Галоперидол (таблетки)



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:

Таблетки от белого до белого со слегка желтоватым оттенком цвета, плоскоцилиндрической формы, с фаской.

	1 таб.
галоперидол	1.5 мг

Вспомогательные вещества: крахмал картофельный, лактоза (сахар молочный), желатин медицинский, тальк, магния стеарат.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (4) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (5) - пачки картонные.
100 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.

Таблетки от белого до белого со слегка желтоватым оттенком цвета, плоскоцилиндрической формы, с фаской и риской.

	1 таб.
галоперидол	5 мг

Вспомогательные вещества: крахмал картофельный, лактоза (сахар молочный), желатин медицинский, тальк, магния стеарат.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (4) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (5) - пачки картонные.
100 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Нейротропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Галоперидол - нейролептик, принадлежащий к производным бутирофенона. Оказывает выраженный антипсихотический и противорвотный эффект. Выраженная антипсихотическая активность сочетается с умеренным седативным эффектом (в небольших дозах оказывает активирующее действие).

Антипсихотическое действие галоперидола связано с блокадой центральных дофаминовых (D 2) и а-адренергических рецепторов в мезокортикальных и лимбических структурах головного мозга. Блокада О2-рецепторов гипоталамуса ведет к снижению температуры тела, галакторее (повышение выработки пролактина). Взаимодействие с дофаминергическими структурами экстрапирамидной системы может приводить к экстрапирамидным нарушениям. Угнетение дофаминовых рецепторов в триггерной зоне рвотного центра лежит в основе противорвотного действия.

Галоперидол усиливает действие снотворных, опиоидных анальгетиков, средств для общей анестезии, анальгетиков и других средств, угнетающих функцию ЦНС.

Фармакокинетика

Галоперидол всасывается, в основном, в тонком кишечнике путем пассивной диффузии. Биодоступность 60-70%. При пероральном применении, максимальные концентрации в крови достигаются через 3-6 ч. Галоперидол на 90% связывается с белками плазмы.

Отношение концентрации в эритроцитах к концентрации в плазме 1:12.

Концентрация галоперидола в тканях выше, чем в крови.

Галоперидол метаболизируется в печени, метаболит фармакологически не активен.

Галоперидол выделяется почками (40%) и с калом (60%), проникает в грудное молоко.

$T_{1/2}$ из плазмы после перорального применения составляет в среднем 24 ч (12-37 ч).

Показания к применению:

Препарат применяется строго по назначению врача.

— острые и хронические психозы, сопровождающиеся возбуждением, галлюцинаторными и бредовыми расстройствами, маниакальные состояния, психосоматические расстройства;

— расстройства поведения, изменения личности (параноидные, шизоидные и другие), синдром Жиля де ля Туретта, как в детском возрасте, так и у взрослых;

— тики, хорея Геттингтона;

— длительно сохраняющаяся и устойчивая к терапии икота и рвота, в т.ч. связанная с противоопухолевой терапией;

— премедикация перед оперативным вмешательством.

Относится к болезням:

- Рвота
- Тики
- Хорея

Противопоказания:

— тяжелое токсическое угнетение функции ЦНС вызванное ксенобиотиками, комы различного генеза;

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

— беременность, период грудного вскармливания;

— детский возраст до 3-х лет.

— повышенная чувствительность к производным бутирофенона.

В связи с наличием в составе препарата лактозы (молочного сахара), его прием противопоказан при врожденной непереносимости лактозы, лактазной недостаточности, глюкозно-галактозной мальабсорбции.

С осторожностью: следует принимать галоперидол при декомпенсированных сердечно-сосудистых заболеваниях (в т.ч. стенокардия, нарушения внутрисердечной проводимости, удлинение интервала Q-T или предрасположенность к этому - гипокалиемия, одновременное применение других лекарственных средств, которые могут вызывать удлинение интервала Q-T); при тяжелых заболеваниях почек, печени, легочно-сердечной недостаточности (в т. ч. при бронхиальной астме и острых инфекциях), эпилепсии, закрытоугольной глаукоме, гипертиреозе (тиреотоксикозе), гиперплазии предстательной железы (задержке мочи), активном алкоголизме.

Способ применения и дозы:

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

Начальная суточная доза составляет 0.5-5 мг, разделенная на 2-3 приема. Затем дозу постепенно увеличивают на 0.5-2 мг (в резистентных случаях на 2-4 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 резистентных случаях до 50-60 мг/сут. Продолжительность курса лечения, в среднем, 2-3 мес. Поддерживающие дозы (вне обострения) от 0.5 до 5 мг/сут (дозу снижают постепенно).

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

Больным пожилого возраста и ослабленным больным назначают 1/3-1/2 обычной дозы для взрослых, с ее повышением не чаще, чем каждые 2-3 дня.

В качестве противорвотного средства назначают по 1.5 мг.

Для более точного дозирования может потребоваться другая лекарственная форма препарата, например, капли для приема внутрь.

Побочное действие:

Со стороны нервной системы: экстрапирамидные расстройства разной степени выраженности, паркинсонизм, преходящий акинето-ригидный синдром, окулогирные кризы, головная боль, головокружение, бессонница или сонливость (различной степени выраженности), состояние беспокойства, тревожность, психомоторное возбуждение, страх, акатизия, эйфория, депрессия, эпилептические припадки, в редких случаях обострение психоза, в т.ч. галлюцинации; экстрапирамидные расстройства; при длительном лечении - 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 (гипертермия, мышечная ригидность, затрудненное или учащенное дыхание, тахикардия, аритмия, повышение или снижение АД, повышенное потоотделение, недержание мочи, судорожные расстройства, угнетение сознания).

Со стороны сердечно-сосудистой системы: при использовании в высоких дозах - снижение АД, ортостатическая гипотензия, аритмии, тахикардия, изменения на ЭКГ (удлинение интервала Q-T , 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 органов кроветворения: редко - временная лейкопения или лейкоцитоз, агранулоцитоз, эритропения и тенденция к моноцитозу.

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

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

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

Со стороны кожи: гиперфункция сальных желез.

Лабораторные показатели: гипонатриемия, гипер- или гипогликемия, повышение активности печеночных трансаминаз.

Прочие: алопеция, повышение массы тела.

Передозировка:

Симптомы: при передозировке препарата возможно появление острых нейролептических реакций, перечисленных выше. 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: промывание желудка, активированный уголь. При угнетении дыхания - искусственная вентиляция легких. Для улучшения кровообращения в/в вводят плазму или раствор альбумина, норэпинефрин. Эпинефрин в этих случаях применять категорически запрещается! Уменьшение экстрапирамидных симптомов центральные холиноблокаторы и противопаркинсонические ЛС. Диализ неэффективен.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Галоперидол повышает выраженность угнетающего влияния на ЦНС опиоидных анальгетиков, снотворных средств, трициклических антидепрессантов, средств для общей анестезии, алкоголя.

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 снижать интенсивность действия адреналина (эпинефрина) и других симпатомиметиков, вызывать парадоксальное снижение артериального давления и тахикардию при их совместном применении.

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

При комбинированном приеме с противосудорожными средствами (включая барбитураты и др. индукторы микросомального окисления), дозы последних следует повышать, т.к. галоперидол снижает порог судорожной активности; также могут снижаться сывороточные концентрации галоперидола.

Галоперидол может снижать действие 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 галоперидола с литием, особенно в высоких дозах, может вызвать необратимую нейроинтоксикацию, а также усилить экстрапирамидную симптоматику.

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

Галоперидол может снижать действие бромокриптина.

Антихолинергические, антигистаминные (I поколения) и противопаркинсонические ЛС могут усиливать м-холиноблокирующее влияние галоперидола и снижают его антипсихотическое действие (может потребоваться коррекция дозы).

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

Особые указания и меры предосторожности:

В течение терапии больным следует регулярно осуществлять контроль за ЭКГ, формулой крови, "печеночными" пробами.

Выраженность экстрапирамидных расстройств связана с дозой, часто при снижении дозы они могут уменьшиться или исчезнуть.

При развитии поздней дискинезии рекомендуется постепенное снижение дозы (вплоть до полной 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 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".

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

Отмечено, что дозы для детей 6 мг/сут вызывают дополнительное улучшение при нарушениях поведения и тиках.

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

Условия хранения:

Список Б. Хранить в недоступном для детей месте, сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25°С. Срок годности **-** 3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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