Галоперидол-Рихтер

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Галоперидол

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН]
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Раствор для в/в и в/м введения бесцветный или слегка желтоватый, прозрачный.

	1 амп.
галоперидол	5 мг

Вспомогательные вещества: молочная кислота, вода д/и.

1 мл - ампулы бесцветного стекла (5) - упаковки контурные пластиковые (1) - пачки картонные.

Таблетки белого или почти белого цвета, плоские, круглые, с фаской, практически без запаха, с гравировкой "I|I" на одной стороне.

	1 таб.
галоперидол	1.5 мг

Вспомогательные вещества: крахмал картофельный, кремния диоксид коллоидный, желатин, магния стеарат, тальк, крахмал кукурузный, лактозы моногидрат.

25 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Таблетки белого или почти белого цвета, плоские, дискообразные, без маркировки, практически без запаха.

	1 таб.
галоперидол	5 мг

Вспомогательные вещества: крахмал картофельный, кремния диоксид коллоидный, желатин, магния стеарат, тальк, крахмал кукурузный, лактозы моногидрат.

25 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Галоперидол - нейролептик, принадлежащий к производным бутирофенона. Оказывает выраженный антипсихотический и противорвотный эффект. Действие галоперидола связано с блокадой центральных допаминовых (D_2) и α-адренергических рецепторов в мезокортикальных и лимбических структурах головного мозга. Блокада D_2-рецепторов гипоталамуса ведет к снижению температуры тела, галакторее (повышение выработки пролактина). Угнетение дофаминовых рецепторов в триггерной зоне рвотного центра лежит в основе противорвотного действия. Взаимодействие с дофаминергическими структурами экстрапирамидной системы может приводить к экстрапирамидным нарушениям. Выраженная антипсихотическая активность сочетается с умеренным седативным эффектом (в небольших дозах оказывает активирующее действие). Усиливает действие снотворных, наркотических анальгетиков, средств для общей анестезии, анальгетиков и других средств угнетающих функцию ЦНС.

Фармакокинетика

Всасывается путем пассивной диффузии, в неионизированной форме, главным образом, из тонкого кишечника. Биодоступность - 60-70%. При пероральном применении C_{max} в крови достигаются через 2-6 ч, при в/м - через 20 мин. Терапевтический эффект наступает при плазменной концентрации 20-25 мг/л. V_d большой, 7.9±2.5 л/кг. Связь с белками крови - 92%. Галоперидол метаболизируется в печени, метаболит фармакологически неактивен. Также галоперидол подвергается окислительному N-деалкилированию и глюкуронированию. $T_{1/2}$ из плазмы после перорального приема - 24 ч (12-38 ч), после в/м введения - 21 ч (13-36 ч), после в/в - 14 ч (10-19 ч). Выводится в виде метаболитов через кишечник - 60% (в т.ч. с желчью - 15%), почками - 40%, (в т.ч. 1% - в неизмененном виде). Легко проникает через гистогематические барьеры, в т.ч. через плацентарный и гематоэнцефалический, проникает в грудное молоко.

Показания к применению:

— острые и хронические психозы, сопровождающиеся возбуждением, галлюцинаторными и бредовыми расстройствами, (шизофрения, аффективные расстройства, психосоматические расстройства);

— расстройства поведения, изменения личности (параноидные, шизоидные и другие), в т.ч. и в детском возрасте, аутизм, синдром Жиль де ля Туретта;

— тики, хорея Геттингтона;

— длительно сохраняющаяся и неподдающаяся терапии икота;

— рвота, не поддающаяся лечению классическими противорвотными средствами, в том числе связанная с противоопухолевой терапией;

— премедикация перед оперативным вмешательством.

Относится к болезням:

- Рвота
- Тики
- Хорея
- Шизофрения

Противопоказания:

— угнетение ЦНС, в т.ч. и тяжелое токсическое угнетение функции ЦНС, вызванное ксенобиотиками, комы различного генеза;

— заболевания ЦНС, сопровождающиеся пирамидными и экстрапирамидными расстройствами (болезнь Паркинсона);

— поражения базальных ганглиев;

— детский возраст до 3-х лет;

— депрессия;

— повышенная чувствительность к производным бутирофенона;

— повышенная чувствительность к ингредиентам препарата.

Следует соблюдать *осторожность* при декомпенсированных сердечно-сосудистых заболеваниях (в т.ч. стенокардии); при нарушении проводимости сердечной мышцы; при тяжелых заболеваниях почек, печени; легочно-сердечной недостаточности (в т.ч. при бронхиальной астме и острых инфекциях); эпилепсии; судорожных состояниях в анамнезе; закрытоугольной глаукоме; гипертиреозе (тиреотоксикозе); гиперплазии предстательной железы (задержке мочи), активном алкоголизме.

Способ применения и дозы:

Дозировка зависит от клинической реакции больного. Чаще всего, это означает постепенное повышение дозы в острой фазе заболевания, в случае поддерживающих доз - постепенное снижение дозы, чтобы обеспечить наименьшую эффективную дозу. Высокие дозы применяют лишь в случаях неэффективности меньших доз. Ниже предлагаются средние дозы.

Раствор для в/в и в/м введения

Для *купирования психомоторного возбуждения* в первые дни галоперидол назначают в/м по 2.5-5 мг 2-3 раза/сут, либо в/в в той же дозировке (ампулу следует развести в 10-15 мл воды для инъекций), максимальная суточная доза - 60 мг. По достижении устойчивого седативного эффекта переходят на прием препарата внутрь.

Для **пациентов пожилого возраста:** 0.5 – 1.5 мг (0.1-0.3 мл раствора), максимальная суточная доза - 5 мг (1 мл раствора).

Для **детей старше 3-х лет** доза составляет 0.025-0.05 мг/сут, распределенная на 2 введения. Максимальная суточная доза - 0.15 мг/кг.

Парентеральный способ введения галоперидола должен проводиться под тщательным контролем врача, особенно у **пожилых пациентов и детей.** После достижения терапевтического эффекта следует перейти на прием препарата внутрь.

Таблетки

Назначают внутрь, за 30 мин до еды (можно с молоком для уменьшения раздражающего действия на слизистую желудка).

Начальная суточная доза составляет 1.5-5 мг, разделенная на 2-3 приема. Затем дозу постепенно увеличивают на 1.5-3 мг (в резистентных случаях до 5 мг), до достижения необходимого терапевтического эффекта. Максимальная суточная доза - 100 мг. В среднем терапевтическая доза составляет 10-15 мг/сут, при *хронических формах шизофрении* - 20-40 мг/сут, в случае необходимости дозу можно увеличить до 50-60 мг/сут. В среднем продолжительность курса лечения - 2-3 мес. Поддерживающие дозы (вне обострения) - от 0.5-0.75 мг до 5 мг/сут (дозу снижают постепенно).

Детям в возрасте 3-12 лет (с массой тела 15-40 кг): 0.025-0.05 мг/кг массы тела/сут 2-3 раза/сут, повышая дозу не чаще чем 1 раз в 5-7 дней, до суточной дозы 0.15 мг/кг.

При *нарушениях поведения, синдроме Туретта:* 0.05 мг/кг/сут, разделив на 2-3 приема и повышая дозу не чаще, чем 1 раз в 5-7 дней до 3 мг/сут. При *аутизме* - 0.025-0.05 мг/кг/сут.

Больным пожилого возраста и ослабленным больным назначают 1/3-1/2 обычной дозы для **взрослых**, дозу увеличивают не чаще, чем каждые 2-3 дня.

В *качестве противорвотного средства* назначают внутрь по 1.5-2.5 мг.

Побочное действие:

При низких суточных дозах (в среднем до 3-5 мг) галоперидол, обычно, хорошо переносится, побочные эффекты носят невыраженный характер. При более высоких дозах, побочные действия развиваются чаще. Наиболее часты реакции со стороны нервной системы.

Со стороны ЦНС: экстрапирамидные расстройства разной степени выраженности. У большинства больных отмечаются преходящий акинето-ригидный синдром, окулогирные кризы, акатизия, дистонические явления.

Возможно развитие злокачественного нейролептического синдрома (НЗС), одним из первых признаков которого является повышение температуры тела.

Состояние беспокойства, тревога, возбуждение, депрессия, приступы эпилепсии, развитие парадоксальной реакции - обострение психотических расстройств.

При длительном приёме галоперидола возможно развитие поздних дискинезий, особенно у пожилых пациентов и пациентов с органической недостаточностью ЦНС, поэтому дозы препарата для этой категории больных должны

быть снижены.

В начале терапии может наблюдаться вялость, сонливость или бессонница, головная боль, проходящие после назначения корректоров (противопаркинсонических средств).

Со стороны сердечно-сосудистой системы: аритмии, тахикардия, при использовании высоких доз - снижение АД; ортостатическая гипотензия, лабильность АД; очень редко - изменения со стороны ЭКГ (удлинение интервала QT, признаки трепетания и мерцания желудочков при высоких дозах и в случае наличия предрасположенности).

Со стороны органов кроветворения: транзиторная лейкопения или лейкоцитоз, эритропения, лимфомоноцитоз, редко - агранулоцитоз.

Дерматологические реакции: аллергические реакции, сыпь, токсикодермия, сухость кожи, фотосенсибилизация, гиперфункция сальных желез.

Со стороны пищеварительной системы: анорексия, диспепсия, сухость во рту, иногда гиперсаливация, тошнота, рвота, запор, диарея, повышение активности печеночных трансаминаз, желтуха.

Со стороны эндокринной системы: дисменорея, фригидность, гинекомастия, боли в грудных железах, галакторея, импотенция, усиление либидо, приапизм, увеличение массы тела.

Со стороны мочевыделительной системы: задержка мочи (например, при гиперплазии предстательной железы), периферические отеки.

Прочие: повышенная утомляемость, пониженное чувство жажды, тепловой удар, алопеция, гипонатриемия, гипер- или гипогликемия.

Передозировка:

При передозировке препарата возможно появление острых нейролептических реакций.

Симптомы: ригидность мышц, тремор, сонливость, снижение, иногда повышение артериального давления, в тяжелых случаях - коматозное состояние, угнетение дыхания, шок, удлинение интервала QTc вентрикулярной аритмией.

Особо должно настораживать повышение температуры тела, которое может быть одним из симптомов злокачественного нейролептического синдрома. В тяжелых случаях передозировки могут наблюдаться различные формы нарушения сознания, вплоть до комы, судорожные реакции.

Лечение: прекращение терапии нейролептиками, при приеме внутрь - на фоне поддерживающей терапии промывание желудка, активированный уголь, если сознание не затемнено и нет комы, судорог. При угнетении дыхания может потребоваться искусственная вентиляция легких. При гипотонии и коллапсе – в/в, для поддержания кровообращения вводят плазму или концентрированный альбумин, дофамин или норэпинефрин в качестве вызопрессора. Эпинефрин в этих случаях применять категорически запрещается, так как может спровоцировать эстремальную гипотонию! Для купирования экстрапирамидных симптомов - центральные противопаркинсонические препараты антихолинергического действия (например, 1-2 мг мезилата бензтропина в/в или в/м). Их отмену следует проводить с осторожностью. В/в вводят диазепам, раствора глюкозы, ноотропы, витамины группы В и С. Диализ неэффективен. Специфического антидота нет.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Галоперидол не вызывает значительного увеличения числа случаев врожденных пороков развития. Известны отдельные случаи врожденных дефектов при приеме галоперидола одновременно с другими лекарственными препаратами при беременности. Прием галоперидола при беременности допустим лишь в случаях, когда предполагаемая польза для матери превышает риск для плода. Галоперидол выделяется с грудным молоком. В случаях, когда прием галоперидола неизбежен, преимущества грудного вскармливания по отношению к потенциальной опасности должны быть оправданы. В некоторых случаях наблюдались эстрапирамидальные симптомы у новорожденных, матери которых принимали галоперидол в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Галоперидол усиливает угнетающее воздействие опиоидных анальгетиков, снотворных средств, трициклических антидепрессантов, средств для общей анестезии, алкоголя на ЦНС.

При одновременном применении с противопаркинсоническими препаратами (леводопа и др.) может снижаться терапевтическое действие этих средств из-за антагонистического влияния на дофаминергические структуры.

При применении с метилдопой возможно развитие дезориентации, затруднения и замедления процессов мышления.

Галоперидол может ослаблять действие адреналина (эпинефрина) и других симпатомиметиков, вызывать "парадоксальное" снижение АД и тахикардию при их совместном применении.

Усиливает действие периферических М-холиноблокаторов и большинства гипотензивных средств (снижает действие гуанетидина вследствие вытеснения его из α-адренергических нейронов и подавления его захвата этими нейронами).

При комбинированном приеме с противосудорожньгми средствами (включая барбитураты и другие индукторы микросомального окисления), дозы последних следует повысить, т.к. галоперидол снижает порог судорожной активности; кроме того, могут снижаться и сывороточные концентрации галоперидола. В частности, при одновременном употреблении чая или кофе действие галоперидола может ослабевать.

Галоперидол может снижать эффективность непрямых антикоагулянтов, поэтому при совместном приеме дозу последних следует корректировать.

Галоперидол замедляет метаболизм трициклических антидепрессантов и ингибиторов МАО, вследствие чего увеличивается их уровень в плазме и повышается токсичность.

При одновременном применении с бупропионом снижает эпилептический порог и увеличивает риск возникновения эпилептических припадков.

При одновременном приеме галоперидола с флуоксетином возрастает риск побочного действия на ЦНС, особенно экстрапирамидных реакций.

При одновременном назначении с литием, особенно в высоких дозах, может вызывать необратимую нейроинтоксикацию, а также усиливать экстрапирамидную симптоматику.

При одновременном приеме с амфетаминами снижается антипсихотический эффект галоперидола и психостимулирующий эффект амфетаминов вследствии блокады галоперидолом α-адренергических рецепторов.

Галоперидол может снижать действие бромокриптина.

Антихолинергические, антигистаминные (1 поколения), противопаркинсонные средства могут усиливать антихолинергические побочные эффекты и снижать антипсихотический эффект галоперидола.

Тироксин может усиливать токсичность галоперидола. При гипертиреозе галоперидол можно назначать лишь при одновременном проведении соответствующей тиреостатической терапии.

При одновременном применении с антихолинергическими препаратами возможно повышение внутриглазного давления.

Особые указания и меры предосторожности:

Парентеральное введение должно проводиться под строгим контролем врача, особенно, в случае больных пожилого и детского возраста. По достижении терапевтического эффекта следует перейти на пероральную форму лечения.

Поскольку галоперидол может вызывать удлинение интервала QT, следует соблюдать осторожность при наличии риска пролонгирования QT(синдром QT, гипокалиемия, препараты, вызывающие удлинение интервала QT), особенно при парентеральном введении. В связи с метаболизмом галоперидола в печени, важно проявлять осторожность при назначении его больным с нарушением печеночной функции.

Известны случаи развития судорог, вызванных галоперидолом. Больным эпилепсией и больным, в состояниях, предрасполагающих к развитию судорожного синдрома (алкоголизм, травма головного мозга), препарат следует применять с особой осторожностью.

При непереносимости лактозы следует учитывать, что таблетка 1.5 мг содержит 157 мг лактозы, таблетка 5 мг -153.5 мг.

При тяжелой физической нагрузке, принятии горячей ванны требуется соблюдать осторожность из-за возможного развития теплового удара в результате неэффективной центральной и периферической терморегуляции гипоталамуса вследствие приема препарата.

Следует предупредить больного о необходимости избегать приема лекарственных препаратов против простудных заболеваний, приобретаемых без рецепта, т.к. возможно усиление антихолинергических эффектов галоперидола и развитие теплового удара. Во время лечения больным следует регулярно осуществлять мониторинг ЭКГ, формулы крови, печеночных проб.

Для купирования экстрапирамидных расстройств назначают антипаркинсонические средства (циклодол), ноотропы, витамины; их применение продолжают и после отмены галоперидола, если они выводятся из организма быстрее, чем галоперидол во избежание усиления экстрапирамидных симптомов.

Выраженность экстрапирамидных расстройств связана с дозой, часто, при снижении дозы они могут уменьшаться или исчезать.

В ряде случаев признаки неврологических расстройств наблюдаются при отмене препарата, после длительного курса лечения, поэтому галоперидол следует отменять, постепенно снижая дозы.

При развитии поздней дискинезии не следует резко отменять препарат; рекомендуется постепенное снижение дозы.

Следует защищать открытые участки кожи от избыточного солнечного света из-за повышенного в таких случаях риска фотосенсибилизации.

Противорвотное действие галоперидола может маскировать признаки лекарственной токсичности и затруднять диагностику состояний, первым симптомом которых является тошнота.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Во время приема галоперидола запрещается вождение транспортных средств, обслуживание механизмов и выполнение других видов работ, требующих повышенной концентрации внимания, а так же прием алкоголя.

При нарушениях функции почек

Следует соблюдать *осторожность* при тяжелых заболеваниях почек.

При нарушениях функции печени

Следует соблюдать *осторожность* при тяжелых заболеваниях печени.

Применение в пожилом возрасте

Раствор для в/в и в/м введения

Для **пациентов пожилого возраста:** 0.5 – 1.5мг (0.1-0.3 мл раствора), максимальная суточная доза - 5 мг (1 мл раствора).

Парентеральный способ введения галоперидола должен проводиться под тщательным контролем врача, особенно у **пожилых пациентов.** После достижения терапевтического эффекта следует перейти на прием препарата внутрь.

Таблетки

Больным пожилого возраста и ослабленным больным назначают 1/3-1/2 обычной дозы для **взрослых**, дозу увеличивают не чаще, чем каждые 2-3 дня.

При длительном приёме галоперидола возможно развитие поздних дискинезий, особенно у пожилых пациентов и пациентов с органической недостаточностью ЦНС, поэтому дозы препарата для этой категории больных должны быть снижены.

Применение в детском возрасте

Противопоказан детям до 3 лет.

Раствор для в/в и в/м введения

Для **детей старше 3-х лет** доза составляет 0.025-0.05 мг/сут, распределенная на 2 введения. Максимальная суточная доза - 0.15 мг/кг.

Парентеральный способ введения галоперидола должен проводиться под тщательным контролем врача, особенно у **детей.** После достижения терапевтического эффекта следует перейти на прием препарата внутрь.

Таблетки

Детям в возрасте 3-12 лет (с массой тела 15-40 кг): 0.025-0.05 мг/кг массы тела/сут 2-3 раза/сут, повышая дозу не чаще чем 1 раз в 5-7 дней, до суточной дозы 0.15 мг/кг.

При *нарушениях поведения, синдроме Туретта:* 0.05 мг/кг/сут, разделив на 2-3 приема и повышая дозу не чаще, чем 1 раз в 5-7 дней до 3 мг/сут. При *аутизме* - 0.025-0.05 мг/кг/сут.

Условия хранения:

Галоперидол таблетки 1.5 мг: хранить при температуре 15-30°С, в недоступном для детей месте.

Галоперидол таблетки 5 мг: хранить при температуре 15-30°С, в недоступном для детей месте.

Галоперидол раствор для в/в и в/м введения: хранить при температуре 15-30°С, в защищенном от света, недоступном для детей месте.

Срок годности:

5 лет.

Не применять препарат по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Galoperidol-Rihter