Рисперидон



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]

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антипсихотическое средство (нейролептик), производное бензизоксазола. Обладает высоким сродством к серотониновым 5-HT_2- и допаминовым D_2-рецепторам. Связывается с α_1-адренорецепторами и, при несколько меньшей аффинности, с гистаминовыми H_1-рецепторами и α_2-адренорецепторами. Не обладает сродством к холинорецепторам. Хотя рисперидон является мощным D_2-антагонистом (что, как считается, является основным механизмом улучшения продуктивной симптоматики шизофрении), он вызывает менее выраженное подавление моторной активности и в меньшей степени индуцирует каталепсию, чем классические нейролептики. Благодаря сбалансированному антагонизму к серотониновым и допаминовым рецепторам в ЦНС, уменьшается вероятность развития экстрапирамидных побочных эффектов.

Рисперидон может индуцировать дозозависимое увеличение концентрации пролактина в плазме крови.

Фармакокинетика

После приема внутрь рисперидон полностью абсорбируется из ЖКТ, C_{max} в плазме достигается в пределах 1-2 ч. Пища не оказывает влияния на абсорбцию рисперидона.

C_{ss} рисперидона в организме у большинства пациентов достигается в течение 1 дня. C_{ss} 9-гидроксирисперидона достигается в течение 4-5 дней. Концентрации рисперидона в плазме пропорциональны дозе (в диапазоне терапевтических доз).

Рисперидон быстро распределяется в организме, V_d составляет 1-2 л/кг. В плазме рисперидон связывается с альбумином и альфа$_1$ гликопротеином. Связывание рисперидона с белками плазмы составляет 88%, 9-гидроксирисперидона - на 77%.

Рисперидон метаболизируется в печени при участии изофермента CYP2D6 с образованием 9-гидроксирисперидона, который обладает аналогичным рисперидону фармакологическим действием. Антипсихотическое действие обусловлено фармакологической активностью рисперидона и 9-гидроксирисперидона. Другим путем метаболизма рисперидона является N-дезалкилирование.

После приема внутрь у больных с психозом $T_{1/2}$ рисперидона из плазмы составляет 3 ч. $T_{1/2}$ 9-гидроксирисперидона и активной антипсихотической фракции составляет 24 ч.

Через 1 неделю приема 70% выводится с мочой, 14% - с калом. В моче суммарное содержание рисперидона и 9-гидроксирисперидона составляет 35-45%. Остальное количество приходится на неактивные метаболиты.

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

Показания к применению:

Лечение шизофрении (в т.ч. впервые возникший острый психоз, острый приступ шизофрении, хроническая шизофрения); психотические состояния с выраженной продуктивной (галлюцинации, бред, расстройства мышления, враждебность, подозрительность) и/или негативной (притупленный аффект, эмоциональная и социальная отрешенность, скудость речи) симптоматикой; для уменьшения аффективной симптоматики (депрессия, чувство вины, тревога) у пациентов с шизофренией; профилактика рецидивов (острых психотических состояний) при хроническом течении шизофрении; лечение поведенческих расстройств у пациентов с деменцией при проявлении симптомов агрессивности (вспышки гнева, физическое насилие), нарушениях психической деятельности (возбуждение, бред) или психотических симптомах; лечение маний при биполярных расстройствах (как стабилизатор настроения в качестве средства вспомогательной терапии).

Относится к болезням:

- Биполярное расстройство
- Деменция
- Депрессия
- Шизофрения

Противопоказания:

Повышенная чувствительность к рисперидону.

Способ применения и дозы:

Индивидуальный. При приеме внутрь начальная доза для взрослых составляет 0.25-2 мг/сут, на 2-й день - 4 мг/сут. Далее дозу можно либо сохранить на прежнем уровне, либо, при необходимости, скорректировать. Обычно оптимальная терапевтическая доза, в зависимости от показаний, находится в диапазоне 0.5-6 мг/сут. В ряде случаев может быть оправдано более медленное повышение дозы и более низкие начальная и поддерживающая дозы.

При шизофрении для пациентов пожилого возраста, а также при сопутствующих заболеваниях печени и почек рекомендуется начальная доза по 500 мкг 2 раза/сут. При необходимости дозу можно увеличить до 1-2 мг 2 раза/сут.

Максимальная доза: при применении рисперидона в дозе более 10 мг/сут не наблюдается повышения эффективности по сравнению с меньшими дозами, но возрастает риск развития экстрапирамидных симптомов. Безопасность применения рисперидона в дозах более 16 мг/сут не изучена, поэтому дальнейшее превышение дозы не допускается.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС: часто - бессонница, ажитация, тревога, головная боль; возможны - сонливость, утомляемость, головокружение, нарушение способности к концентрации внимания, нарушение четкости зрения; редко - экстрапирамидные симптомы, (в т.ч. тремор, ригидность, гиперсаливация, брадикинезия, акатизия, острая дистония). У больных с шизофренией возможны поздняя дискинезия, ЗНС, нарушения терморегуляции и судорожные припадки.

Со стороны пищеварительной системы: запор, диспептические явления, тошнота, рвота, абдоминальные боли, повышение активности печеночных ферментов.

Со стороны половой системы: приапизм, нарушения эрекции, нарушения эякуляции, нарушения оргазма.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: редко - ортостатическая гипотензия и рефлекторная тахикардия, артериальная гипертензия.

Со стороны эндокринной системы: галакторея, гинекомастия, нарушения менструального цикла, аменорея, увеличение массы тела.

Со стороны системы кроветворения: небольшое снижение количества нейтрофилов и/или тромбоцитов.

Аллергические реакции: ринит, кожная сыпь, ангионевротический отек.

Прочие: недержание мочи.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение при беременности возможно в случае, если ожидаемая польза терапии для матери превосходит потенциальный риск для плода. При необходимости применения в период лактации грудное вскармливание следует прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении индукторов микросомальных ферментов печени возможно уменьшение концентрации рисперидона в плазме крови.

При одновременном применении с производными фенотиазина, трициклическими антидепрессантами и бета-адреноблокаторами возможно повышение концентрации рисперидона в плазме крови.

При одновременном применении с карбамазепином значительно уменьшается концентрация рисперидона в плазме крови.

При одновременном применении рисперидон уменьшает эффекты леводопы и других агонистов допаминовых рецепторов.

При одновременном применении с флуоксетином возможно повышение концентрации рисперидона в плазме крови.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применять у пациентов с заболеваниями сердечно-сосудистой системы (в т.ч. при сердечной недостаточности, инфаркте миокарда, нарушениях проводимости сердечной мышцы), а также при обезвоживании, гиповолемии или цереброваскулярных нарушениях. У этой категории пациентов дозу следует увеличивать постепенно.

Риск развития ортостатической гипотензии особенно повышен в начальном периоде подбора дозы. При возникновении гипотензии следует рассмотреть вопрос о снижении дозы.

При применении препаратов, обладающих свойствами антагонистов допаминовых рецепторов, отмечалось возникновение поздней дискинезии, характеризующейся непроизвольными ритмическими движениями (преимущественно языка и/или лица). Имеются сообщения о том, что возникновение экстрапирамидных симптомов является фактором риска для развития поздней дискинезии. Рисперидон вызывает появление экстрапирамидных симптомов в меньшей степени, чем классические нейролептики. При появлении симптомов поздней дискинезии следует рассмотреть вопрос об отмене всех антипсихотических средств.

В случае развития ЗНС необходимо отменить все антипсихотические средства, включая рисперидон.

С осторожностью следует применять рисперидон у пациентов с болезнью Паркинсона, поскольку теоретически возможно ухудшение данного заболевания.

Известно, что классические нейролептики снижают порог судорожной готовности. Учитывая это, рисперидон рекомендуется с осторожностью применять у больных с эпилепсией.

Рисперидон следует применять с осторожностью в сочетании с другими препаратами центрального действия.

При отмене карбамазепина и других индукторов печеночных ферментов дозу рисперидона следует пересмотреть и, при необходимости, уменьшить.

В период лечения пациентам следует рекомендовать воздерживаться от переедания в связи с возможностью увеличения массы тела.

Данные о безопасности применения рисперидона у детей в возрасте до 15 лет отсутствуют.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения, до выяснения индивидуальной чувствительности к рисперидону, пациентам следует избегать вождения автотранспорта и другой деятельности, требующей высокой концентрации внимания и скорости психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

При шизофрении при сопутствующих заболеваниях почек рекомендуется начальная доза по 500 мкг 2 раза/сут. При

необходимости дозу можно увеличить до 1-2 мг 2 раза/сут.

При нарушениях функции печени

При шизофрении при сопутствующих заболеваниях печени рекомендуется начальная доза по 500 мкг 2 раза/сут. При необходимости дозу можно увеличить до 1-2 мг 2 раза/сут.

Применение в пожилом возрасте

При шизофрении для пациентов пожилого возраста рекомендуется начальная доза по 500 мкг 2 раза/сут. При необходимости дозу можно увеличить до 1-2 мг 2 раза/сут.

Применение в детском возрасте

Данные о безопасности применения рисперидона у детей в возрасте до 15 лет отсутствуют.

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