Рисполепт Конста



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:

Порошок для приготовления суспензии для в/м введения пролонгированного действия белого или почти белого цвета, свободный от видимых посторонних включений; приложенный растворитель прозрачный бесцветный, свободный от видимых механических включений; препарат должен легко образовывать суспензию в растворителе; в суспензии не должно быть комков или видимых включений; суспензия должна проходить через иглу плавно, с небольшим сопротивлением или без сопротивления.

	1 г микрогранул	**1 фл.**
рисперидон (в форме микрогранул пролонгированного высвобождения)	381 мг	25 мг

Вспомогательные вещества: сополимер молочной и гликолевой кислот - 619 мг (на 1 г микрогранул).

Растворитель: кармеллоза натрия 40 мПа.с - 22.5 мг, полисорбат 20 - 1 мг, натрия гидрофосфата дигидрат - 1.27 мг, лимонная кислота безводная - 1 мг, натрия хлорид - 6 мг, натрия гидроксид - 0.54 мг, вода д/и - до 1 мл.

Флаконы с пробкой розового цвета (1) в комплекте со шприцем, заполненным растворителем (2 мл), 1 безыгольным устройством Alaris Smart Site для приготовления суспензии, безопасной иглой Needle-Pro (с защитным устройством) д/в/м инъекции (1 шт.) - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.

Порошок для приготовления суспензии для в/м введения пролонгированного действия белого или почти белого цвета, свободный от видимых посторонних включений; приложенный растворитель прозрачный бесцветный, свободный от видимых механических включений; препарат должен легко образовывать суспензию в растворителе; в суспензии не должно быть комков или видимых включений; суспензия должна проходить через иглу плавно, с

небольшим сопротивлением или без сопротивления.

	1 г микрогранул	**1 фл.**
рисперидон (в форме микрогранул пролонгированного высвобождения)	381 мг	37.5 мг

Вспомогательные вещества: сополимер молочной и гликолевой кислот - 619 мг (на 1 г микрогранул).

Растворитель: кармеллоза натрия 40 мПа.с - 22.5 мг, полисорбат 20 - 1 мг, натрия гидрофосфата дигидрат - 1.27 мг, лимонная кислота безводная - 1 мг, натрия хлорид - 6 мг, натрия гидроксид - 0.54 мг, вода д/и - до 1 мл.

Флаконы с пробкой зеленого цвета (1) в комплекте со шприцем, заполненным растворителем (2 мл), 1 безыгольным устройством Alaris Smart Site для приготовления суспензии, безопасной иглой Needle-Pro (с защитным устройством) д/в/м инъекции (1 шт.) - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.

Порошок для приготовления суспензии для в/м введения пролонгированного действия белого или почти белого цвета, свободный от видимых посторонних включений; приложенный растворитель прозрачный бесцветный, свободный от видимых механических включений; препарат должен легко образовывать суспензию в растворителе; в суспензии не должно быть комков или видимых включений; суспензия должна проходить через иглу плавно, с небольшим сопротивлением или без сопротивления.

	1 г микрогранул	**1 фл.**
рисперидон (в форме микрогранул пролонгированного высвобождения)	381 мг	50 мг

Вспомогательные вещества: сополимер молочной и гликолевой кислот - 619 мг (на 1 г микрогранул).

Растворитель: кармеллоза натрия 40 мПа.с - 22.5 мг, полисорбат 20 - 1 мг, натрия гидрофосфата дигидрат - 1.27 мг, лимонная кислота безводная - 1 мг, натрия хлорид - 6 мг, натрия гидроксид - 0.54 мг, вода д/и - до 1 мл.

Флаконы с пробкой голубого цвета (1) в комплекте со шприцем, заполненным растворителем (2 мл), 1 безыгольным устройством Alaris Smart Site для приготовления суспензии, безопасной иглой Needle-Pro (с защитным устройством) д/в/м инъекции (1 шт.) - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Нейротропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антипсихотический препарат, производное бензизоксазола. Является селективным моноаминергическим антагонистом. Обладает высокой аффинностью к серотониновым 5-HT_2- и допаминовым D_2-рецепторам. Связывается с α_1-адренорецепторами и, в меньшей степени, с гистаминовыми H_1-рецепторами и α_2-адренорецепторами. Рисперидон не связывается с холинорецепторами. Рисперидон является мощным антагонистом допаминовых D_2-рецепторов, благодаря чему он улучшает позитивные симптомы шизофрении, но по сравнению с классическими нейролептиками в меньшей степени угнетает двигательную активность и реже вызывает каталепсию.

Благодаря сбалансированному центральному антагонизму в отношении серотониновых и допаминовых рецепторов рисперидон реже вызывает экстрапирамидные побочные эффекты и оказывает терапевтическое действие на негативные и аффективные симптомы шизофрении.

Фармакокинетика

Всасывание

Рисперидон полностью абсорбируется из суспензии Рисполепт Конста. После в/м инъекций препарата Рисполепт Конста в дозах 25 мг или 50 мг 1 раз в 2 недели средние значения C_{min} и C_{max} активной фракции составляют 9.9-19.2 нг/мл и 17.9-45.5 нг/мл соответственно. При таком режиме дозирования фармакокинетика рисперидона носит линейный характер.

После однократного в/м введения препарата Рисполепт Конста профиль высвобождения рисперидона состоит из небольшой начальной фазы (<1% дозы), за которой следует интервал продолжительностью 3 недели. После в/м инъекции основное высвобождение рисперидона начинается через 3 недели, поддерживается с 4 по 6 неделю и прекращается к 7 неделе. Таким образом, в течение первых 3 недель после начала лечения препаратом Рисполепт Конста пациент должен принимать дополнительный антипсихотический препарат.

Сочетание профиля высвобождения рисперидона и режима дозирования (в/м инъекция 1 раз в 2 недели) обеспечивает поддержание в плазме терапевтических концентраций рисперидона. Терапевтические концентрации сохраняются до 4-6 недели после последней инъекции препарата Рисполепт Конста.

Распределение

Рисперидон быстро распределяется в организме, V_d составляет 1-2 л/кг.

В плазме рисперидон связывается с альбумином и альфа$_1$-гликопротеином. Связывание с белками плазмы рисперидона составляет 90%, 9-гидроксирисперидона - 77%.

В длительном (12 мес) исследовании у пациентов, которым 1 раз в 2 недели вводили Рисполепт Конста в дозах 25 мг или 50 мг, кумуляция рисперидона не наблюдалась.

Метаболизм

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

Выведение

У быстрых метаболизаторов клиренс активной фракции и рисперидона составляет 5.0 и 13.7 л/ч соответственно, а у медленных метаболизаторов – 3.2 и 3.3 л/ч соответственно.

Фаза элиминации завершается примерно через 7-8 недель после последней инъекции.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Изучение применения рисперидона при приеме внутрь в однократной дозе показало более высокие концентрации в плазме и уменьшенный клиренс активной антипсихотической фракции на 30% у пациентов пожилого возраста и на 60% у пациентов с почечной недостаточностью. Концентрация рисперидона в плазме у пациентов с печеночной недостаточностью находилась в норме, но среднее значение свободной фракции в плазме увеличивалось на 35%.

Показания к применению:

— лечение и профилактика обострений шизофрении и шизоаффективных расстройств.

Относится к болезням:

- Шизофрения

Противопоказания:

— период лактации (грудного вскармливания);

— детский и подростковый возраст до 18 лет;

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью:*

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

— обезвоживание и гиповолемия;

— нарушения мозгового кровообращения;

— болезнь Паркинсона;

— судороги и эпилепсия (в т.ч. в анамнезе);

— почечная недостаточность тяжелой степени;

— печеночная недостаточность;

— злоупотребление лекарственными средствами или лекарственная зависимость;

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

— опухоль мозга, кишечная непроходимость, случаи острой передозировки лекарств, синдром Рейе (противорвотный эффект рисперидона может маскировать симптомы этих состояний);

— беременность.

Способ применения и дозы:

Рисполепт Конста вводят 1 раз в 2 недели глубоко в/м, используя для этого прилагаемую к шприцу стерильную иглу. Инъекции следует делать попеременно в правую и левую ягодицы. Препарат нельзя вводить в/в.

Взрослым рекомендуемая доза составляет 25 мг в/м 1 раз в 2 недели. Некоторым пациентам требуются более высокие дозы - 37.5 мг или 50 мг. В клинических исследованиях не наблюдалось увеличения эффективности при применении 75 мг. Максимальная доза не должна превышать 50 мг 1 раз в 2 недели.

В течение 3 недель после первого введения препарата Рисполепт Конста пациент должен принимать эффективное антипсихотическое средство.

Дозу препарата можно повышать не чаще, чем 1 раз в 4 недели. Эффект такого повышения дозы следует ожидать не раньше, чем через 3 недели после первой инъекции увеличенной дозы.

Для **пациентов пожилого возраста** рекомендуемая доза составляет 25 мг в/м 1 раз в 2 недели. В течение 3 недель после первого введения препарата Рисполепт Конста пациент должен принимать эффективное антипсихотическое средство.

В настоящее время нет данных о применении препарата Рисполепт Конста у **пациентов с нарушениями функции печени или почек**. Если все же необходимо применение Рисполепта Конста у данной категории пациентов, то в первую неделю рекомендуется принимать рисперидон внутрь в дозе 500 мкг 2 раза/сут в форме таблеток или раствора для приема внутрь. В течение второй недели пациент может принимать по 1 мг 2 раза/сут или 2 мг 1 раз/сут. Если пациент хорошо переносит пероральную дозу не менее 2 мг, то ему можно вводить Рисполепт Конста в/м в дозе 25 мг 1 раз в 2 недели.

Правила приготовления раствора

Применение препарата Рисполепт Конста требует строгого соблюдения указаний по приготовлению суспензии, чтобы обеспечить точное введение препарата и избежать возможных ошибок.

Для приготовления суспензии из находящихся во флаконе микрогранул Рисполепт Конста пролонгированного действия можно использовать только растворитель, находящийся в заранее заполненном шприце. Готовую суспензию вводят в/м только в ягодичную область. Нельзя заменять находящиеся в упаковке компоненты какими-либо другими изделиями. Для обеспечения применения полной дозы рисперидона должно быть введено все содержимое флакона. Введение части содержимого флакона не может обеспечить получение пациентом нужной дозы препарата. Препарат следует вводить сразу же после приготовления суспензии.

Упаковку препарата Рисполепта Конста достать из холодильника и дать ей нагреться в течение 30 мин до комнатной температуры перед приготовлением суспензии.

1. Снять цветную пластиковую крышку с флакона. Не удалять серую резиновую пробку. Протереть невскрытый флакон спиртовой салфеткой и дать высохнуть.

2. Вскрыть блистерную упаковку и извлечь безыгольное устройство Alaris™ Smart Site, удерживая его между белым люэровским колпачком и "юбкой". *Ни в коем случае нельзя прикасаться к острому наконечнику устройства.*

3. Очень важно, чтобы безыгольное устройство SmartSite было правильно установлено на флакон, иначе растворитель может подтекать при поступлении во флакон.

Поставьте флакон на твердую поверхность.

Придерживайте основание флакона. Направьте безыгольное устройство SmartSite на флакон вертикально таким образом, чтобы острый наконечник располагался в центре резиновой пробки флакона.

Надавливая сверху вниз, протолкните острый наконечник безыгольного устройства SmartSite через центр резиновой пробки флакона до надежного закрепления устройства на верхней части флакона.

4. Перед присоединением шприца к безыгольному устройству SmartSite, придерживая основание флакона, протереть место скрепления устройства со шприцем (голубой круг) спиртовой салфеткой и дать высохнуть.

5. Предварительно заполненный шприц имеет белый наконечник, состоящий из двух частей: белого воротничка и глянцевого белого колпачка. Для того, чтобы вскрыть шприц, держите шприц за белый воротничок и отломите глянцевый белый колпачок *(белый колпачок нельзя откручивать или отрезать).* Снять белый колпачок вместе с находящимся внутри него резиновым наконечником.

На всех этапах сборки шприц следует держать только за белый воротничок, расположенный на наконечнике шприца. Фиксация белого воротничка поможет предохранить сам воротничок от отделения и гарантирует хорошее соединение со шприцем. Не перекручивать компоненты при сборке, т.к. при этом части шприца могут оторваться от

него.

6. Придерживая шприц за белый воротничок, следует вставить шприц в голубой круг безыгольного устройства, нажать и повернуть по часовой стрелке для того, чтобы шприц прочно соединился с безыгольным устройством (необходимо избегать перекручивания). Для предотвращения вращения безыгольного устройства во время соединения со шприцем следует прочно удерживать "юбку". *Шприц и безыгольное устройство должны находиться на одной линии.*

7. Ввести во флакон все содержимое шприца с растворителем.

8. Придерживая поршень шприца большим пальцем, следует энергично встряхивать содержимое флакона не менее 10 сек до образования однородной суспензии. После правильного перемешивания суспензия становится однородной, густой, молочного цвета. Микрогранулы могут быть видны в жидкости, но не должно оставаться несмоченных растворителем сухих микрогранул.

Нельзя хранить флакон после приготовления суспензии, поскольку суспензия может расслоиться.

9. Перевернуть флакон дном вверх и медленно втянуть в шприц все содержимое флакона. Отделить часть этикетки от флакона по линии перфорации и приклеить ее к шприцу (для идентификации).

10. Придерживая шприц за белый воротничок, отсоединить шприц от безыгольного устройства. Следует утилизировать флакон и безыгольное устройство в соответствии с местными правилами по уничтожению такого рода отходов.

11. Вскрыть блистерную упаковку иглы Needle-Pro. Нельзя дотрагиваться до части иглы, присоединяющейся к шприцу. Извлечь иглу из упаковки, держа ее за прозрачный футляр.

12. Для предотвращения попадания микробов не следует касаться люэровского наконечника оранжевого защитного устройства иглы Needle-Pro. Придерживая шприц за белый воротничок, присоединить люэровскую канюлю оранжевого защитного устройства иглы Needle-Pro к шприцу легким поворотом по часовой стрелке.

13. Продолжая придерживать шприц за белый воротничок, зажать прозрачный футляр иглы и плотно закрепить иглу в защитном устройстве Needle-Pro путем нажатия и поворота по часовой стрелке. Закрепление иглы может гарантировать безопасное соединение между иглой и защитным устройством иглы Needle-Pro во время проведения следующих этапов.

14. Непосредственно перед введением препарат Рисполепт Конста следует ресуспендировать, поскольку после приготовления суспензии во флаконе часть микрогранул может осесть. Для ресуспендирования микрогранул следует энергично встряхнуть шприц.

15. Придерживая шприц за белый воротничок, снять прозрачный футляр с иглы. Не сгибать футляр, т.к. при этом соединение люэровского наконечника может быть нарушено.

16. Слегка постучать пальцем по шприцу, чтобы находящиеся в нем пузырьки воздуха поднялись вверх. Слегка продвигая поршень вверх, удалить из шприца и иглы пузырьки воздуха, держа шприц так, чтобы игла была направлена вертикально вверх. Ввести все содержимое шприца в верхний наружный квадрант ягодичной области. Суспензию нельзя вводить в/в!

Предостережение: во избежание травмирования медицинского персонала использованной иглой:

- не дотрагиваться свободной рукой до устройства защиты иглы Needle-Pro во время прижимания его к плоской поверхности;

- не разбирать устройство защиты иглы Needle-Pro;

- не пытаться выпрямить иглу и не касаться устройства защиты иглы Needle-Pro, если игла погнулась или повреждена;

- следует использовать устройство защиты игл Needle-Pro только по назначению, иначе игла может выступить из защитного колпачка.

17. После выполнения инъекции следует ввести иглу в оранжевое устройство защиты иглы Needle-Pro одной рукой. Для этого следует аккуратно прижать оранжевое устройство защиты иглы Needle-Pro к плоской поверхности. Как только оранжевое устройство защиты иглы Needle-Pro прижато, игла должна плотно войти в устройство защиты иглы Needle-Pro. Перед тем, как выбросить иглу, следует убедиться в том, что игла плотно закреплена в оранжевом устройстве защиты иглы Needle-Pro. Утилизация проводится в соответствии с местными правилами по уничтожению такого рода отходов.

Не использовать повторно: данное устройство предназначено только для однократного использования. Любая попытка последующего повторного использования может неблагоприятно повлиять на целостность самого устройства или привести к ухудшению его работы.

Побочное действие:

Определение частоты побочных реакций: очень часто (≥1/10), часто (от ≥1/100 и <1/10), нечасто (≥1/1000 и <1/100), редко (≥1/10 000 и <1/1000), очень редко (от <1/10 000).

Инфекции: часто - инфекции верхних дыхательных путей; нечасто - назофарингит, гриппоподобные инфекции, бронхит, инфекции мочевыводящих путей, ринит, инфекции уха, пневмония, инфекции дыхательных путей (в т.ч. нижних), фарингит, синусит, вирусные инфекции, локализованные инфекции, цистит, гастроэнтерит, подкожный абсцесс.

Со стороны системы кроветворения: нечасто - нейтропения, анемия; очень редко - агранулоцитоз, тромбоцитопения.

Аллергические реакции: нечасто - гиперчувствительность; очень редко - отек Квинке (в т.ч. периоральный отек, отек век, отек лица, наследственный отек Квинке, отек гортани и глотки, окуло-респираторный синдром, отек рта, окологлазничный отек, отек тонкой кишки, отек языка), анафилактический шок.

Со стороны эндокринной системы: нечасто - гиперпролактинемия; редко - нарушение секреции АДГ.

Со стороны обмена веществ: часто - повышенный аппетит, сниженный аппетит; нечасто - анорексия, гипергликемия; очень редко - диабетический кетоацидоз, сахарный диабет, гипогликемия, водная интоксикация.

Со стороны нервной системы: очень часто - головная боль, паркинсонизм (включая экстрапирамидные расстройства, мышечную ригидность, гипокинезию, ригидность по типу "зубчатого колеса", брадикинезию, мышечные судороги), головокружение, акатизия, включая беспокойство), тремор; часто - сонливость, седативный эффект, обморок, гипестезия, нарушения внимания; нечасто - нарушение координации, дистония, поздняя дискинезия, заторможенность, слюнотечение, парестезия, постуральное головокружение, повышенная сонливость, судороги, акинезия, дизартрия.

Психические нарушения: нечасто - бессонница, беспокойство, возбуждение, депрессия, нарушение сна, нарушение засыпания, уменьшение либидо, нервозность; очень редко - мании.

Со стороны органов чувств: часто - затуманенность зрения; нечасто - конъюнктивит, уменьшение остроты зрения, боль в ухе, вертиго; очень редко - окклюзия артерии сетчатки (наблюдается при наличии внутрисердечного дефекта, предрасполагающего к шунту справа налево, например, "овальное окно").

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - артериальная гипертензия; нечасто - тахикардия, AV-блокада I степени, ощущение сердцебиения, синусовая брадикардия, блокада правой и левой ножек пучка Гиса, синусовая тахикардия, снижение АД, ортостатическая гипотензия; очень редко - мерцательная аритмия.

Со стороны дыхательной системы: часто - кашель, заложенность носовых пазух; нечасто - заложенность носа, боли в глотке и в гортани, одышка, ринорея; очень редко - синдром апноэ во сне.

Со стороны пищеварительной системы: часто - запор, сухость во рту, диспепсия, тошнота, зубная боль, гиперсекреция слюны; нечасто - диарея, рвота, боли в животе (в т.ч. в верхней части живота), дискомфорт в желудке, гастрит, дисгевизия; очень редко - непроходимость кишечника, панкреатит, желтуха.

Со стороны кожи и подкожных тканей: часто - акне, сухость кожи; нечасто - высыпания, экзема, зуд (в т.ч. генерализованный); очень редко - алопеция.

Со стороны костно-мышечной системы: часто - боли в конечностях, артралгия; нечасто - нарушение осанки, боли в спине, миалгия, мышечные боли в груди, боли в ягодицах, мышечная слабость, боли в шее.

Со стороны мочевыделительной системы: нечасто - недержание мочи; очень редко - задержка мочевыделения.

Нарушения со стороны репродуктивной системы: нечасто - галакторея, олигоменорея, аменорея, эректильная дисфункция, сексуальная дисфункция, нарушения эякуляции, гинекомастия, дискомфорт в груди, нарушение менструаций, замедленная эякуляция; очень редко - приапизм.

Влияние на течение беременности: очень редко - синдром отмены у новорожденных.

Общие нарушения: часто - усталость, астения, периферические отеки, боли, гипертермия; нечасто - падения, дискомфорт и боли в области грудной клетки, гриппоподобное состояние, медлительность, недомогание; очень редко - гипотермия.

Местные реакции: нечасто - боль во время инъекции, боли в месте введения, уплотнение, отек и другие реакции в месте инъекции; очень редко - реакции в месте введения инъекции, такие как абсцесс, флегмона, киста, гематома, некроз, узелки, язва (данные побочные действие отмечались как серьезные, в некоторых случаях требовали хирургического вмешательства).

Со стороны лабораторных и инструментальных показателей: часто **-** увеличение или уменьшение массы тела; *нечасто* — увеличение концентрации пролактина в крови, увеличение активности АЛТ, АСТ, увеличение концентрации глюкозы, нарушения ЭКГ, удлинение интервала QT на ЭКГ, обнаружение глюкозы в моче, увеличение уровня холестерина в крови, увеличение уровня триглицеридов в крови.

Ниже дополнительно перечислены побочные реакции, наблюдавшиеся при применении пероральных форм рисперидона.

Инфекции: тонзиллит, инфекции глаз, флегнома, средний отит (в т.ч. хронический), онихомикоз, акродерматит, бронхопневмония, трахеобронхит.

Со стороны системы кроветворения: гранулоцитопения.

Аллергические реакции: гиперчувствительность к препарату.

Со стороны обмена веществ: полидипсия.

Психические нарушения: уплощения аффекта, спутанность сознания, бессонница, апатичность, аноргазмия.

Со стороны нервной системы: артериальная гипертензия, нарушение равновесия, отсутствие реакции на стимулы, снижение сознания, нарушение движений, паркинсонический тремор, транзиторная ишемическая атака, инфаркт миокарда, инсульт, нарушение речи, потеря сознания, непроизвольные мышечные сокращения, ишемия головного мозга, цереброваскулярные нарушения, ЗНС, диабетическая кома, ритмичное кивание головой

Со стороны органов чувств: гиперемия глаза, выделения из глаз, вращения глаз, отек век, припухлость глаз, образование корки на краях век, сухость глаз, усиленное слезотечение, светобоязнь, глаукома, шум в ушах.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: AV-блокада, "приливы" крови.

Со стороны дыхательной системы: носовое кровотечение, свистящее дыхание, аспирационная пневмония, дисфония, продуктивный кашель, застой крови в легких, застой крови в дыхательных путях, хрипы, нарушения дыхания, гипервентиляция, отек носа.

Со стороны пищеварительной системы: дисфагия, фекалома, дискомфорт в желудке, недержание стула, опухание губ, хейлит, аптиализм.

Со стороны кожи и подкожных тканей: эритема, нарушение пигментации кожи, повреждение кожи, эритематозные высыпания, папулезные высыпания, гиперкератоз, перхоть, себорейный дерматит, генерализованная сыпь, макуло-папулезная сыпь.

Со стороны костно-мышечной системы: опухание суставов, скованность в суставах, рабдомиолиз, кривошея.

Со стороны мочевыделительной системы: недержание мочи, расстройство мочеиспускания, поллакиурия.

Со стороны репродуктивной системы: выделения из влагалища, ретроградная эякуляция, отсутствие эякуляции, увеличение молочных желез.

Общие нарушения: жажда, плохое самочувствие, нарушение походки, отек с возникновением ямки при надавливании, озноб, отек лица, дискомфорт, общий отек, синдром отмены препарата, похолодание конечностей.

Со стороны лабораторных и инструментальных показателей: повышение температуры тела, тахикардия, увеличение количества эозинофилов в крови, увеличение количества лейкоцитов в крови, уменьшение гемоглобина, увеличение активности КФК в плазме, уменьшение гематокрита, снижение АД, уменьшение температуры тела, увеличение активности печеночных трансаминаз.

Передозировка:

При применении парентеральных лекарственных форм рисперидона передозировка менее вероятна, чем при применении пероральных форм (таблетки, покрытые пленочной оболочкой, и раствор для приема внутрь), поэтому имеются данные о передозировке пероральных форм.

Симптомы являются следствием усиления фармакологических эффектов рисперидона: седативный эффект, сонливость, тахикардию, понижение АД и экстрапирамидные расстройства, удлинение интервала QT и судороги. Двунаправленная желудочковая тахикардия отмечалась при одновременном приеме повышенной дозы перорального рисперидона и пароксетина. В случае передозировки следует учитывать возможность вовлечения нескольких препаратов.

Лечение: необходимо обеспечить и поддерживать проходимость дыхательных путей, адекватную оксигенацию и вентиляцию. Необходим мониторинг функции сердечно-сосудистой системы, который должен включать постоянный контроль ЭКГ для выявления возможных аритмий.

Рисперидон не имеет специфического антидота, поэтому лечение должно быть направлено на поддержание функции ЦНС и сердечно-сосудистой системы, кроме того проводят дезинтоксикационную терапию. При тяжелых экстрапирамидных симптомах необходимо вводить антихолинергические препараты. Медицинское наблюдение и мониторинг следует продолжать до исчезновения симптомов передозировки.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Данных о безопасности применения рисперидона у беременных женщин нет.

В *экспериментальных исследованиях* на животных рисперидон не оказывал прямого токсического действия на репродуктивную систему, но вызывал некоторые косвенные эффекты, опосредованные через пролактин и ЦНС. Ни в одном из исследований рисперидон не обладал тератогенным действием.

В случае, если женщина принимала антипсихотические препараты (включая Рисполепт) в III триместре беременности, у новорожденных существует риск возникновения экстрапирамидных расстройств и/или синдрома отмены различной степени тяжести. Эти симптомы могут включать ажитацию, гипертонию, гипотонию, тремор, сонливость, респираторные нарушения и нарушение вскармливания.

Рисполепт Конста можно применять при беременности только в том случае, если ожидаемая польза терапии для матери превышает потенциальный риск для плода.

Противопоказано применение в период лактации (грудного вскармливания).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Рисполепт Конста повышает выраженность угнетающего влияния на ЦНС опиоидных анальгетиков, снотворных средств, анксиолитиков, трициклических антидепрессантов, средств для общей анестезии, этанола.

Рисполепт Конста может ослаблять действие леводопы и других агонистов допаминовых рецепторов.

Клинически значимая артериальная гипотензия наблюдается при совместном применении рисперидона с антигипертензивными средствами.

Следует соблюдать осторожность при совместном применении препарата Рисполепт Конста с лекарственными препаратами, увеличивающими интервал QT.

Установлено, что карбамазепин снижает содержание в плазме активной антипсихотической фракции рисперидона. Сходные эффекты могут вызывать и другие индукторы микросомальных ферментов печени. При назначении и после отмены карбамазепина или других индукторов микросомальных ферментов печени следует скорректировать дозу препарата Рисполепт Конста.

Флуоксетин и пароксетин, ингибиторы микросомальных ферментов печени, увеличивают концентрацию рисперидона в плазме, но в меньшей степени концентрацию активной антипсихотической фракции. При назначении и после отмены флуоксетина или пароксетина следует скорректировать дозу препарата Рисполепт Конста.

Топирамат умеренно уменьшает биодоступность рисперидона, но не активной антипсихотической фракции. Данное взаимодействие не считается клинически значимым.

Фенотиазины, трициклические антидепрессанты и некоторые бета-адреноблокаторы могут увеличивать концентрацию рисперидона в плазме, но в меньшей степени концентрацию активной антипсихотической фракции.

Циметидин и ранитидин увеличивают биодоступность рисперидона, но в минимальной степени влияют на концентрацию активной антипсихотической фракции.

Эритромицин (ингибитор индукторов микросомальных ферментов печени) не влияет на фармакокинетику рисперидона и активной антипсихотической фракции.

Ингибиторы холинэстеразы (галантамин и донепезил) не оказывают клинически значимого действия на фармакокинетику рисперидона и активной антипсихотической фракции.

При совместном приеме с препаратами, обладающими высоким связыванием с белками плазмы, не наблюдается клинически значимого вытеснения препарата из связи с белками плазмы.

Рисперидон не оказывает клинически значимого действия на фармакокинетику лития, вальпроевой кислоты, дигоксина или топирамата.

Фармацевтическое взаимодействие

Рисполепт Конста нельзя смешивать или разводить никакими другими препаратами и жидкостями помимо специального растворителя, содержащегося в упаковке.

Особые указания и меры предосторожности:

У пациентов, которые ранее не получали рисперидон, рекомендуется определить переносимость пероральных лекарственных форм, прежде чем приступать к лечению препаратом Рисполепт Конста.

Применение у пациентов пожилого возраста с деменцией

Общая смертность. У пациентов пожилого возраста с деменцией при лечении атипичными антипсихотическими средствами наблюдалась повышенная смертность по сравнению с плацебо в мета-анализе 17 контролируемых исследований атипичных антипсихотических средств, включая рисперидон. В плацебо-контролируемых исследованиях пероральных форм рисперидона для данной популяции частота смертельных случаев составила 4% для пациентов, принимающих рисперидон, по сравнению с 3.1% для плацебо. Средний возраст умерших пациентов составляет 86 лет (диапазон 67-100 лет).

Одновременное применение с фуросемидом. Для пациентов пожилого возраста с деменцией, получающих пероральные формы рисперидона, в плацебо-контролируемых исследованиях наблюдалась повышенная смертность у пациентов, принимавших фуросемид и рисперидон (7.3%, средний возраст 89 лет, диапазон 75-97 лет) по сравнению с группой пациентов, получавших только рисперидон (4.1%, средний возраст 84 года, диапазон 70-96 лет) и группой пациентов, получавших только фуросемид (3.1%, средний возраст 80 лет, диапазон 67-90 лет). У пациентов, принимавших фуросемид и рисперидон, в 2 из 4 клинических исследований наблюдалось увеличение количества смертельных исходов. Не установлено патофизиологических механизмов, объясняющих данное наблюдение. Тем не менее, следует соблюдать особую осторожность при назначении препарата в таких случаях. Не обнаружено увеличения смертности у пациентов, одновременно принимающих другие диуретики вместе с рисперидоном. Независимо от лечения, обезвоживание является общим фактором риска смертности и должно тщательно контролироваться у пациентов пожилого возраста с деменцией.

Побочные эффекты со стороны цереброваскулярной системы. В плацебо-контролируемых исследованиях у пациентов пожилого возраста с деменцией наблюдалось увеличение количества побочных эффектов со стороны цереброваскулярной системы (острые и преходящие нарушения мозгового кровообращения), в т.ч. смертельные случаи у пациентов (средний возраст 85 лет, диапазон 73-97 лет) при применении рисперидона по сравнению с плацебо.

Поздняя дискинезия/экстрапирамидные симптомы

Препараты, обладающие свойствами антагонистов допаминовых рецепторов, могут вызывать позднюю дискинезию, которая характеризуется ритмическими непроизвольными движениями, преимущественно языка и/или лица. В случае возникновения объективных и субъективных симптомов поздней дискинезии необходимо отменить Рисполепт Конста, а также другие антипсихотические препараты (если они применялись).

ЗНС

Известно, что классические нейролептики могут вызывать ЗНС, который характеризуется гипертермией, ригидностью мышц, нестабильностью вегетативной нервной системы, угнетением сознания и повышением концентрации КФК в сыворотке. В случае возникновения ЗНС необходимо отменить все антипсихотические препараты, включая рисперидон. Следует также учитывать, что после последней инъекции препарата Рисполепт Конста рисперидон присутствует в плазме до (минимум) 6 недель.

Гипергликемия и сахарный диабет

При лечении препаратом Рисполепт Конста наблюдались гипергликемия, сахарный диабет или обострение уже имеющегося сахарного диабета. Выявление взаимосвязи между применением атипичных антипсихотических препаратов и нарушениями обмена глюкозы осложнено повышенным риском развития сахарного диабета у пациентов с шизофренией и распространенностью сахарного диабета в общей популяции. Учитывая эти факторы, взаимосвязь между применением атипичных антипсихотических препаратов и развитием побочных реакций, связанных с гипергликемией, установлена не полностью. У всех пациентов необходимо проводить клинический контроль на наличие симптомов гипергликемии и сахарного диабета.

Увеличение массы тела

При лечении препаратом Рисполепт наблюдалось значительное увеличение массы тела. Необходимо проводить контроль массы тела пациентов во время терапии препаратом Рисполепт.

Интервал QT

Как и для других антипсихотических средств, следует соблюдать осторожность при назначении Рисполепт Конста пациентам с аритмиями в анамнезе, пациентам с врожденным удлинением интервала QT и при совместном применении с препаратами, увеличивающими интервал QT.

Предосторожности при введении препарата

Необходимо соблюдать осторожность во избежание случайного введения препарата Рисполепт Конста в кровеносный сосуд.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Рисперидон может снижать скорость психических и физических реакций, поэтому в период лечения пациентам следует избегать вождения автотранспорта и другой деятельности, требующей высокой концентрации внимания и скорости психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

В настоящее время нет данных о применении препарата Рисполепт Конста у пациентов с нарушениями функции почек.

При нарушениях функции печени

В настоящее время нет данных о применении препарата Рисполепт Конста у пациентов с нарушениями функции печени.

Применение в пожилом возрасте

Для **пациентов пожилого возраста** рекомендуемая доза составляет 25 мг в/м 1 раз в 2 недели. В течение 3 недель после первого введения препарата Рисполепт Конста (т.е. до начала действия препарата) пациент должен принимать эффективное антипсихотическое средство.

Применение в детском возрасте

Противопоказание: детский и подростковый возраст до 18 лет.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей, защищенном от света месте при температуре от 2° до 8°С.

Нельзя подвергать препарат воздействию температуры выше 25°С. При отсутствии холодильника Рисполепт Конста перед использованием можно хранить при температуре не выше 25°С не более 7 дней.

Приготовленная суспензия физически и химически стабильна в течение 24 ч при температуре 25°С. С микробиологической точки зрения, суспензию желательно использовать сразу же после приготовления. Если суспензию не используют сразу после приготовления, то ее можно хранить не более 6 ч при температуре 25 °С.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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