Риспаксол



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 пленочной оболочкой белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с риской на одной стороне; на месте разлома - белые.

	1 таб.
рисперидон	1 мг

Вспомогательные вещества: лактоза безводная, крахмал кукурузный, магния стеарат, кремния диоксид коллоидный безводный, целлюлоза микрокристаллическая.

Состав оболочки: краситель Опадрай II белый 33G28707 (гипромеллоза (гидроксипропилметилцеллюлоза), лактоза моногидрат, макрогол 3000, титана диоксид, глицерилтриацетат), карнаубский воск.

10 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (6) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой оранжевого цвета, круглые, двояковыпуклые, с риской на одной стороне; на месте разлома - белые.

	1 таб.
рисперидон	2 мг

Вспомогательные вещества: лактоза безводная, крахмал кукурузный, магния стеарат, кремния диоксид коллоидный безводный, целлюлоза микрокристаллическая.

Состав оболочки: краситель Опадрай оранжевый OY-8729 (гипромеллоза (гидроксипропилметилцеллюлоза), макрогол 400, титана диоксид, желтый "солнечный закат" FCF (E110), желтый хинолиновый (E104)), макрогол 6000, карнаубский воск.

10 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (6) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой зеленого цвета, круглые, двояковыпуклые, с риской (на четыре части) на одной стороне; на месте разлома - белые.

	1 таб.
рисперидон	4 мг

Вспомогательные вещества: лактоза безводная, крахмал кукурузный, магния стеарат, кремния диоксид коллоидный безводный, целлюлоза микрокристаллическая.

Состав оболочки: краситель Опадрай АМБ зеленый 80W21165 (железа оксид черный (Е172), индигокармин (Е132), лецитин сои, спирт поливиниловый, желтый хинолиновый (Е104), тальк, титана диоксид, ксантановая камедь), карнаубский воск.

10 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (6) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

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

Рисперидон является селективным моноаминергическим антагонистом с выраженным сродством к серотониновым 5-НТ2 и допаминовым D_2-рецепторам. Также рисперидон связывается с α_1-адренорецепторами и, при несколько меньшей аффинности, с гистаминовыми H_1-рецепторами и α_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.

Снижает продуктивную симптоматику (бред, галлюцинации, агрессивность), автоматизм. Вызывает меньшее подавление моторной активности и в меньшей степени индуцирует каталепсию, чем классические антипсихотики (нейролептики).

Сбалансированный центральный антагонизм к серотонину и допамину может уменьшать риск возникновения экстрапирамидной симптоматики.

Рисперидон может вызывать дозозависимое увеличение концентрации пролактина в плазме.

Фармакокинетика

При приеме внутрь рисперидон полностью всасывается (независимо от приема пищи) и максимальные уровни концентрации в плазме крови наблюдаются через 1-2 ч.

Рисперидон подвергается метаболизму с участием Р-450 IID6 цитохрома с образованием 9-гидроксирисперидона, который обладает аналогичным фармакологическим действием. Рисперидон и 9-гидроксирисперидон представляют собой эффективную антипсихотическую фракцию.

При приёме внутрь рисперидон выводится с периодом полувыведения около 3 часов. Установлено, что период полувыведения 9-гидроксирисперидона и активной антипсихотической фракции составляет 24 часа.

У большинства пациентов равновесная концентрация рисперидона наблюдается через один день после начала лечения. Равновесное состояние 9-гидроксирисперидона в большинстве случаев достигается через 3-4 дня после начала лечения. Концентрация рисперидона в плазме пропорциональна дозе препарата (в пределах терапевтических доз).

Рисперидон быстро распределяется в организме. Объем распределения составляет 1 -2 л/кг. В плазме рисперидон связывается с альбумином и а-1-гликопротеидом. Связывание рисперидона с белками плазмы составляет 88 %, 9-гидроксирисперидона-77 %.

Выводится почками - 70 % (из них 35 - 45 % в виде фармакологически активной фракции) и 14 % - с желчью. Остальное количество приходится на неактивные метаболиты.

У пациентов пожилого возраста после однократного приема препарата внутрь наблюдались повышенные концентрации активной фракции в плазме до 30 %, и у больных с почечной недостаточностью - до 60 %, а также сниженный клиренс антипсихотической фракции.

Наличие печеночной недостаточности не влияет на содержание концентрации рисперидона в плазме, но у таких больных среднее количество свободной фракции в плазме было на 35 % выше.

Показания к применению:

— шизофрения (острая и хроническая) и другие психотические состояния с преобладанием продуктивной симптоматики (бред, галлюцинации, агрессивность) и негативной симптоматики (скудость речи, эмоциональная и социальная отрешенность);

— аффективные расстройства при различных психических заболеваниях;

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

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

— в качестве 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 (грудного вскармливания);

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью* следует назначать препарат при:

— заболеваниях сердечно-сосудистой системы (хроническая сердечная недостаточность, перенесенный инфаркт миокарда, нарушения проводимости сердечной мышцы);

— обезвоживании и гиповолемии;

— нарушениях мозгового кровообращения;

— болезни Паркинсона;

— судорогах (в т.ч. в анамнезе);

— почечной недостаточности тяжелой степени;

— тяжелой печеночной недостаточности;

— злоупотреблении лекарственными средствами или лекарственной зависимости;

— состояниях, предрасполагающих к развитию тахикардии типа "пируэт" (брадикардия, нарушение электролитного баланса, сопутствующий прием лекарственных средств, удлиняющих интервал QT);

— опухолях мозга, кишечной непроходимости, случаях острой лекарственной передозировки, синдроме Рейе (противорвотный эффект рисперидона может маскировать симптомы этих состояний);

— беременности (эффективность и безопасность не установлены);

— детском возрасте до 15 лет (эффективность и безопасность не установлены).

Способ применения и дозы:

Риспаксол можно принимать во время приема пищи или в перерывах между приемами пищи. Таблетки следует запивать небольшим количеством воды.

При *шизофрении* **взрослым и детям старше 15 лет** препарат 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 более 16 мг/сут не изучалась, дозы выше этого уровня применять нельзя.

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

Пожилым пациентам рекомендуется начальная доза по 500 мкг 2 раза/сут. Дозу можно индивидуально увеличить по 500 мкг 2 раза/сут до 1-2 мг 2 раза/сут.

При **заболеваниях печени и почек** рекомендуется начальная доза по 500 мкг 2 раза/сут. Эту дозу постепенно можно увеличить до 1-2 мг на прием 2 раза/сут.

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

При *поведенческих расстройствах у больных с деменцией* рекомендуется начальная доза по 250 мкг 2 раза/сут (следует использовать адекватную лекарственную форму). Дозировку при необходимости можно индивидуально увеличивать по 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 *мании при биполярных расстройствах* рекомендованная начальная доза препарата - 2 мг в день за один прием. При необходимости эта доза может быть повышена на 2 мг в день, не чаще чем через день. Для большинства пациентов оптимальной дозой является 2-6 мг/сут.

При *расстройствах поведения у пациентов с задержкой умственного развития* **пациентам с массой тела 50 кг и более** назначают по 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. Однако для некоторых пациентов предпочтительней прием по 500 мкг/сут, тогда как некоторым требуется увеличение дозы до 1.5 мг/сут. **Пациентам с массой тела менее 50 кг** назначают по 250 мкг/сут. При необходимости эта доза может быть повышена на 250 мкг/сут, не чаще чем через день. Для большинства пациентов оптимальной дозой является доза 500 мкг/сут. Однако для некоторых пациентов предпочтительней прием по 250 мкг/сут, тогда как некоторым требуется увеличение дозы до 750 мкг/сут.

Длительный прием Рисперидона у **подростков** должен проводиться под постоянным контролем врача. Применение у **детей младше 15 лет** не рекомендуется.

Побочное действие:

Как и другие лекарственные средства, риспаксол может оказать побочное действие, которое, однако, проявляется не у всех. Риспаксол обладает хорошей переносимостью. Возможны следующие побочные действия.

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). У больных с шизофренией возможны гиперволемия (либо из-за полидипсии, либо из-за синдрома неадекватной секреции антидиуретического гормона), поздняя дискинезия (непроизвольные ритмические движения преимущественно языка и/или лица), ЗНС (гипертермия, мышечная ригидность, нестабильность вегетативных 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, рефлекторная тахикардия, повышение АД. На фоне терапии Риспаксолом описано развитие инсультов, в основном, у пожилых больных с предрасполагающими факторами.

Со стороны системы кроветворения: нейтропения, тромбоцитопения.

Со стороны эндокринной системы: возможны галакторея, гинекомастия, нарушения менструального цикла, аменорея; в единичных случаях - развитие гипергликемии или ухудшение течения сахарного диабета.

Со стороны мочеполовой системы: приапизм, нарушения эрекции, нарушения эякуляции, аноргазмия, недержание

мочи.

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

Аллергические реакции: ринит, кожная сыпь, ангионевротический отек.

Прочие: артралгия.

Передозировка:

Симптомы: сонливость, седативный эффект, угнетение сознания, тахикардия, артериальная гипотензия, экстрапирамидные расстройства, в редких случаях удлинение интервала QT.

Лечение: необходимо обеспечить свободную проходимость дыхательных путей для обеспечения адекватной оксигенации и вентиляции, промывание желудка (после интубации, если больной без сознания) и назначение активированного угля в сочетании со слабительными средствами. Симптоматическая терапия, направленная на поддержание жизненно важных функций организма. Для своевременного диагностирования возможных нарушений ритма сердца необходимо как можно быстрее начать мониторирование ЭКГ. Тщательное медицинское наблюдение и ЭКГ мониторирование проводят до полного исчезновения симптомов интоксикации. Специфический антидот отсутствует.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Безопасность применения рисперидона у беременных не изучалась. При беременности препарат можно использовать только в том случае, если положительный эффект оправдывает возможный риск. Поскольку рисперидон и 9-гидроксирисперидон выделяются с грудным молоком, женщинам, применяющим препарат, не следует кормить грудью.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

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

Риспаксол уменьшает эффективность леводопы и других агонистов допамина.

Клозапин снижает клиренс рисперидона.

При одновременном применении риспаксола 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 риспаксолом 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 риспаксолом флуоксетин может повышать концентрацию рисперидона в плазме, однако, в меньшей степени концентрацию активной антипсихотической фракции.

При применении риспаксола 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 риспаксола.

Особые указания и меры предосторожности:

При шизофрении, в начале лечения рисперидоном, рекомендуется постепенно отменить предыдущую терапию, если это клинически оправдано. Если пациенты переводятся с терапии депо-формами антипсихотических препаратов, то прием рисперидона рекомендуется начинать вместо следующей запланированной инъекции. Периодически следует оценивать необходимость продолжения терапии противопаркинсоническими препаратами.

В связи с альфа-адреноблокирующим действием рисперидона может развиться ортостатическая гипотензия, особенно в период начального подбора дозы. При возникновении 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, согласно рекомендациям.

Возникновение экстрапирамидных симптомов является фактором риска для развития поздней дискинезии. В случае возникновения признаков и симптомов поздней дискинезии, следует рассмотреть вопрос об отмене всех антипсихотических препаратов.

При возникновении нейролептического злокачественного синдрома, характеризующегося гипертермией, мышечной ригидностью, нестабильностью автономных функций, нарушениями сознания и повышением уровня КФК необходимо отменить все антипсихотические лекарственные средства, включая рисперидон.

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

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

Таблетки Риспаксола содержат лактозу. Данный препарат не следует принимать пациентам с непереносимостью сахаров (врожденная непереносимость галактозы, дефицит лактазы или синдром мальабсорбции глюкозы/галактозы).

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Риспаксол может повлиять на активную деятельность, для которой необходима быстрота реакций. Поэтому не следует управлять автомобилем или обслуживать механизмы, пока не выявлена индивидуальная переносимость препарата.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в защищенном от света, недоступном для детей месте, при температуре не выше 25°С.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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