

ТЕЗАРИН
TEZARIN

ТОРГОВОЕ НАЗВАНИЕ

Тезарин, Tezarin

МЕЖДУНАРОДНОЕ НЕПАТЕНТОВАННОЕ НАЗВАНИЕ

Левотироксин натрия, Levothyroxine sodium

ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки.

Описание: круглые двояковыпуклые таблетки белого цвета с надписью “LT” на одной стороне.

СОСТАВ

Таблетка содержит

Активное вещество: левотироксин натрия 25 мкг, 50 мкг или 100 мкг.

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, кукурузный крахмал, кроскармеллоза натрия, гипромеллоза, магния стеарат.

КОД ПРЕПАРАТА ПО АТХ H03AA01

ФАРМАКОТЕРАПЕВТИЧЕСКАЯ ГРУППА

Препараты для лечения щитовидной железы. Гормоны щитовидной железы.

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

ФАРМАКОДИНАМИКА

Синтетический левотироксин, содержащийся в препарате **Тезарин**, является идентичным тироксину, основному гормону, продуцируемому щитовидной железой. Он преращается в трийодтиронин в периферических органах и, подобно эндогенному гормону, оказывает свои эффекты на рецепторы трийодтиронина. Организм не в состоянии дифференцировать эндогенный и экзогенный левотироксин. Левотироксин оказывает влияние на развитие и рост тканей, обмен веществ. В малых дозах обладает анаболическим действием. В средних дозах стимулирует рост и развитие, повышает потребность тканей в кислороде, стимулирует метаболизм белков, жиров и углеводов, повышает функциональную активность сердечно-сосудистой и центральной нервной систем. В больших дозах угнетает выработку тиреотропин-рилизинг гормона гипоталамуса и тиреотропного гормона гипофиза.

ФАРМАКОКИНЕТИКА

При пероральном приеме препарата левотироксин всасывается в тонком кишечнике на 70-80% (при приеме натощак). Прием пищи снижает всасываемость левотироксина. Время достижения максимальной концентрации в сыворотке крови составляет 5-6 часов. Клинический эффект начинает проявляться на 3-5-ые сутки приема препарата. Связь с белками плазмы - 99,97%. Метаболизм происходит главным образом в печени, головном мозге и мышцах путем монодейодирования левотироксина с образованием трийодтиронина (Т₃) с более выраженным, чем у тироксина гормональным действием, и неактивных продуктов. В печени содержится около 1/3 поступившего в организм левотироксина, уровень которого может меняться, в зависимости от его концентрации в плазме крови. Период полувыведения (Т_{1/2}) составляет примерно 7 дней. При гипертиреоидизме период полувыведения короче (3-4 дня), и при гипотиреоидизме

длиннее (около 9-10 дней). Объем распределения составляет 10-12 л. Препарат выводится с мочой и калом. Метаболический клиренс составляет 1,2 л плазмы в сутки.

ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ

- эутиреоидный зоб;
- ювенальная микседема;
- в качестве заместительной терапии и для профилактики рецидива зоба после резекции щитовидной железы;
- в качестве заместительной терапии при раке щитовидной железы;
- в качестве заместительной терапии гипотиреоза;
- диффузный токсический зоб после достижения эутиреоидного состояния тиреостатиками (в качестве комбинированной терапии или монотерапии);
- в качестве диагностического средства при проведении теста тиреоидной супрессии.

СПОСОБ ПРИМЕНЕНИЯ И ДОЗЫ

Препарат показан молодым пациентам с отсутствием сердечно-сосудистых заболеваний с уровнем левотироксина (Т₄) в сыворотке от 70 до 160 нмоль/л или уровень тиреотропина в сыворотке менее чем 5 миллиединиц/л. Необходимо провести предварительное ЭКГ, поскольку изменения ЭКГ, связанные с гипотиреозом, могут быть перепутаны с признаками ишемии сердца. Если происходит слишком быстрое увеличение скорости метаболизма, причинами которого являются диарея, нервозность, частый пульс, бессонница, тремор, а иногда и ангинозные боли, при которых наблюдается скрытая сердечная аритмия, доза должна быть снижена или оставаться такой же в течение одного или двух дней, а затем возобновлена на более низком уровне дозы.

Таблетки принимают внутрь, утром, натощак, запивая небольшим количеством жидкости. Таблетки следует принимать регулярно. Если пропущен один прием таблеток, увеличивать дозу при последующем приеме таблеток не следует.

Показания	Рекомендованные дозы, мкг в сутки
Лечение эутиреоидного зоба	75-200
В качестве заместительной терапии и для профилактики рецидива зоба после резекции щитовидной железы	75-200
В качестве заместительной терапии гипотиреоза у взрослых	
- начальная доза	25-50
- поддерживающая доза	100-200
В качестве заместительной терапии гипотиреоза у детей	
- начальная доза	2,5-50
- поддерживающая доза	100-150 мкг/м ² поверхности тела
В качестве заместительной терапии во время приема тиреостатиков при гипертиреозидизме	50-10
В качестве заместительной терапии при раке щитовидной железы	150-300
Ювенальная микседема	25

В качестве диагностического средства при проведении теста тиреоидной супрессии		4 недели до теста	3 недели до теста	2 недели до теста	1 неделя до теста
	Тезарин 200 мкг	-	-	1 таблетка в сутки	1 таблетка в сутки
	100 мкг			2 таблетки в сутки	2 таблетки в сутки
	150 мкг	$\frac{1}{2}$ таблетки в сутки	$\frac{1}{2}$ таблетки в сутки	1 таблетка в сутки	1 таблетка в сутки

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

- повышенная чувствительность к левотироксину натрия или любым компонентам препарата;
- нелеченая надпочечниковая недостаточность, нелеченая гипофизарная недостаточность, нелеченый тиреотоксикоз;
- нельзя начинать терапию **Тезарином** при остром коронарном синдроме, остром миокардите и остром перикардите;
- комбинированная терапия левотироксином и антитиреоидными средствами при лечении гипертиреозидизма не показана во время беременности.

ПОБОЧНОЕ ДЕЙСТВИЕ

Побочные эффекты, как правило, свидетельствуют о чрезмерной дозе и обычно исчезают при снижении дозы или отмене лечения в течение нескольких дней.

Общие: головная боль, покраснение, жар и потливость.

Со стороны иммунной системы: реакции гиперчувствительности, включая сыпь, зуд, одышка, боли в суставах, недомогание и отек.

Со стороны метаболизма: потеря веса.

Со стороны нервной системы: тремор, беспокойство, возбудимость, бессонница. Редко - доброкачественная внутричерепная гипертензия у детей.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: ангинозная боль, сердечная аритмия, сердцебиение, тахикардия.

Со стороны желудочно-кишечного тракта: диарея, рвота.

Со стороны опорно-двигательного аппарата и соединительной ткани: мышечные спазмы, мышечная слабость, краниостеноз у младенцев и преждевременное закрытие эпифиза у детей.

Со стороны репродуктивной системы: нарушения менструального цикла.

Также сообщалось о непереносимости жары, временном выпадении волос у детей.

Некоторые пациенты могут испытывать тяжелую реакцию высоких уровней гормонов щитовидной железы. Это называется «кризис щитовидной железы» с любым из следующих симптомов: гиперпирексия, тахикардия, аритмия, артериальная гипотензия, сердечная недостаточность, желтуха, спутанность сознания, кома.

ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ

Пациенты с пангипопитуитаризмом или иными факторами, предрасполагающими к недостаточности надпочечников, могут демонстрировать реакцию на лечение левотироксином, поэтому рекомендуется начинать терапию кортикостероидами перед применением левотироксина у таких пациентов.

Необходимо соблюдать осторожность при применении левотироксина натрия у пациентов с сердечно-сосудистыми нарушениями, включая стенокардию, ишемическую болезнь сердца, гипертензию, и у пожилых пациентов с повышенной вероятностью скрытого заболевания сердца.

Рекомендуется провести ЭКГ перед началом лечения левотироксином, так как изменения, вызываемые гипотиреозом, могут быть перепутаны с признаками ишемии.

Лечение по восстановлению щитовидной железы может вызывать повышение необходимых доз инсулина или других противодиабетических средств (таких как метформин). Необходимо соблюдать осторожность при лечении пациентов с сахарным и несахарным диабетом.

Пациентам с редкими наследственными проблемами непереносимости галактозы, лактазной недостаточности Лаппа или мальабсорбции глюкозы-галактозы не следует принимать данный препарат.

Субклинический гипертиреозидизм может вызывать снижение костной массы. Для минимизации риска остеопороза дозировку левотироксина натрия следует снижать до минимального эффективного уровня.

Следует сообщать родителям детей, получающих препараты для лечения щитовидной железы, о возможности частичного выпадения волос в первые месяцы лечения, однако данный эффект, как правило, является проходящим, и волосы вновь отрастают.

ВЛИЯНИЕ НА СПОСОБНОСТЬ К ВОЖДЕНИЮ АВТОТРАНСПОРТА И УПРАВЛЕНИЮ МЕХАНИЗМАМИ

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

ПРИМЕНЕНИЕ ПРИ БЕРЕМЕННОСТИ И ЛАКТАЦИИ

Лечение левотироксином в период беременности и кормления грудью следует продолжить. Женщины с гипотиреозом, получающие поддерживающую дозу левотироксина, после наступления беременности должны находиться под наблюдением врача. Левотироксин переходит через гематоплацентарный барьер в первый триместр беременности и не переходит во второй и третий триместры. Препарат не рекомендуется применять одновременно с тиреостатическими средствами, которые проникают в плаценту и в результате этого могут вызвать у плода развитие гипопункции щитовидной железы. Относительно канцерогенных или тератогенных эффектов левотироксина информация отсутствует.

Минимальное количество левотироксина экскретируется в грудное молоко и может вызвать гипотиреоз у новорожденного ребенка. Считается, что в грудном молоке содержание гормона щитовидной железы недостаточно, чтобы обеспечить потребности новорожденного с нефункционирующей щитовидной железой.

ПРИМЕНЕНИЕ В ПЕДИАТРИИ

Препарат применяется в педиатрической практике.

ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ С ДРУГИМИ ЛЕКАРСТВЕННЫМИ СРЕДСТВАМИ

Взаимодействия с влиянием на другие препараты:

Левотироксин усиливает эффект антикоагулянтов (варфарина), что может требовать снижения дозы антикоагулянтов, если она является чрезмерной; также необходимо избегать гипопротромбинемии и кровотечения.

Ответ на трициклические антидепрессанты (например, амитриптилин, имипрамин, дозулепин) может наступать быстрее, так как левотироксин повышает чувствительность к катехоламинам; одновременное применение может вызывать аритмию сердца.

Эффект симпатомиметиков (например, адреналина или фенилэфрина) также усиливается.

В начале лечения левотироксином пациентов, принимающих препараты наперстянки, дозировка данных препаратов может требовать корректировки. Пациентам с гипертиреозом может потребоваться постепенная корректировка дозы дигоксина в ходе лечения, так как вначале пациенты являются относительно чувствительными к дигоксину.

Ложные низкие концентрации вещества в плазме крови наблюдались при одновременном противовоспалительном лечении, например фенилбутазоном или ацетилсалициловой кислотой, и при применении левотироксина.

Бета-блокаторы: левотироксин (тироксин) ускоряет метаболизм пропранолола, атенолола и соталола.

Имеются отдельные сообщения о выраженной гипертензии и тахикардии при одновременном применении кетамина.

Взаимодействия с влиянием на левотироксин:

Пропилтиоурацил, глюкокортикоиды, бета-симпатолитики, амиодарон и йодсодержащие контрастные средства могут ингибировать дейодинирование тироксина или трийодтиронина, вызывая снижение концентрации трийодтиронина, что приводит к ослаблению эффектов гормонов щитовидной железы.

Противосудорожные препараты, такие как карбамазепин и фенитоин, усиливают метаболизм гормонов щитовидной железы и могут вытеснять их из связи с белками плазмы крови.

Начало или прекращение терапии противосудорожными препаратами может изменять необходимую дозировку левотироксина.

Действие левотироксина может снижаться при одновременном применении сертралина. Абсорбция левотироксина (тироксина), вероятно, снижается под действием антацидов, ингибиторов протонного насоса, солей кальция, циметидина, пероральных препаратов железа, сукральфата, колестиопола, полистиролсульфонатной смолы и колестирамина (приемы должны быть раз-делены интервалами в 4-5 часов).

Метаболизм левотироксина (тироксина) ускоряется под действием рифампицина, барбитуратов и примидона (может повышаться потребность в левотироксине (тироксине) при гипотиреозидизме).

Имагиниб может снижать концентрации левотироксина (тироксина) в плазме крови.

Бета-блокаторы способны снижать периферическое преобразование левотироксина в трийодтиронин. Эстроген, эстроген-содержащие продукты (включая гормонозаместительную терапию) и пероральные контрацептивы могут повышать потребность в препаратах для лечения щитовидной железы. Андрогены и кортикостероиды, напротив, способны снижать концентрации левотироксин-связывающих глобулинов в сыворотке крови.

Ряд лекарственных средств могут негативно влиять на результаты исследования функции щитовидной железы; об этом необходимо помнить при мониторинге пациентов, получающих левотироксин.

ПЕРЕДОЗИРОВКА

Симптомы тяжелой передозировки: тиреотоксический криз с коллапсом и комой, иногда отсроченный на несколько дней после приема.

Другие симптомы: боль в грудной клетке, диарея, тахикардия, аритмия, лихорадка, тремор, головная боль, раздражительность, судороги мышц нижних конечностей, нервозность, повышенное потоотделение, рвота.

Лечение: назначение бета-адреноблокаторов, внутривенное введение глюкокортикостероидов, плазмаферез.

ФОРМА ВЫПУСКА

Тезарин 25 мкг или 50 мкг:

Таблетки.

10 таблеток в блистере. 5 блистеров вместе с листком-вкладышем в картонной коробке.

25 таблеток в блистере. 2 блистера вместе с листком-вкладышем в картонной коробке.

Тезарин 100 мкг:

Таблетки.

10 таблеток в блистере. 5 блистеров вместе с листком-вкладышем в картонной коробке.

25 таблеток в блистере. 2 блистера вместе с листком-вкладышем в картонной коробке.

25 таблеток в блистере. 4 блистера вместе с листком-вкладышем в картонной коробке.

УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ

Хранить в защищенном от света месте при температуре не выше 25°C.

Хранить в недоступном для детей месте!

СРОК ГОДНОСТИ

2 года от даты производства.

Не применять по истечении срока годности.

УСЛОВИЯ ОТПУСКА ИЗ АПТЕК

Отпускается без рецепта.