

Кратка характеристика на продукта

PROPYCİL® /ПРОПИЦИЛ

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Propycil® 50, таблетки по 50 mg

2. Количествен и качествен състав

Активна съставка: *propylthiouracil*

Всяка таблетка съдържа 50 mg *propylthiouracil*.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Таблетки

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Показания

Propycil® се използва за лечение на хипертироидизъм при:

- Базедова болест (болест на Grave)
- Автоимунен токсичен аденом на щитовидната жлеза
- При подготовка за тироидектомия
- Терапия с радиоактивен йод при хипертироидизъм

4.2 Дозировка и начин на приложение

А. Дозировка

• Новородени:

Начална дозировка:

5 до 10 mg/kg телесно тегло дневно, разпределена в три приема.

При липса на ефект от лечението се препоръчва повишаване на дозировката с 50 - 100%.

Поддържаща дозировка:

3 до 4 mg/kg телесно тегло дневно.

Спонтанно преминаване на хипертироидизма, кореспондиращо на полуживота на майчините имуноглобулини, може да се очаква след 2 до 3 месеца.

• Деца от 6 до 10 години:

Начална дозировка:

50 до 150 mg (1 до 3 таблетки) дневно

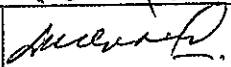
Поддържаща дозировка:

около 25 до 50 mg (до 1 таблетка) дневно

• Деца над 10 години и възрастни:

Начална дозировка:

3 пъти по 75 до 100 mg (1 до 2 таблетки) дневно.

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО	
Приложение към разрешение за употреба № 11-6346/20-11.02	
627/22.10.2002	



При тежки случаи и след йодна контаминация се препоръчват по-високи начални дозировки от 300 до 600 mg (6 - 12 таблетки дневно разпределени в 4 до 6 приема).

Поддържаща дозировка:
от 25 до 150 mg (до 3 таблетки) дневно.

Б. Продължителност на лечението

Продължителността на лечение е индивидуална!

Опитът с **Propycil**® е показал, че лечението на хипертироидизма при Базедова болест и аутоимунен токсичен аденом, трябва да продължи най-малко една година!

При предоперативна подготовка или терапия с радиоактивен йод продължителността на лечение трябва да се съобрази с индивидуалните нужди на пациента.

В. Общи препоръки

- При пациенти с бъбречна недостатъчност и такива на хемодиализа, не се налага промяна на дозировката, според досегашните познания
- При пациенти с чернодробни заболявания се прилага обичайната дозировка, като се имат предвид относителните противопоказания
- По правило таблетките **Propycil**® се прилагат на всеки 6 до 8 часа
- Таблетките трябва да се гълтат цели, без да се дъвчат, с достатъчно количество течност

4.3 Противопоказания

Propycil® е противопоказан при пациенти с анамнеза за сериозни нежелани лекарствени реакции, свързани с лечение с *propylthiouracil* (особено след агранулоцитоза и тежко увреждане на черния дроб след хепатит).

Propycil® трябва да се прилага само под строг лекарски контрол, когато са налице отклонения в кръвните показатели и повишение на трансаминазите или ензимите на холестазата.

4.4 Специални предупреждения и специални указания за употреба

Агранулоцитозата може да се развие за няколко часа.

Пациентът трябва да бъде информиран за нейните признаци (втрисане, прилошаване, тонзиларна ангина, стоматит) и за необходимостта от незабавно изследване на кръвната картина.

За предотвратяване на предозиране по време на лечението с анти tiroидни средства, е необходимо редовно проследяване на функцията на щитовидната жлеза (изследване на тироидните хормони и TSH).

Лечението с анти tiroидни средства води до образуване на струма или увеличаване на съществуваща струма, ако прилаганата дозировка е твърде висока. Това трябва



да се има предвид особено, ако струмата е разположена интраторакално, тъй като се ангажира и медиастинума.

Препоръчва се рутинно проследяване на пълната кръвна картина, трансaminaзите и ензимите, характерни за настъпваща холестаза.

4.5 Лекарствени и други взаимодействия

Едновременното приложение на **Propycil**[®] с:

- Тироксин: намалява захвата на *propylthiouracil* в щитовидната жлеза и налага по-изразено потискане на естествения синтез на хормони. Следователно за получаване на сравним ефект на потискане на щитовидната жлеза е необходима по-голяма доза *propylthiouracil*.

Антитироидната активност на **Propycil**[®] може да бъде понижена от:

- едновременното приложение с йод
- предварителна контаминация с йод-съдържащи медикаменти
- контраст за рентгенови изследвания.

Постигането на еотироидно състояние може да се забави значително.

Лечението с *propylthiouracil* може да повлияе несвързаната ефективна фракция на:

- пропранолол и кумариновите производни така, че да се наложи промяна на дозировката.

4.6 Бременност и кърмене

Хипертироидизмът при майката по време на бременност се свързва с по-чести аборти, мъртво родени деца и малформации.

Хипотироидизмът при майката е също свързан с повишена честота на аборти. Степента на поява на малформации, наблюдавани при лечение с *thiouracil*, не се различава от спонтанната поява на малформации.

Производството на фетален хормон започва през 10-та до 14-та седмица от бременността. Дозировката на антитироидните препарати трябва да бъде възможно най-ниска, за да се предотврати аборт и хипотироидизъм и струма при плода. В последния триместър хипертироидното състояние обикновено преминава спонтанно. Едно леко състояние на хипертироидизъм се понася по-добре от бременната жена, отколкото хипотироидното.

Следователно, по време на бременност при лечение с антитироидни средства, е необходимо внимателно проследяване на пациентката. Параметрите на несвързаните тироидни хормони трябва да бъдат на горната граница на нормата, а стойностите на TSH съвсем ниски или недоловими. **Propycil**[®] се счита за средство на избор по време на лактация, тъй като концентрацията му в кърмата е само една десета от серумната концентрация на майката. Несъмнено новороденото трябва да се проследява внимателно, тъй като има единични съобщения за хипотироидни състояния. Комбинирането на **Propycil**[®] с тироксин по време на бременност и кърмене се счита за остаряло.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Не са наблюдавани.



4.8. Нежелани лекарствени реакции

Често се наблюдава неутропения без клинично значение.

Рядко се съобщава за агранулоцитоза, придружена от тежки септични усложнения.

Понякога се наблюдават: кожен обрив, уртикария, болки в стомаха, артралгии без признаци на възпаление в ставите; образуване на струма (при новородени).

В много редки случаи и особено при по-високи дозировки се наблюдават следните нежелани реакции:

- увреждане на черния дроб (хепатитоподобни реакции с хепатоцелуларна некроза, преходна холестаза)
- реакции на свръхчувствителност
- втрисане, причинено от приема на медикамента
- лимфаденопатия
- тромбопения

В единични случаи се съобщава за:

вкусови и обонятелни нарушения, гастроинтестинални смущения (гадене, повръщане), невро-мускулни нарушения, полиартрит, васкулит, лупус-подобен синдром, периартритис нодоза, замайване, нарушения в еритропоезата, хемолитиза, позитивен тест на Coombs, интерстициална пневмония, периферен оток и абнормен косопад.

Propusil® може да доведе до увеличаване на струмата.

4.9. Предозиране

Симптоми на интоксикация:

Няма съобщения за случаи на остра интоксикация с propylthiouracil.

Хроничното предозиране води до поява на гуша и състояние на хипотирозидизъм, като симптомите, свързани със степента на хипотирозидното състояние, зависят от специфичното действие на антитироидните средства.

Антидоти и спешни мерки:

Не са известни специални антидоти и спешни мерки.

Стомашната промивка и ендоскопското отстраняване на остатъчните таблетки са с несигурен ефект, поради бързата им резорбция.

При поява на струма и хипотирозидно състояние (със симптоми, съответни на степента на хипотирозидното състояние), поради хронично предозиране, лечението с **Propusil®** трябва да бъде преустановено.

В случаите, когато тежестта на хипотирозидизма или струмата налагат субституираща терапия, може да се включи и тироксин.

По правило, може да се изчака спонтанно възстановяване на функцията на щитовидната жлеза, след разпадането на propylthiouracil.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ ДАННИ

5.1 Фармакодинамични свойства

Тиоурацилите действат като антитироидни средства чрез инхибиране на интратироидните пероксидазни системи. Те намаляват съединяването на йод в тиреоглобулина и следователно инхибират продукцията на тироксин. Съществува също и инхибиране на съединените вече тирозилови остатъци в молекулите на тироглобулина.



Propylthiouracil е причина за йодното изчерпване в щитовидната жлеза. Превръщането на тироксин в трийодтиронин в периферните тъкани се намалява от *propylthiouracil*.

5.2 Фармакокинетични свойства

Propylthiouracil се абсорбира добре след перорално приложение с достигане на пикова плазмена концентрация 1 до 2 часа след поглъщане.

Антитироидните средства се концентрират в щитовидната жлеза чрез активен транспорт. Въпреки, че в серума не може да се открие *propylthiouracil* 8 часа след приложението му, продължителността на действие след по-висока единична дозировка е около 6 до 8 часа, което се дължи на изразеното кумулиране в щитовидната жлеза.

Бионаличността след орално приложение е около 80%.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Остра токсичност:

LD₅₀ на *Propylthiouracil* при мъжки плъхове е 1.98 g/kg телесно тегло, след орален прием.

Токсичност на повторно дозиране:

В изследванията на подострата токсичност при плъхове с различни методи на приложение са наблюдавани дозо-зависими токсични ефекти като намаляване нарастването на теглото, хиперплазия на щитовидната жлеза, левкопения и хепатомегалия.

Мутагенно и канцерогенно действие:

Мутагенното действие на *propylthiouracil* не е добре изяснено.

В изследвания при животни от различни видове след орално приложение е регистрирана повишена поява на тумори на щитовидната жлеза, както и хипотрофия.

Наблюдаван е подчертан ефект в комбинация с известни канцерогенни вещества. Появата на тумори след противотиреоидно лечение с *propylthiouracil* не може да бъде доказана при хора.

Репродуктивна токсичност:

При опити с плъхове в поведението на потомството са наблюдавани ендокринни и неврологични аномалии, въпреки свръх-фармакодинамичните ефекти (перинатална хипотиреоза с нормохромна анемия).

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на ексципиентите и техните количества

Lactose-monohydrate	72.5 mg
Maize starch	50 mg
Colloidal silicon dioxide	1.5 mg
Povidone K 30	4 mg
Pregelatinized starch	10 mg



Magnesium stearate

2 mg

6.2 Физико-химични несъвместимости

Не са известни.

6.3 Срок на годност

3 години

6.4 Специални условия за съхранение

Да се съхранява на недостъпни за деца места!

6.5 Данни за опаковката

Съгледена бутилка със 100 таблетки и пластмасова запушалка, в картонена кутия,

6.6 Препоръки за употреба

Виж: т. 4.2

7. ИМЕ И АДРЕС НА ПРОИЗВОДИТЕЛЯ

Solvay Pharmaceuticals GmbH
Hans-Böckler-Allee 20
30173 Hannover / Germany
Тел.: 0511 857 0

“Солвей Фарма ЕООД”

1680 София
ул. Хайдушка гора № 48А

8. СТРАНИ, В КОИТО ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ Е РЕГИСТРИРАНО

Германия, Русия, Чехия, Полша, Унгария и др.

10. ПЪРВА РЕГИСТРАЦИЯ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Германия, 1973 г.

11. ДАТА НА ПОСЛЕДНА РЕДАКЦИЯ НА ТЕКСТА

м. ноември, 1999

