному застосуванні з седативними лікарськими засобами, анестетиками, транквілізаторами, алкоголем можливий розвиток звикання.

Не рекомендується у період лікування лікарським засобом вживати алкоголь.

Дія фенотіазіну на блювальний центр може маскувати симптоми передозування іншими лікарськими засобами.

Слід регулярно перевіряти зір у пацієнтів, які отримують довгострокову терапію фенотіазіном.

Слід з обережністю призначати при гострій інфекції або лейкопенії.

Після парентерального введення пацієнти повинні залишатися у положенні лежачи на спині протягом 30 хвилин під контролем артеріального тиску.

Важлива інформація про допоміжні речовини.

Цей лікарський засіб містить менше 1 ммоль (23 мг)/дозу натрію, тобто практично вільний від натрію.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами

У період лікування лікарським засобом необхідно утримуватися від керування автотранспортом та від занять потенційно небезпечними видами діяльності, що вимагають високої швидкості психомоторних реакцій.

Застосування у період вагітності або годування груддю

Лікарський засіб протипоказаний у період вагітності. При необхідності застосування лікарського засобу годування груддю слід припинити.

Спосіб застосування та дози

Застосовувати внутрішньом'язово. Початкова доза для дорослих становить 1–2 мг. Повторне введення проводити через 4–6 годин; при частіших ін'єкціях можливі явища кумуляції. Добова доза, як правило, дорівнює 6 мг, у виняткових випадках – 10 мг.

При депресивно-галюцинаторних і депресивно-маячних станах Трифтазин-Дарниця застосовувати разом з антидепресантами.

Лікування Трифтазином-Дарниця має бути суворо індивідуалізоване залежно від перебігу захворювання. Термін лікування не має перевищувати 12 тижнів.

Діти

Не рекомендується застосовувати лікарський засіб для лікування дітей через обмежений клінічний досвід.

Передозування

Передозування проявляється дискінезією, дизартрією, сонливістю та ступором, екстрапірамідними порушеннями, мимовільними скороченнями м'язів, артеріальною гіпотензією або гіпертензією, серцевими аритміями, судомми, змінами на електрокардіограмі, гарячкою, вегетативними розладами, сухістю в роті, кишковою непрохідністю. У тяжких випадках можлива кома.

Лікування. Лікування є симптоматичним та підтримуючим. При пригніченні дихання проводити штучну вентиляцію легенів, кисневу терапію. Корекція кислотно-лужної рівноваги, водно-електролітного балансу, форсований діурез.

Побічні реакції

З боку органів зору: парез акомодациї, ретинопатія, помутніння кришталика та рогівки, порушення зорового сприйняття, кон'юнктивіт.

З боку шлунково-кишкового тракту: сухість у роті, гіперсалівація, анорексія, булімія, нудота, блювання, діарея, запор, гастралгія, парез кишечника, тризм, протрузія язика.

З боку печінки і жовчовивідних шляхів: холестатична жовтяниця, гепатотоксичність, гепатит.

З боку нирок та сечовидільної системи: зниження потенції, порушення еякуляції, пріапізм, затримка сечі, олігурія, порушення сечовиділення.

З боку ендокринної системи: гіпо- або гіперглікемія, глюкозурія, порушення менструального циклу (дисменорея, аменорея), гінекомастія, збільшення маси тіла, галакторея, біль у грудях, порушення лібідо, гіперпролактинемія.

З боку нервової системи: головний біль, сонливість, запаморочення, млявість,

безсоння, акатизія, дистонічні екстрапірамідні реакції (які можуть включати спазм шийних м'язів, кривошию, екстензію м'язів спини з можливим прогресуванням в опістотонус, карпопедальний спазм, тризм, труднощі ковтання, окулогірний криз, протрузію язика; ці симптоми зникають протягом декількох годин або через 24–48 годин після відміни лікарського засобу), псевдопаркінсонізм (маскоподібне обличчя, слинотеча, рухи «прокати таблетки», синдром жорсткості зубчастого колеса, човгання взуттям), пізня дискінезія (симптоми можуть бути незворотніми, характеризуються ритмічними мимовільними рухами язика, рота, щелепи (наприклад, протрузія язика, пихкання щік, зморщення рота, жувальні рухи), пізньою дистонією, мимовільними рухами кінцівок (рухи кінцівок можуть бути єдиними проявами пізньої дискінезії), пізня дисамнезія, злоякісний нейролептичний синдром, явища психічної індиферентності, запізніла реакція на зовнішні подразники, акінетико-ригідні явища, гіперкінези, тремор, вегетативні порушення, пізня дискінезія лицьових м'язів, дистонія, порушення терморегуляції, підвищена втомлюваність, порушення свідомості, ригідність м'язів, судоми.

З боку серцево-судинної системи: тахікардія, зниження артеріального тиску (ортостатична гіпотензія), порушення ритму серця, зміни електрокардіограми (подовження інтервалу QT, згладжування зубця T), напади стенокардії, шлуночкова аритмія на зразок torsades de pointes, зупинка серця.

З боку крові та лімфатичної системи: тромбоцитопенія, агранулоцитоз, анемія (гемолітична, апластична), панцитопенія, лейкопенія, тромбоцитопенічна пурпура, еозинофілія.

З боку імунної системи: алергічні реакції, включаючи висипання, кропив'янку, ангіоневротичний набряк, анафілактичний шок.

З боку шкіри та підшкірної клітковини: фотодермія, почервоніння шкіри, депігментація шкіри, ексфоліативний дерматит.

З боку опорно-рухової системи та сполучної тканини: міастенія.

Загальні розлади та реакції у місці введення: слабкість, набряки.

Лабораторні показники: хибно-позитивні тести на вагітність, фенілкетонурію.

Прояви побічних реакцій, властивих для фенотіазинів: гіпотермія, нічні жахи, депресія, гіперхолестеринемія, гіперпірексія, набряк мозку, генералізовані та парціальні судоми, подовження дії на ЦНС опіатів, анальгетиків, антигістамінних, барбітуратів, алкоголю, атропіну, тепла, фосфорорганічних інсектицидів, закладеність носа, адинамічна кишкова непрохідність, атонія кишечника, міоз, мідріаз, реактивація психотичних процесів, кататонічноподібні стани, порушення функції печінки, жовтяниця, біліарний стаз, іррегулярні менструації, свербіж, екзема, астма, епінефриновий ефект, збільшення апетиту, вовчакоподібний синдром, пігментація шкіри, епітеліальна кератопатія, лентикулярні та корнеальні відкладення, раптовий летальний наслідок, асфіксія, реакції у місці введення, включаючи біль і подразнення.

Повідомлення про підозрювані побічні реакції.

Повідомлення про підозрювані побічні реакції після реєстрації лікарського засобу є важливою процедурою. Це дозволяє продовжувати моніторинг співвідношення «користь/ризик» для відповідного лікарського засобу. Медичним працівникам необхідно повідомляти про будь-які підозрювані побічні реакції через національну систему повідомлень.

Термін придатності

4 роки.

Умови зберігання

Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С. Не заморожувати.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка

По 1 мл в ампулі; по 5 ампул у контурній чарунковій упаковці; по 2 контурні чарункові упаковки в пачці.

Категорія відпуску

За рецептом

Виробник

ПрАТ «Фармацевтична фірма «Дарниця».

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності

Україна, 02093, м. Київ, вул. Бориспільська, 13.

Джерело інструкції

Інструкцію лікарського засобу взято з офіційного джерела — [Державного реєстру лікарських засобів України](#).