Галоперидол деканоат



Код АТХ:

- N05AD01

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:

Раствор для в/м введения (масляный) прозрачный, желтого или зеленовато-желтого цвета.

	1 мл
галоперидола деканоат	70.52 мг,
что соответствует содержанию галоперидола	50 мг

Вспомогательные вещества: бензиловый спирт, масло кунжутное.

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

Фармакотерапевтическая группа:

- Нейротропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Галоперидол деканоат является эфиром галоперидола и декановой кислоты. При в/м введении в ходе медленного гидролиза происходит высвобождение галоперидола, который затем попадает в системный кровоток. Галоперидол

деканоат относится к нейролептикам-производным бутирофенона. Галоперидол является выраженным антагонистом центральных дофаминовых рецепторов и относится к сильным нейролептикам.

Галоперидол высокоэффективен при лечении галлюцинаций и бреда, благодаря непосредственной блокаде центральных дофаминовых рецепторов (действует, вероятно, на мезокортикальные и лимбические структуры), воздействует на базальные ганглионы (нигростриа). Оказывает выраженное успокаивающее действие при психомоторном возбуждении, эффективен при мании и прочих ажитациях.

Лимбическая активность препарата проявляется в седативном эффекте, эффективен в качестве дополнительного средства при хронической боли.

Воздействие на базальные ганглионы вызывает экстрапирамидные реакции (дистонию, акатизию, паркинсонизм).

У социально замкнутых больных нормализуется социальное поведение.

Выраженная периферическая антидофаминовая активность сопровождается развитием тошноты и рвоты (раздражение хеморецепторов), расслаблением гастродуоденального сфинктера и повышенным высвобождением пролактина (блокирует пролактин-ингибирующий фактор в аденогипофизе).

Фармакокинетика

C_{max} галоперидола, высвобождающегося из депо галоперидола после в/м инъекции, достигается через 3-9 дней. $T_{1/2}$ около 3 нед. При регулярном ежемесячном введении стадия насыщения в плазме достигается через 2-4 месяца. Фармакокинетика при в/в введении носит дозозависимый характер. При дозах ниже 450 мг имеет место прямая зависимость между дозой и плазменной концентрацией галоперидола. Для достижения терапевтического эффекта необходима концентрация галоперидола в плазме 20-25 мкг/л. Галоперидол легко проникает через гематоэнцефалический барьер. Связь с белками плазмы - 92%. Выводится через кишечник (60%) и почками (40%, в т.ч 1% в неизмененном виде).

Показания к применению:

— хроническая шизофрения и другие психозы, особенно, когда лечение галоперидолом быстрого действия было эффективно и необходим действенный нейролептик умеренно седативного действия;

— другие нарушения умственной деятельности и поведения, протекающие с психомоторной ажитацией и требующие длительного лечения.

Относится к болезням:

- Шизофрения

Противопоказания:

— коматозное состояние;

— угнетение ЦНС, вызванное лекарственными средствами или алкоголем;

— болезнь Паркинсона;

— поражение базальных ганглиев;

— детский возраст;

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С осторожностью: декомпенсированные заболевания сердечно-сосудистой системы (в т.ч. стенокардия, нарушения внутрисердечной проводимости, удлинение интервала QT или предрасположенность к этому - гипокалиемия, одновременное применение других лекарственных средств, которые могут вызывать удлинение интервала QT), эпилепсия, закрытоугольная глаукома, печеночная и/или почечная недостаточность, гипертиреоз (с явлениями тиреотоксикоза), легочно-сердечная и дыхательная недостаточность (в т.ч. при ХОБЛ и острых инфекционных заболеваниях), гиперплазия предстательной железы с задержкой мочи, алкоголизм.

Способ применения и дозы:

Препарат предназначен исключительно для взрослых, исключительно для в/м введения!

Запрещается вводить в/в!

Инъекции рекомендуется вводить в ягодичную область. Следует избегать введения доз, превышающих 3 мл, во избежание неприятного чувства распирания в месте введения инъекции.

Взрослым: больным, находящимся на длительном лечении пероральными антипсихотическими средствами (главным образом, галоперидолом), можно рекомендовать переход на депо-инъекции.

Дозу следует подбирать в индивидуальном порядке в виду значительных индивидуальных различий в реакциях на лечение. Подбор дозы должен проводиться при строгом врачебном наблюдении за больным. Выбор начальной дозы проводят с учетом симптоматики заболевания, его тяжести, доза галоперидола или других нейролептиков, назначавшихся в ходе предшествующего лечения.

В начале лечения, каждые 4 недели рекомендуется назначать дозы, в 10-15 раз превосходящие дозы перорального галоперидола, что обычно соответствует 25-75 мг препарата Галоперидол Деканоат (0.5-1.5 мл). Максимальная начальная доза не должна превышать 100 мг.

В зависимости от оказываемого эффекта дозу можно ступенеобразно повышать, по 50 мг, до получения оптимального эффекта. Обычно поддерживающая доза соответствует 20-кратной суточной дозе перорального галоперидола. При возобновлении симптомов основного заболевания в период подбора дозы лечение препаратом Галоперидол Деканоат можно дополнить пероральным галоперидолом.

Обычно инъекции вводят каждые 4 недели, однако в виду больших индивидуальных различий в эффективности может потребоваться более частое применение препарата.

Пожилым больным и больным олигофренией: рекомендуется меньшая начальная доза, например по 12.5-25 мг каждые 4 недели. В дальнейшем в зависимости от оказываемого эффекта доза может быть увеличена.

Побочное действие:

Побочные эффекты, развивающиеся во время лечения, обусловлены действием галоперидола.

Со стороны нервной системы: головная боль, бессонница или сонливость (особенно в начале лечения), беспокойство, тревожность, возбуждение, страхи, акатизия, эйфория или 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 или положение тела, неконтролируемые изгибающиеся движения шеи, туловища, рук и ног) и злокачественный нейролептический синдром (затрудненное или учащенное дыхание, тахикардия, аритмия, гипертермия, повышение или снижение АД, повышенное потоотделение, недержание мочи, ригидность мышц, эпилептические припадки, потеря сознания).

Со стороны сердечно-сосудистой системы: при использовании в высоких дозах - снижение АД, ортостатическая гипотензия, аритмии, тахикардия, изменения на ЭКГ (удлинение интервала QT, признаки трепетания и мерцания желудочков).

Со стороны пищеварительной системы: при применении в высоких дозах - снижение аппетита, сухость во рту, гипосаливация, тошнота, рвота, диарея или запоры, нарушение функции печени, вплоть до развития желтухи.

Со стороны системы кроветворения: редко - преходящая лейкопения или лейкоцитоз, агранулоцитоз, эритропения и тенденция к моноцитозу.

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

Со стороны репродуктивной системы: боли в грудных железах, гинекомастия, гиперпролактинемия, нарушение менструального цикла, снижение потенции, повышение либидо, приапизм.

Со стороны органа зрения: катаракта, ретинопатия, нечеткость зрения.

Со стороны водно-электролитного баланса: гипонатриемия.

Со стороны обмена веществ: гипер- и гипогликемия.

Аллергические реакции: макуло-папулезные и акнеобразные изменения кожи, фотосенсибилизация, редко - бронхоспазм, ларингоспазм.

Возможно развитие *местных реакций*, связанных с введением инъекции.

Прочие: алопеция, увеличение массы тела.

Передозировка:

Применение депо-инъекций препарата Галоперидол Деканоат связано с меньшей опасностью передозировки, нежели прием галоперидола внутрь. Симптомы передозировки препарата Галоперидол Деканоат и галоперидола одинаковы. При подозрении на передозировку следует учитывать более продолжительное действие первого.

Симптомы: развитие известных фармакологических эффектов и побочных действий в более выраженной форме. Симптомы, представляющие наибольшую опасность: экстрапирамидные реакции, снижение АД, седативный эффект. Экстрапирамидные реакции проявляются в виде ригидности мышц и общего либо локализованного тремора. Чаще возможно повышение АД, нежели понижение его. В исключительных случаях - развитие коматозного состояния с угнетением дыхания и артериальной гипотонией, переходящего в шокоподобное. Возможно удлинение интервала QT с развитием желудочковых аритмий.

Лечение: специфического антидота нет. Проходимость дыхательных путей коматозного больного обеспечивают с помощью орофарингеального или эндотрахеального зонда, при угнетении дыхания может потребоваться искусственная вентиляция легких. Проводят мониторинг жизненноважных функций и ЭКГ до ее полной нормализации, лечение тяжелых аритмий соответствующими противоаритмическими средствами, при сниженном АД и остановке кровообращения - в/в введение жидкости, плазмы или концентрированного альбумина и допамин, либо норэпинефрина в качестве вазопрессора. Введение эпинефрина недопустимо, т.к. в результате взаимодействия с препаратом Галоперидол Деканоат АД может существенно повыситься, что требует незамедлительной коррекции. При тяжелых экстрапирамидальных симптомах - введение антипаркинсонических средств антихолинергического действия в течение нескольких недель (возможно возобновление симптомов после отмены этих препаратов!).

Применение при беременности и кормлении грудью:

Исследования, проведенные с вовлечением большого числа больных, свидетельствуют о том, что Галоперидол Деканоат не вызывает существенного увеличения частоты пороков развития. В нескольких изолированных случаях врожденные пороки развития наблюдались при применении Галоперидола Деканоата одновременно с другими лекарственными средствами в период фетального развития. Назначение препарата при беременности возможно только в том случае, когда предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

Галоперидол Деканоат проникается в грудное молоко. Назначение препарата в период грудного вскармливание возможно лишь в том случае, когда предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для младенца. В некоторых случаях у грудных детей наблюдалось развитие экстрапирамидных симптомов при приеме препарата кормящей матерью.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

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

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).

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 средств (снижение судорожного порога галоперидолом).

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

Снижает эффект противопаркинсонических средств (антагонистическое влияние на дофаминергические структуры ЦНС).

Изменяет (может повышать или снижать) эффект антикоагулянтов.

Уменьшает действие бромокриптина (может потребоваться корректировка дозы).

При применении с метилдопой увеличивает риск развития психических нарушений (в т.ч. дезориентация в пространстве, замедление и затруднение процессов мышления).

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

Антихолинергические, антигистаминные (1 поколения) и противопаркинсонические лекарственные средства 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.

В сочетании 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:

В нескольких случаях у психиатрических больных, получавших антипсихотические средства, наступала внезапная смерть. В случае предрасположенности к удлинению интервала QT (синдром удлинения интервала QT, гипокалиемия, прием лекарств, пролонгирующих интервал QT) во время лечения следует соблюдать осторожность в связи с риском удлинения интервала QT.

Лечение следует начинать с приема перорального галоперидола и лишь затем переходить к инъекциям препарата Галоперидол Деканоат для выявления непредвиденных побочных реакций.

При нарушенной функции печени необходимо соблюдать осторожность, т.к. метаболизм препарата осуществляется в печени.

При длительном лечении необходим регулярный контроль функции печени и картины крови.

В единичных случаях Галоперидол Деканоат вызывал судороги. Лечение больных эпилепсией и состояния, предрасполагающие к судорогам (например, травма головы, отмена алкоголя), требует осторожности.

Тироксин усиливает токсичность препарата. Лечение больных, страдающих гипертиреозом, допустимо лишь при проведении соответствующего тиреостатического лечения.

При одновременном наличии депрессии и психоза или при доминировании депрессии Галоперидол Деканоат назначают вместе с антидепрессантами.

При одновременном проведении противопаркинсонической терапии после окончания лечения Галоперидола Деканоатом ее следует продолжить еще на несколько недель ввиду более быстрой элиминации противопаркинсонических средств.

Препарат Галоперидол Деканоат является масляным раствором для в/м введния, поэтому запрещается вводить его в/в!

В дальнейшем степень запрета определяется на основании индивидуальной реакции больного. Во время лечения препаратом запрещается употреблять спиртные напитки.

В начале лечения препаратом и особенно во время применения высоких его доз возможно появление седативного эффекта различной степени выраженности со снижением внимания, который может усугубляться приемом алкоголя.

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 антихолинергических эффектов и риска возникновения теплового удара).

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

Лечение прекращают постепенно во избежание возникновения синдрома "отмены".

При нарушениях функции почек

Препарат с осторожностью назначается больным с почечной недостаточностью.

При нарушениях функции печени

Препарат с осторожностью назначается больным с печеночной недостаточностью.

При нарушенной функции печени необходимо соблюдать осторожность, т.к. метаболизм препарата осуществляется в печени.

Применение в пожилом возрасте

Пожилым больным: рекомендуется меньшая начальная доза, например по 12.5-25 мг каждые 4 недели. В дальнейшем в зависимости от оказываемого эффекта доза может быть увеличена.

Применение в детском возрасте

Препарат противопоказан в детском возрасте.

Условия хранения:

Условия хранения:

хранить при температуре 15-30°С, в защищенном от света и недоступном для детей месте.

Срок годности:

5 лет. Использовать в течение срока годности, указанного на упаковке.

Источник: http://drugs.thead.ru/Galoperidol_dekanoat