# Рилептид




## Код АТХ:

- N05AX08

## Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Рисперидон

## Полезные ссылки:

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

## Форма выпуска:

***Таблетки, покрытые оболочкой*** светло-зеленого цвета, продолговатые, двояковыпуклые, с гравировкой "E752" на одной стороне и с риской - на другой, без или почти без запаха.

| | **1 таб.** |
|---|---|
| рисперидон | 2 мг |

*Вспомогательные вещества:* лактозы моногидрат, крахмал кукурузный, целлюлоза микрокристаллическая, магния стеарат, кремния диоксид коллоидный, натрия лаурилсульфат.

*Состав оболочки:* краситель Opadry зеленый (гипромеллоза, титана диоксид, макрогол 400, индигокармин алюминиевый лак, краситель хинолиновый желтый алюминиевый лак).

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

***Таблетки, покрытые оболочкой*** зеленого цвета, продолговатые, двояковыпуклые, с гравировкой "E754" на одной стороне и с риской - на другой, без или почти без запаха.

| | **1 таб.** |
|---|---|
| рисперидон | 4 мг |

*Вспомогательные вещества:* лактозы моногидрат, крахмал кукурузный, целлюлоза микрокристаллическая, магния стеарат, кремния диоксид коллоидный, натрия лаурилсульфат.

*Состав оболочки:* краситель Opadry зеленый (гипромеллоза, титана диоксид, макрогол 400, индигокармин алюминиевый лак, краситель хинолиновый желтый алюминиевый лак).

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

## Фармакотерапевтическая группа:

- Нейротропные средства

## Фармакологические свойства:

***Фармакодинамика***

Антипсихотический препарат, производное бензизоксазола. Оказывает также седативное, противорвотное и гипотермическое действие.

Рисперидон - селективный моноаминергический антагонист, обладает высоким сродством к серотониновым 5-$HT_2$-рецепторам и допаминовым $D_2$-рецепторам. Связывается с $\alpha_1$-адренорецепторами и несколько слабее - с гистаминовыми $H_1$-рецепторами и $\alpha_2$-адренорецепторами. Не обладает тропностью к холинорецепторам.

Антипсихотическое действие обусловлено блокадой допаминовых $D_2$-рецепторов мезолимбической и мезокортикальной системы. Седативное действие обусловлено блокадой адренорецепторов ретикулярной формации ствола головного мозга; противорвотное действие – блокадой допаминовых $D_2$-рецепторов триггерной зоны рвотного центра; гипотермическое действие – блокадой допаминовых рецепторов гипоталамуса.

Рилептид снижает продуктивную симптоматику шизофрении (бред, галлюцинации), автоматизм, в меньшей мере вызывает подавление моторной активности и в меньшей степени индуцирует каталепсию, чем классические нейролептики. Сбалансированный центральный антагонизм к серотонину и допамину может уменьшать склонность к экстрапирамидным побочным действиям.

Рисперидон может вызывать дозозависимое увеличение концентрации пролактина в плазме.

***Фармакокинетика***

*Всасывание*

После приема внутрь рисперидон полностью абсорбируется из ЖКТ, независимо от приема пищи. $C_{max}$ в плазме достигается через 1-2 ч.

*Распределение*

Рисперидон быстро распределяется в организме. $V_d$ составляет 1-2 л/кг. Рисперидон на 88% связывается с белками плазмы, 9-гидрокси-рисперидон - на 77% (преимущественно с альбумином и кислым альфа$_1$-гликопротеином).

$C_{ss}$ рисперидона в организме у большинства пациентов достигается в течение 1 дня.

$C_{ss}$ 9-гидрокси-рисперидона достигается в течение 3-4 дней. Концентрации рисперидона в плазме пропорциональны дозе препарата (в пределах терапевтических доз).

*Метаболизм*

Рисперидон метаболизируется в печени при участии изофермента CYP2D6 с образованием 9-гидрокси-рисперидона, который обладает аналогичным рисперидону фармакологическим действием. Рисперидон и 9-гидрокси-рисперидон составляют активную антипсихотическую фракцию. Другим путем метаболизма рисперидона является N-дезалкилирование.

*Выведение*

После приема внутрь $T_{1/2}$ рисперидона из плазмы составляет 3 ч. $T_{1/2}$ 9-гидрокси-рисперидона и активной антипсихотической фракции составляют 24 ч.

70% дозы (из них 35-45% в виде 9-гидрокси-рисперидона) выводится с мочой, 14% - с калом.

*Фармакокинетика в особых клинических случаях*

У пациентов пожилого возраста и у больных с почечной недостаточностью после однократного приема препарата внутрь наблюдались более высокие концентрации в плазме и замедленное выведение рисперидона.

## Показания к применению:

— острая и хроническая шизофрения и другие психотические расстройства с продуктивной и/или негативной

симптоматикой;

— аффективные расстройства при различных психических заболеваниях;

— поведенческие расстройства у пациентов с деменцией при проявлении симптомов агрессивности (вспышки гнева, физическое насилие), нарушениях психической деятельности (возбуждение, бред) или психотических симптомах;

— в качестве средства вспомогательной терапии при лечении маний при биполярных расстройствах;

— в качестве средства вспомогательной терапии расстройств поведения у подростков с 15 лет и взрослых пациентов со сниженным интеллектуальным уровнем или задержкой умственного развития в случаях, если деструктивное поведение (агрессивность, импульсивность, аутоагрессия) является ведущим в клинической картине болезни.

## Относится к болезням:

- Биполярное расстройство
- Деменция
- Шизофрения

## Противопоказания:

— период лактации (грудное вскармливание);

— повышенная чувствительность к препарату.

С *осторожностью* следует применять препарат у пациентов с заболеваниями сердечно-сосудистой системы (в т.ч. при хронической сердечной недостаточности, перенесенном инфаркте миокарда, нарушениях проводимости), при обезвоживании, гиповолемии, нарушении мозгового кровообращения, болезни Паркинсона, судорогах (в т.ч. в анамнезе), тяжелой почечной или печеночной недостаточности, при злоупотреблении лекарственными средствами или лекарственной зависимости, при состояниях, предрасполагающих к развитию тахикардии типа "пируэт" (брадикардия, нарушение электролитного баланса, сопутствующий прием лекарственных средств, удлиняющих интервал QT), при опухолях мозга, кишечной непроходимости, в случаях острой передозировки лекарств, при синдроме Рейе (т.к. противорвотный эффект рисперидона может маскировать симптомы этих состояний), при беременности, пациентам в возрасте до 15 лет (т.к. безопасность и эффективность применения препарата не установлены).

## Способ применения и дозы:

При *шизофрении* **взрослым и детям старше 15 лет** Рилептид назначают 1 или 2 раза/сут. Начальная доза – 2 мг/сут. На второй день дозу следует увеличить до 4 мг/сут. С этого момента дозу можно либо сохранить на прежнем уровне, либо индивидуально скорректировать при необходимости. Обычно оптимальной дозой является 4-6 мг/сут. В ряде случаев может быть оправдано более медленное повышение дозы и более низкие начальная и поддерживающая дозы.

Дозы выше 10 мг/сут не показали более высокой эффективности по сравнению с меньшими дозами и могут вызвать появление экстрапирамидных симптомов. В связи с тем, что безопасность доз выше 16 мг/сут не изучалась, дозы выше этого уровня применять нельзя.

Сведения по использованию Рилептида для лечения шизофрении у **детей младше 15 лет** отсутствуют.

**Пациентам пожилого возраста** препарат назначают в начальной дозе по 500 мкг 2 раза/сут. Дозу можно индивидуально увеличить на 500 мкг 2 раза/сут до 1-2 мг 2 раза/сут.

При **нарушениях функции печени и почек** начальная доза составляет по 500 мкг 2 раза/сут. Эту дозу постепенно можно увеличить до 1-2 мг 2 раза/сут.

При *злоупотреблении лекарственными средствами или лекарственной зависимости* рекомендуемая суточная доза препарата составляет 2-4 мг.

При лечении *поведенческих расстройств у больных с деменцией* рекомендуемая начальная доза составляет по 250 мкг 2 раза/сут. Дозу при необходимости можно индивидуально увеличивать на 250 мкг 2 раза/сут не чаще, чем через день. Для большинства пациентов оптимальной дозой является 500 мкг 2 раза/сут. Однако некоторым пациентам показан прием по 1 мг 2 раза/сут.

По достижении оптимальной дозы может быть рекомендован прием препарата 1 раз/сут.

При *биполярных расстройствах при маниях* рекомендуемая начальная доза препарата составляет 2 мг/сут в 1 прием. При необходимости эта доза может быть повышена на 2 мг/сут, не чаще, чем через день. Для большинства пациентов оптимальной дозой является 2-6 мг/сут.

При *расстройствах поведения у пациентов с задержкой умственного развития* для **пациентов с массой тела 50 кг и более** рекомендуемая начальная доза препарата составляет 500 мкг 1 раз/сут. При необходимости эта доза может быть повышена на 500 мкг/сут не чаще, чем через день. Для большинства пациентов оптимальной дозой является доза 1 мг/сут. Для некоторых пациентов предпочтительней прием по 500 мкг/сут, тогда как некоторым требуется увеличение дозы до 1.5 мг/сут.

Для **пациентов с массой тела менее 50 кг** рекомендуемая начальная доза препарата составляет 250 мкг 1 раз/сут. При необходимости эта доза может быть повышена на 250 мкг/сут не чаще, чем через день. Для большинства пациентов оптимальной является доза 500 мкг/сут. Для некоторых пациентов предпочтительней прием по 250 мкг/сут, тогда как некоторым требуется увеличение дозы до 750 мкг/сут.

Длительный прием препарата у **подростков** должен проводиться под контролем врача.

## Побочное действие:

*Со стороны ЦНС:* бессонница, ажитация, тревога, головная боль; иногда - сонливость, утомляемость, головокружение, нарушение концентрации внимания, нарушение четкости зрения; редко - экстрапирамидные симптомы (тремор, ригидность, гиперсаливация, брадикинезия, акатизия, острая дистония). Возможны мания или гипомания, инсульт (у пожилых пациентов с предрасполагающими факторами), гиперволемия (либо из-за полидипсии, либо из-за синдрома неадекватной секреции АДГ), поздняя дискинезия (непроизвольные ритмические движения преимущественно языка и/или лица), злокачественный нейролептический синдром (гипертермия, мышечная ригидность, нестабильность автономных функций, нарушение сознания и повышение уровня КФК), нарушения терморегуляции и судорожные припадки.

*Со стороны пищеварительной системы:* запор, диспепсия, тошнота, рвота, боли в животе, повышение активности печеночных ферментов, сухость во рту, гипо- или гиперсаливация, анорексия, усиление аппетита, повышение или снижение массы тела.

*Со стороны сердечно-сосудистой системы:* ортостатическая гипотензия и рефлекторная тахикардия, повышение АД.

*Со стороны системы кроветворения:* нейтропения, тромбоцитопения.

*Со стороны эндокринной системы:* возможны галакторея, гинекомастия, нарушения менструального цикла, аменорея, развитие гипергликемии или ухудшение течения сахарного диабета.

*Со стороны половой системы:* приапизм, нарушение эрекции, нарушение эякуляции, аноргазмия.

*Аллергические реакции:* ринит, кожная сыпь, ангионевротический отек.

*Дерматологические реакции:* сухость кожи, гиперпигментация, зуд, себорея, фотосенсибилизация.

*Прочие:* артралгия, недержание мочи.

## Передозировка:

*Симптомы:* сонливость, проявления седативного действия, угнетение сознания, тахикардия, артериальная гипотензия, экстрапирамидные симптомы, в редких случаях - удлинение интервала QT.

*Лечение:* следует обеспечить свободную проходимость дыхательных путей для обеспечения адекватной оксигенации и вентиляции. Показано промывание желудка (после интубации, если больной без сознания) и назначение активированного угля в сочетании со слабительным. Следует немедленно начать мониторирование ЭКГ для выявления возможных нарушений сердечного ритма. Специфический антидот отсутствует. Проводят симптоматическую терапию. Постоянное медицинское наблюдение и мониторирование следует продолжать до исчезновения симптомов интоксикации.

## Применение при беременности и кормлении грудью:

Безопасность применения рисперидона при беременности не изучена. Применение Рилептида при беременности возможно только в том случае, если ожидаемая польза превышает потенциальный риск.

Поскольку рисперидон и 9-гидрокси-рисперидон выделяются с грудным молоком, при необходимости применения препарата в период лактации следует прекратить грудное вскармливание.

## Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

С учетом того, что Рилептид оказывает воздействие в первую очередь на ЦНС, его следует применять с осторожностью в сочетании с другими препаратами центрального действия и алкоголем.

Рилептид уменьшает эффективность леводопы и других агонистов допамина.

Клозапин снижает клиренс рисперидона.

При одновременном применении Рилептида и карбамазепина отмечалось снижение концентрации активной антипсихотической фракции рисперидона в плазме. Аналогичные эффекты могут наблюдаться при использовании других индукторов печеночных ферментов.

При одновременном применении с Рилептидом фенотиазины, трициклические антидепрессанты и некоторые бета-адреноблокаторы могут повышать концентрации рисперидона в плазме, однако это не влияет на концентрацию активной антипсихотической фракции.

При одновременном применении с Рилептидом флуоксетин может повышать концентрацию рисперидона в плазме, в меньшей степени концентрацию активной антипсихотической фракции.

При применении Рилептида вместе с другими препаратами, в высокой степени связывающимися с белками плазмы, клинически выраженного вытеснения какого-либо препарата из белковой фракции плазмы не наблюдается.

Антигипертензивные препараты усиливают выраженность снижения АД на фоне приема Рилептида.

## Особые указания и меры предосторожности:

При шизофрении в начале лечения Рилептидом рекомендуется постепенно отменить предыдущую терапию, если это клинически оправдано. При этом если пациенты переводятся с терапии депо формами антипсихотических препаратов, то терапию Рилептидом рекомендуется начинать вместо следующей запланированной инъекции. Периодически следует оценивать необходимость в продолжении текущей терапии антипаркинсоническими препаратами.

В связи с альфа-адреноблокирующим действием Рилептида может возникать ортостатическая гипотензия, особенно в период начального подбора дозы. При возникновении артериальной гипотензии следует рассмотреть вопрос о снижении дозы. У пациентов с заболеваниями сердечно-сосудистой системы, а также при обезвоживании, гиповолемии или цереброваскулярных нарушениях, дозу следует увеличивать постепенно.

Следует учитывать, что возникновение экстрапирамидных симптомов является фактором риска для развития поздней дискинезии. Если возникают признаки и симптомы поздней дискинезии, следует рассмотреть вопрос об отмене всех антипсихотических препаратов.

В случае развития злокачественного нейролептического синдрома, характеризующегося гипертермией, мышечной ригидностью, нестабильностью вегетативных функций, нарушениями сознания и повышением уровня КФК, необходимо отменить все антипсихотические препараты, включая Рилептид.

У больных шизофренией повышается риск суицидальных попыток, поэтому лечение данной категории пациентов следует проводить под строгим врачебным контролем.

При отмене карбамазепина и других индукторов печеночных ферментов доза Рилептида должна быть снижена.

Пациентам в период лечения Рилептидом следует рекомендовать воздержаться от переедания в связи с возможностью увеличения массы тела.

В период лечения Рилептидом следует воздерживаться от употребления алкоголя.

*Использование в педиатрии*

Данные о безопасности и эффективности применения Рилептида у **детей младше 15 лет** отсутствуют, поэтому назначение препарата данной категории пациентов не рекомендуется.

*Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами*

В период лечения пациентам следует воздержаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующей высокой концентрации внимания и скорости психомоторных реакций.

***При нарушениях функции почек***

При **нарушениях функции почек** начальная доза составляет по 500 мкг 2 раза/сут. Эту дозу постепенно можно увеличить до 1-2 мг 2 раза/сут.

С осторожностью следует применять препарат при тяжелой почечной недостаточности.

***При нарушениях функции печени***

С осторожностью следует применять препарат при тяжелой печеночной недостаточности.

При **нарушениях функции печени** начальная доза составляет по 500 мкг 2 раза/сут. Эту дозу постепенно можно увеличить до 1-2 мг 2 раза/сут.

***Применение в пожилом возрасте***

**Пациентам пожилого возраста** препарат назначают в начальной дозе по 500 мкг 2 раза/сут. Дозу можно индивидуально увеличить на 500 мкг 2 раза/сут до 1-2 мг 2 раза/сут.

***Применение в детском возрасте***

Данные о безопасности и эффективности применения Рилептида у **детей младше 15 лет** отсутствуют, поэтому назначение препарата данной категории пациентов не рекомендуется.

## Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°C.

## Срок годности:

5 лет.

## Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

**Источник:** http://drugs.thead.ru/Rileptid