

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування лікарського засобу
МЕРКАЗОЛЛ-ЗДОРОВ'Я

Склад:

діюча речовина: 1 таблетка містить тіамазолу 5 мг;

допоміжні речовини: крохмаль картопляний, кальцію стеарат, цукор-рафінад, тальк.

Лікарська форма. Таблетки.

Основні фізико-хімічні властивості: таблетки білого або білого з жовтуватим відтінком кольору, із плоскою поверхнею та фаскою.

Фармакотерапевтична група. Антитиреоїдні засоби. Код АТХ N03B B02.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Антитиреоїдний засіб. Механізм тиреостатичної дії зумовлений інгібуванням активності ферменту пероксидази, яка бере участь у йодуванні тиреоїдних гормонів щитовидної залози, що призводить до порушення синтезу тироксину і трийодтироніну. Ця властивість дозволяє проводити симптоматичне лікування тиреотоксикозу незалежно від його етіології. Тіамазол не впливає на секрецію попередньо синтезованих тиреоїдних гормонів, що пояснює тривалість латентного періоду до нормалізації концентрації тироксину і трийодтироніну у сироватці крові, внаслідок чого поліпшується клінічна картина захворювання. Не впливає на тиреотоксикоз, який розвинувся внаслідок вивільнення гормонів після руйнування клітин щитовидної залози (після лікування радіоактивним йодом або при тиреоїдиті).

Фармакокінетика. Після прийому внутрішньо швидко і повністю всмоктується з травного тракту. C_{max} у плазмі крові досягається через 40-80 хвилин. З білками плазми крові практично не зв'язується. Тіамазол накопичується у щитовидній залозі і дуже повільно метаболізується, у зв'язку з чим на кінетичній кривій утворюється плато концентрації, що зберігається протягом 24 годин після прийому разової дози препарату. Кінетика метаболізму не залежить від функції щитовидної залози. $T_{1/2}$ становить 3 години; у пацієнтів з печінковою недостатністю він триваліший. Виводиться з сечею і жовчю, незначною мірою – з фекаліями. З сечею виводиться у вигляді метаболітів (70 % протягом 24 годин) і незміненої речовини.

Клінічні характеристики.

Показання. Лікування тиреотоксикозу.

- Консервативне лікування тиреотоксикозу, особливо з відсутнім або малих розмірів зобом.
- Підготовка до хірургічного лікування при всіх формах тиреотоксикозу.
- Підготовка до лікування тиреотоксикозу радіоактивним йодом.
- Терапія у латентний період дії радіоактивного йоду.
- Профілактика тиреотоксикозу при призначенні препаратів йоду при існуванні латентного тиреотоксикозу, автономних аденом або тиреотоксикозу в анамнезі.

Протипоказання. Підвищена чутливість до будь-яких компонентів препарату/інших похідних тіонамідів, помірні і тяжкі порушення кількісного складу крові (гранулоцитопенія), холестаз перед початком лікування, ушкодження кісткового мозку при проведеній раніше терапії тіамазолом або карбімазолом, сумісна терапія препаратом і тиреоїдними гормонами у період вагітності протипоказана (див. розділ «Застосування у період вагітності або годування груддю»).

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій. Нестача йоду підвищує сприйнятливості щитовидної залози до препарату, а надлишок йоду – знижує її. Інші безпосередні взаємодії з іншими лікарськими засобами невідомі. Слід враховувати, що метаболізм і виведення інших лікарських засобів при гіпертиреозі може збільшуватися. Ці показники нормалізуються при відновленні функції щитовидної залози. При необхідності дозування препарату слід коригувати.

Особливості застосування. Препарат не рекомендується застосовувати пацієнтам з реакціями гіперчутливості в анамнезі (алергічні висипання, свербіж).

Пацієнтам, які мають зоб дуже великих розмірів і звуження трахеї, слід з обережністю і протягом якомога коротшого періоду застосовувати препарат.

Перед початком лікування необхідно звернути особливу увагу на симптоми агранулоцитозу (стоматит, фарингіт, висока температура тіла). Зазвичай симптоми виникають на початку лікування, однак можлива їх поява через кілька місяців або під час повторного курсу лікування. Рекомендується контролювати показники крові до і після початку терапії, особливо пацієнтам, які страждають на гранулоцитопенію помірного ступеня. У випадку розвитку будь-якого з вищезазначених симптомів, особливо протягом першого тижня лікування, слід негайно звернутися до лікаря для проведення аналізу крові. У разі підтвердження агранулоцитозу необхідно припинити подальшу терапію препаратом.

У випадку застосування препарату у рекомендованих дозах побічні реакції, зумовлені токсичною дією на кістковий мозок, виникали у рідкісних випадках. Подібні реакції спостерігалися під час прийому тіамазолу дуже високими дозами (близько 120 мг на добу). Такі дози препарату призначаються в індивідуальних випадках (тяжкі форми захворювання, тиреотоксичний криз). У випадку появи симптомів токсичної дії на кістковий мозок на тлі лікування препаратом необхідно припинити подальше його застосування.

Надлишок препарату в організмі після прийому дуже високих доз може призвести до розвитку субклінічного/клінічного гіпотиреозу або росту зоба за рахунок підвищення рівня секреції тиреотропного гормону. У зв'язку з цим дозу препарату необхідно зменшити одразу після відновлення нормального функціонування щитовидної залози, при необхідності призначити левотироксин. Припиняти повністю лікування препаратом і застосовувати лише левотироксин не рекомендується.

Збільшення зоба на тлі терапії із застосуванням препарату, всупереч пригніченню секреції тиреотропного гормону, виникає внаслідок самого захворювання і не може бути попереджене додатковим прийомом левотироксину.

Забезпечення нормального рівня секреції тиреотропного гормону важливе для мінімізації ризику прояву або погіршення ендокринної офтальмопатії. Однак дана патологія часто не залежить від перебігу захворювання щитовидної залози. Подібні ускладнення не є причиною для зміни режиму лікування і не є побічною реакцією при правильному проведенні курсу лікування.

У рідкісних випадках після проведення курсу антитиреоїдної терапії без хірургічного втручання спостерігалися випадки розвитку пізнього гіпотиреозу. Це не побічна реакція на препарат, а результат запальних і деструктивних процесів у паренхімі щитовидної залози, спричинених основним захворюванням.

За рахунок зниження патологічно підвищеного витрачання енергії при гіпертиреозі може збільшуватися маса тіла на тлі лікування препаратом. Покращення клінічної картини свідчить про нормалізацію енергообміну.

Якщо у пацієнта встановлена непереносимість деяких цукрів, слід проконсультуватися з лікарем, перш ніж приймати цей препарат.

Застосування у період вагітності або годування груддю. Зазвичай під час настання вагітності функція щитовидної залози нормалізується. Однак часто потрібне продовження лікування тиреотоксикозу, особливо у перші місяці вагітності. Внаслідок підвищеної активності щитовидної залози у період вагітності можливі серйозні ускладнення, такі як передчасні пологи або внутрішньоутробні вади розвитку. Застосування тіамазолу високими дозами для лікування тиреотоксикозу також підвищує ризик викидня.

Тіамазол проникає через плацентарний бар'єр. У разі прийому препарату у неправильно підібраних дозах виникає загроза росту щитовидної залози і розвитку гіпотиреозу у плода, а також зниження маси

тіла плода. Є неодноразові повідомлення про випадки часткової аплазії шкіри у новонароджених від жінок, які отримували тіамазол. Загоєння дефекту відбувалося спонтанно через кілька тижнів.

Також – виникнення різних мальформацій, таких як атрезія хоан, атрезія стравоходу, гіпоплазія сосків, а також затримка розумового і моторного розвитку, що пов'язують із застосуванням високих доз тіамазолу протягом перших тижнів вагітності. Однак дослідження кількох випадків пренатального впливу тіамазолу не виявило порушень морфологічного розвитку і не підтвердило вплив препарату на розвиток гіпотиреозу або на фізичний та розумовий розвиток дітей.

У зв'язку з неможливістю повністю виключити токсичну дію на плід препарат слід призначати у період вагітності після ретельної оцінки користь/ризик. Препарат застосовувати у максимально низькій ефективній дозі, додатково гормони не призначати.

Тіамазол проникає у грудне молоко, де його концентрація досягає рівня концентрації у сироватці крові матері, чим зумовлений ризик розвитку гіпотиреозу у дитини.

Під час годування груддю препарат призначати у максимально низьких ефективних дозах, що не перевищують 10 мг на добу, без додаткового призначення гормонів.

Необхідно регулярно контролювати функцію щитовидної залози у новонароджених.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами. Препарат не впливає на здатність керувати автотранспортом або іншими механізмами.

Спосіб застосування та дози. Добову дозу застосовувати одноразово або розподілити на кілька прийомів протягом дня. На початку лікування разові дози слід приймати протягом дня, через однакові проміжки часу. Підтримуючу дозу застосовувати за 1 прийом, під час або після сніданку.

Таблетки приймати не розжовуючи, запиваючи достатньою кількістю рідини.

Загальні рекомендації щодо дозування.

Дорослі. Залежно від ступеня тяжкості захворювання і надходження йоду до організму рекомендована доза для дорослих становить 10-40 мг на добу. У багатьох випадках пригнічення продукування гормону щитовидної залози забезпечується при прийомі 20-30 мг препарату на добу. У випадку захворювання легкого ступеня тяжкості призначати препарат у нижчому дозуванні, при тяжкому ступені захворювання необхідно застосовувати препарат у початковій дозі 40 мг на добу.

Коригування дози проводити індивідуально, враховуючи активність процесів метаболізму, зумовлених рівнем продукування гормону щитовидної залози.

Для проведення підтримуючої терапії рекомендовано таке дозування:

– підтримуюча доза препарату по 5-20 мг на добу у комбінації з левотироксином, для профілактики гіпотиреозу;

– у вигляді монотерапії по 2,5-10 мг препарату на добу.

У випадку тиреотоксикозу, зумовленого підвищеним вмістом йоду, можливе застосування препарату вищими дозами.

Діти. Препарат призначати дітям у початковій дозі 0,5 мг/кг маси тіла на добу.

Після нормалізації функції щитовидної залози дозу поступово знижувати до підтримуючої, що визначається з урахуванням індивідуальних особливостей метаболізму. У разі необхідності додатково призначати левотироксин.

Консервативне лікування тиреотоксикозу. Тривалість терапії препаратом становить від 6 місяців до 2 років (у середньому – протягом 1 року). Можливість подовження періоду ремісії залежить від тривалості терапії. У випадках, коли не вдається забезпечити ремісію, а проведення інших терапевтичних заходів неможливе, препарат можна застосовувати для довготривалої терапії у максимально низьких ефективних дозах.

Пацієнтам зі звуженням трахеї і зобом дуже великих розмірів препарат слід застосовувати протягом короткого періоду. Довготривала терапія може призвести до росту зоба.

Підготовка до хірургічного лікування при всіх формах тиреотоксикозу. Короточасна підготовча терапія (протягом 3-4 тижнів, у деяких випадках препарат можна застосовувати довше) сприяє відновленню еутиреоїдного стану, за рахунок чого зменшуються ризики, зумовлені хірургічним втручанням.

Хірургічне втручання проводиться одразу після досягнення еутиреоїдного стану. Терапію препаратом можна закінчувати за день до операції.

У період останніх 10 днів до операції хірург може додатково призначити препарати йоду у високих дозах для укріплення тканин щитовидної залози.

Підготовка до лікування тиреотоксикозу радіоактивним йодом. Препарат застосовувати для досягнення еутиреоїдного стану до початку терапії із застосуванням радіоактивного йоду. Особливо попередня терапія препаратом необхідна пацієнтам з тиреотоксикозом тяжкого ступеня, оскільки спостерігалися окремі випадки тиреотоксичного кризу після проведення лікування йодом без попередньої терапії тіамазолом.

Слід враховувати, що похідні тіосечовини можуть знижувати чутливість тканин щитовидної залози до променевої терапії. При проведенні запланованої терапії із застосуванням радіоактивного йоду у зв'язку з автономними аденомами необхідно провести попередню терапію препаратом для попередження активації паранодулярної тканини.

Терапія у латентний період дії радіоактивного йоду. Тривалість і доза препарату підбираються індивідуально залежно від ступеня тяжкості захворювання, а також з урахуванням періоду до початку дії радіоактивного йоду (приблизно 4-6 місяців).

Профілактика тиреотоксикозу при призначенні препаратів йоду, при існуванні латентного тиреотоксикозу, автономних аденом або тиреотоксикозу в анамнезі. Зазвичай рекомендована доза становить 10-20 мг препарату на добу та/або 1 г перхлорату щодня протягом 10 днів (наприклад при необхідності введення рентгеноконтрастного засобу, що виводиться нирками). Тривалість профілактичного лікування визначається з урахуванням тривалості періоду, протягом якого препарати йоду знаходяться в організмі.

Особливі групи пацієнтів. У пацієнтів з порушеннями функцій печінки знижується швидкість виведення тіамазолу. У зв'язку з цим препарат рекомендується застосовувати у максимально низьких ефективних дозах, у період терапії препаратом необхідно проводити моніторинг стану пацієнта.

Пацієнтам з нирковою недостатністю рекомендується індивідуальне коригування дози і постійний моніторинг, оскільки недостатньо даних щодо фармакокінетичних властивостей препарату у цієї групи пацієнтів.

Пацієнтам літнього віку рекомендується індивідуальне коригування дози і постійний моніторинг, даних щодо накопичення препарату в організмі немає. Препарат рекомендується застосовувати у максимально низьких ефективних дозах.

Діти. Дану лікарську форму тіамазолу призначати дітям віком від 3 років. Рекомендації щодо дозування препарату дітям наведені у розділі «Спосіб застосування та дози».

Передозування. Передозування може призвести до розвитку гіпотиреозу і внаслідок ефекту нестачі гормонів – до активації аденогіпофіза з подальшим ростом зоба. У такому випадку слід відмінити препарат і, якщо необхідно, додатково призначити застосування тиреоїдних гормонів.

Побічні реакції.

З боку крові і лімфатичної системи: агранулоцитоз (може проявлятися через тижні або місяці після початку лікування, у більшості випадків зникає самостійно після припинення прийому препарату), тромбоцитопенія, панцитопенія, генералізована лімфаденопатія.

З боку ендокринної системи: інсуліновий аутоімунний синдром з різким зниженням концентрації глюкози у крові.

З боку нервової системи: порушення смакових відчуттів (дисгевзія, агеvзія), що самостійно минають після припинення прийому препарату (іноді смакові відчуття відновлюються через кілька тижнів після закінчення курсу лікування); неврити, полінейропатія, гарячка.

З боку травної системи: гостре запалення слинних залоз.

З боку гепатобіліарної системи: холестатична жовтяниця або токсичний гепатит. Симптоми, як правило, зникають після припинення прийому препарату. Клінічні малопомітні симптоми застою жовчі у період лікування слід відрізняти від дисфункцій, спричинених гіпертиреозом, таких як підвищення рівня γ -глутамілтрансферази і лужної фосфатази.

З боку шкіри: алергічні шкірні реакції (свербіж, висипання, кропив'янка), зазвичай помірного ступеня тяжкості, що зникають при подальшій терапії; тяжкі форми алергічних шкірних реакцій, включаючи генералізовані дерматити, алопецію, червоний вовчак, індукований лікарським засобом.

З боку кістково-м'язової системи: артралгія, що розвивається поступово і може виникати навіть через кілька місяців терапії.

Термін придатності. 5 років.

Умови зберігання. Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С.
Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка. Таблетки № 50, № 100 у контейнері в коробці; № 50 (10x5), № 100 (10x10) у блістерах.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. Товариство з обмеженою відповідальністю «Фармацевтична компанія «Здоров'я».

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.
Україна, 61013, Харківська обл., місто Харків, вулиця Шевченка, будинок 22.

Дата останнього перегляду.



Узгоджено з матеріалами
реєстраційного дос'є та достовірно
відомими даними щодо застосування
лікарського засобу

Узгоджено з матеріалами
реєстраційного дос'є та достовірно
відомими даними щодо застосування
лікарського засобу