Галоперидол-ратиофарм



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Галоперидол

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Капли для приема внутрь в виде прозрачного, бесцветного раствора.

	1 мл
галоперидол	2 мг

Вспомогательные вещества: метилпарагидроксибензоат - 90 мг, пропилпарагидроксибензоат - 10 мг, молочная кислота - 170 мг, вода очищенная - 99.7 г.

30 мл - флакон-капельницы темного стекла (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антипсихотическое средство (нейролептик), производное бутирофенона. Обладает выраженным антипсихотическим действием, блокирует постсинаптические допаминовые рецепторы в мезолимбических и мезокортикальных структурах головного мозга. Тормозит высвобождение медиаторов, снижая проницаемость пресинаптических мембран. Высокая антипсихотическая активность сочетается с умеренным седативным эффектом (в небольших дозах оказывает активирующее действие) и выраженным противорвотным действием. Вызывает экстрапирамидные расстройства, практически не оказывает холиноблокирующего действия.

Седативное действие обусловлено блокадой α-адренорецепторов ретикулярной формации ствола головного мозга; противорвотное действие - блокадой допаминовых D2-рецепторов триггерной зоны рвотного центра; гипотермическое действие и галакторея - блокадой допаминовых рецепторов гипоталамуса. Длительный прием сопровождается изменением эндокринного статуса, в передней доле гипофиза увеличивается продукция пролактина и снижается - гонадотропных гормонов.

Устраняет стойкие изменения личности, бред, галлюцинации, мании, усиливает интерес к окружающему.

Фармакокинетика

Абсорбция при приеме внутрь - 60%. C_{max} в плазме достигается при приеме внутрь через 3 ч, после в/м введения -10-20 мин. V_d - 15-35 л/кг. Связывание с белками плазмы крови - 92%. Легко проходит через гистогематические барьеры, включая гематоэнцефалический барьер. Проникает в грудное молоко.

Метаболизируется в печени, подвергается эффекту "первого прохождения" через печень. Метаболизм галоперидола

ускоряется фермент-индуцирующими веществами (фенобарбитал, фенитоин и карбамазепин). В метаболизме галоперидола принимают участие изоферменты CYP2D6, CYP3A3, CYP3A5, CYP3A7. Является ингибитором CYP2D6. Активных метаболитов нет.

$T_{1/2}$ при приеме внутрь - 24 ч (12-37 ч). Выводится с желчью и мочой: после приема внутрь с желчью выводится 15%, с мочой - 40% (в т.ч. 1% - в неизмененном виде).

Из-за большого V_d и низкой концентрации в плазме крови только очень малое количество галоперидола удаляется диализом.

Показания к применению:

— острые психотические синдромы, сопровождающиеся бредом, галлюцинациями, расстройствами мышления и сознания, кататонические синдромы, делириозные и прочие экзогенные психотические синдромы;

— хронические эндогенные и экзогенные психозы (подавление симптомов и профилактика рецидивов);

— психомоторное возбуждение;

— рвота, заикание, при невозможности проведения иной терапии или устойчивости к лечению.

Относится к болезням:

- Заикание
- Рвота

Противопоказания:

— кома различного генеза;

— дети в возрасте до 3 лет;

— беременность;

— период лактации;

— тяжелое угнетение функции ЦНС на фоне интоксикации ксенобиотиками;

— заболевания ЦНС, сопровождающиеся пирамидной или экстрапирамидной симптоматикой (в т.ч. болезнь Паркинсона);

— повышенная чувствительность к галоперидолу и/или другим производным бутирофенона или другим вспомогательным веществам препарата.

С осторожностью

Острая интоксикация алкоголем, опиоидными анальгетиками, снотворными или психотропными препаратами, угнетающими ЦНС; печеночная и почечная недостаточность; гипокалиемия; брадикардия; удлинение интервала QT (в т.ч. синдром врожденного удлинения интервала QT) или предрасположенность к этому -одновременный прием препаратов, которые могут способствовать развитию гипокалиемии; другие клинически значимые нарушения со стороны сердца (в частности, нарушения внутрисердечной проводимости, аритмии); пролактинзависимые опухоли (например, опухоли молочной железы); тяжелая артериальная гипотензия или ортостатическая дисрегуляция; эндогенная депрессия; заболевания системы кроветворения; злокачественный нейролептический синдром в анамнезе; органические заболевания головного мозга и эпилепсия; гипертиреоз.

Особая *осторожность* требуется у пациентов с неврологическими симптомами повреждения подкорковых структур головного мозга и пониженным порогом судорожной готовности (в анамнезе или на фоне прекращения приема алкоголя), т.к. галоперидол снижает порог судорожной активности, поэтому могут наблюдаться судороги по типу "grandmal". Пациентам с эпилепсией лечение галоперидолом должно проводиться только при условии продолжения противосудорожной терапии.

Галоперидол не следует применять при тяжелых депрессивных состояниях. При сопутствующих депрессиях и психозе галоперидол следует комбинировать с антидепрессантами.

Т.к. тироксин может способствовать росту частоты нежелательных эффектов, связанных с приемом галоперидола, пациенты с гипертиреозом не должны получать лечение галоперидолом, за исключением случаев, когда им параллельно проводится адекватная антитиреоидная терапия.

Способ применения и дозы:

1 мл раствора (20 капель) содержит 2 мг галоперидола; 10 капель содержат 1 мг галоперидола.

Индивидуальная доза определяется лечащим врачом и зависит от клинической картины, особенностей течения заболевания, возраста и переносимости препарата. Суточную дозу необходимо разделить на 1-3 приема, при высоких дозах возможен более частый прием отдельных доз. Если врач не определил для пациента индивидуальной дозы, то обычно применяют следующие схемы лечения.

Капли для приема внутрь принимают во время еды, дозируют с помощью чайной ложки, добавляя в напитки или пищу, либо на кусочке сахара (кроме пациентов с сахарным диабетом).

Взрослые. Начальная доза - по 0.5-1.5 мг 2-3 раза/сут. Затем дозу постепенно увеличивают на 0.5-2 мг/сут (в резистентных случаях на 2-4 мг/сут) до достижения необходимого терапевтического эффекта. При *купировании острой симптоматики* в стационарных условиях начальные суточные дозы могут повышаться до 15 мг/сут, в *терапевтически резистентных случаях* - выше. Максимальная суточная доза не должна превышать 100 мг/сут. Средняя терапевтическая доза 10-15 мг/сут, при *хронических формах шизофрении* - 20-40 мг/сут, в *резистентных случаях* - до 50-60 мг/сут. Поддерживающие дозы (вне обострения) в амбулаторных условиях могут колебаться - 0.5-5 мг/сут.

Дети старше 3-х лет. Лечение начинают с дозы 0.025-0.05 мг/кг массы тела, разделенной на 2-3 приема. Повышение дозы возможно до 0.2 мг/кг массы тела.

Пациенты пожилого возраста и физически ослабленные пациенты. Лечение начинают с разовых доз, не превышающих 0.5-1.5 мг. Суточную дозу не рекомендуется увеличивать более 5 мг/сут.

Детям, пациентам пожилого возраста и ослабленным пациентам дозы увеличивают не чаще чем 1 раз в 3-5 дней.

Побочное действие:

При применении дозы 1-2 мг/сут нежелательные эффекты не выражены и носят транзиторный характер. При применении более высоких доз увеличивается частота развития нежелательных реакций.

Со стороны нервной системы: головная боль, головокружение, бессонница или сонливость (особенно в начале лечения), ощущение беспокойства, тревога, возбуждение, страх, акатизия, эйфория, депрессия, летаргия, приступы эпилепсии, развитие парадоксальной реакции - обострение психоза и галлюцинации; при длительном лечении - экстрапирамидные расстройства, в т.ч. поздняя дискинезия (причмокивание и сморщивание губ, надувание щек, быстрые и червеобразные движения языка, неконтролируемые жевательные движения, неконтролируемые движения рук и ног), поздняя дистония (учащенное моргание или спазмы век, необычное выражение лица, необычное положение тела, неконтролируемые изгибающиеся движения шеи, туловища, рук и ног), злокачественный нейролептический синдром (затрудненное или учащенное дыхание, тахикардия, аритмия, гипертермия, повышение или снижение АД, повышенное потоотделение, недержание мочи, мышечная ригидность, эпилептические припадки, потеря сознания).

Со стороны сердечно-сосудистой системы: при применении в высоких дозах - снижение АД, ортостатическая гипотензия, аритмия, тахикардия, изменения на ЭКГ (удлинение интервала QT, трепетание и фибрилляция желудочков).

Со стороны дыхательной системы: нарушение ритма дыхания, одышка, пневмония (бронхопневмония).

Со стороны пищеварительной системы: при применении в высоких дозах - снижение аппетита, сухость слизистой оболочки полости рта, гипосаливация, тошнота, рвота, диарея, запор, нарушение функции печени, желтуха.

Со стороны органов кроветворения: транзиторная лейкопения или лейкоцитоз, агранулоцитоз, эритропения, моноцитоз.

Со стороны мочеполовой системы: задержка мочи (при гиперплазии предстательной железы), периферические отеки, боль в грудных железах, гинекомастия, гиперпролактинемия, нарушение менструального цикла, снижение потенции, повышение либидо, приапизм.

Со стороны органов чувств: катаракта, ретинопатия, нечеткость зрения.

Аллергические реакции: макулопапулезные изменения кожи, акне, реакции фотосенсибилизации, бронхоспазм, ларингоспазм, гиперпирексия.

Лабораторные показатели: гипонатриемия, гипергликемия, гипогликемия.

Прочие: алопеция, тепловой удар, увеличение массы тела.

Передозировка:

Из-за широкого терапевтического индекса интоксикация развивается обычно только в случаях выраженной передозировки. *Симптомы передозировки:*

— тяжелые экстрапирамидные нарушения: острые дискинетические или дистонические симптомы, глоссофарингеальный синдром, судорога взора, спазмы гортани,глотки;

— сонливость, иногда кома, возбуждение и спутанность сознания с делирием;

— реже - эпилептические припадки;

— гипертермия или гипотермия;

— сердечно-сосудистая система: снижение или повышение АД, тахикардия или брадикардия, изменения на ЭКГ, такие как удлинение интервалов PQ и QT, трепетание и фибрилляция желудочков, сердечно-сосудистая недостаточность;

— редко - м-холиноблокирующие эффекты: затуманенность зрения, приступ повышения внутриглазного давления, парез кишечника, задержка мочи;

— редко - респираторные осложнения: цианоз, угнетение дыхания, дыхательная недостаточность, аспирация, пневмония.

Лечение симптоматическое и поддерживающее, с соблюдением общих принципов лечения передозировки, при этом необходимо учитывать следующие обстоятельства.

Попытки вызвать рвоту могут быть затруднены противорвотным эффектом антипсихотических препаратов. Из-за быстрого всасывания промывание желудка рекомендуется только в случаях ранней диагностики передозировки. Форсированный диурез и диализ мало эффективны.

Аналептики противопоказаны, т.к. на фоне применения галоперидола из-за снижения порога судорожной готовности имеется тенденция к развитию эпилептических припадков. Если развиваются тяжелые экстрапирамидные симптомы, следует применить противопаркинсонические препараты, например, бипериден в/в; может потребоваться применение противопаркинсонических средств на протяжении нескольких недель. Пациентам в коме выполняется интубация. Спазм фарингеальных мышц может затруднять интубацию; в этом случае возможно применение миорелаксантов короткого действия.

У пациентов с симптомами интоксикации показатели ЭКГ и основные функциональные показатели организма должны постоянно контролироваться вплоть до их нормализации. При артериальной гипотензии по причине усиления парадоксальных эффектов не следует применять препараты адреналинового ряда (эпинефрин (адреналин)), оказывающие влияние на кровообращение; вместо этого должны применяться препараты типа норадреналина (например, непрерывные капельные инфузии норадреналина (норэпинефрина)) или ангиотензинамида. Бета-адреномиметиков следует избегать из-за того, что они вызывают усиление вазодилатации.

Гипотермию лечат медленным согреванием. Инфузионные растворы для применения у пациентов с гипотермией должны подогреваться.

При сильной лихорадке следует применять жаропонижающие средства, если необходимо - ледяные ванны.

М-холиноблокирующие симптомы могут купироваться применением физостигмина (1-2 мг в/в) (при необходимости повторить); применение в стандартной повседневной практике не рекомендуется по причине тяжелых нежелательных эффектов этого лекарственного препарата.

Противосудорожные препараты применяют для лечения повторных эпилептиформных судорог при условии, что возможно проведение искусственной вентиляции легких, поскольку имеется риск угнетения дыхания.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение препарата Галоперидол-ратиофарм во время беременности противопоказано. Перед началом лечения следует проводить тест на беременность. Во время лечения препаратом необходимо использовать эффективные методы контрацепции. Галоперидол выделяется с грудным молоком. Применение препарата Галоперидол-ратиофарм в период грудного вскармливания противопоказано.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Одновременный прием эианола и галоперидола может усиливать действие алкоголя и приводить к артериальной гипотензии.

Повышает выраженность угнетающего влияния на ЦНС этанола, трициклических антидепрессантов, опиоидных анальгетиков, барбитуратов и других снотворных препаратов, средств для общей анестезии.

Усиливает действие периферических м-холиноблокаторов и большинства гипотензивных препаратов (снижает действие гуанетидина вследствие вытеснения его из альфа-адренергических нейронов и подавления его захвата этими нейронами).

Тормозит метаболизм трициклических антидепрессантов и ингибиторов МАО, при этом увеличивается (взаимно) их седативный эффект и токсичность.

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

Уменьшает эффект противосудорожных препаратов (снижение порога судорожной активности галоперидолом).

Ослабляет сосудосуживающее действие допамина, фенилэфрина, норэпинефрина, эфедрина и эпинефрина (блокада α-адренорецепторов галоперидолом, может привести к извращению действия эпинефрина и к парадоксальному снижению АД).

Снижает эффект противопаркинсонических препаратов (антагонистическое влияние на допаминергические структуры ЦНС).

Изменяет (может повышать или снижать) эффект антикоагулянтов.

Уменьшает действие бромокриптина (может потребоваться коррекция дозы).

При применении с метилдопой увеличивает риск развития психических нарушений (в т.ч. дезориентации в пространстве, замедления и затруднения процессов мышления).

Амфетамины снижают антипсихотическое действие галоперидола, который, в свою очередь, уменьшает их психостимулирующий эффект (блокада галоперидолом α-адренорецепторов).

М-холиноблокирующие препараты, блокаторы гистаминовых H_1-рецепторов I поколения и антидискинетические препараты могут усиливать м-холиноблокирующее влияние галоперидола и снижают его антипсихотическое действие (может потребоваться коррекция дозы).

Длительное применение карбамазепина, барбитуратов и других индукторов микросомального окисления снижает концентрацию галоперидола в плазме.

При одновременном применении с препаратами лития (особенно в высоких дозах) возможно развитие энцефалопатии (может вызвать необратимую нейроинтоксикацию) и усиление экстрапирамидной симптоматики.

При одновременном приеме с флуоксетином возрастает риск развития побочных эффектов со стороны ЦНС, особенно, экстрапирамидных реакций.

При одновременном применении с препаратами, вызывающими экстрапирамидные реакции, повышает частоту и тяжесть экстрапирамидных расстройств.

Употребление крепкого чая или кофе (особенно в больших количествах) снижает действие галоперидола.

Особые указания и меры предосторожности:

При возникновении, особенно в первые три месяца лечения, лихорадки, гингивита и стоматита, фарингита, гнойной ангины и гриппоподобных симптомов необходимо незамедлительно проконсультироваться с лечащим врачом.

Следует избегать самолечения анальгетиками.

До начала лечения галоперидолом пациентам необходимо провести исследование общего анализа крови (включая дифференцированный подсчет форменных элементов крови и числа тромбоцитов), показателей ЭКГ и электроэнцефалограммы. При выявлении отклонений от нормы, галоперидол можно применять только по абсолютным показаниям и при условии проведения обязательных контрольных исследований общих показателей крови. До начала лечения необходима коррекция гипокалиемии.

У пациентов с органическими повреждениями головного мозга, артериосклеротическими цереброваскулярными заболеваниями и эндогенной депрессией при терапии галоперидолом требуется особая осторожность.

В связи с тем, что у пожилых пациентов и пациентов с сопутствующими заболеваниями сердечно-сосудистой системы могут наблюдаться нарушения внутрисердечной проводимости, на фоне терапии рекомендуется регулярный

мониторинг сердечной деятельности. У пациентов с феохромоцитомой, почечной недостаточностью, сердечной недостаточностью или церебральной недостаточностью на фоне терапии галоперидолом могут развиваться гипотензивные реакции, поэтому за такими пациентами требуется тщательное наблюдение.

Несмотря на то, что распространенность поздних дискинезий в достаточной мере не изучена, пожилые пациенты (особенно пожилые женщины) склонны к развитию данного состояния. Риск развития поздних дискинезий, особенно необратимого типа, возрастает с увеличением продолжительности лечения и при применении антипсихотических доз. Поздние дискинезии могут развиться и после кратковременного лечения в низких дозах. Антипсихотическое лечение в начале может маскировать симптомы первичной поздней дискинезии. Симптомы могут проявляться после отмены препарата. Необходимо соблюдать осторожность при выполнении тяжелой физической работы, принятии горячей ванны (возможно развитие теплового удара вследствие подавления центральной и периферической терморегуляции в гипоталамусе).

Во время лечения не следует принимать "противопростудные" безрецептурные лекарственные средства (возможно усиление м-холиноблокирующих эффектов и риска возникновения теплового удара).

Следует защищать открытые участки кожи от избыточного солнечного излучения вследствие повышенного риска развития реакций фотосенсибилизации.

Лечение прекращают постепенно во избежание возникновения синдрома «отмены».

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

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения необходимо избегать (особенно на первых этапах лечения) или соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Применение в пожилом возрасте

Пациенты пожилого возраста и физически ослабленные пациенты. Лечение начинают с разовых доз, не превышающих 0.5-1.5 мг. Суточную дозу не рекомендуется увеличивать более 5 мг/сут.

Применение в детском возрасте

Дети старше 3-х лет. Лечение начинают с дозы 0.025-0.05 мг/кг массы тела, разделенной на 2-3 приема. Повышение дозы возможно до 0.2 мг/кг массы тела.

Детям до 3-х лет препарат противопоказан.

Условия хранения:

Хранить при температуре не выше 25°С. Хранить в недоступном для детей месте.

После вскрытия флакона препарат пригоден для применения 6 месяцев. Не применять после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Срок годности:

5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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