Рисполепт (таблетки)



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, продолговатые, двояковыпуклые, с риской, с надписями "Ris" и "1" на одной стороне.

	1 таб.
рисперидон	1 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 131 мг, крахмал кукурузный - 44 мг, гипромеллоза 2910 15 мПа.с - 2 мг, натрия лаурилсульфат - 0.4 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 20 мг, магния стеарат - 1 мг, кремния диоксид коллоидный - 0.6 мг.

Состав оболочки: гипромеллоза 2910 5 мПа.с - 4 мг, пропиленгликоль - 1 мг.

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

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой светло-оранжевого цвета, продолговатые, двояковыпуклые, с риской, с надписями "Ris" и "2" на одной стороне.

	1 таб.
рисперидон	2 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 130 мг, крахмал кукурузный - 44 мг, гипромеллоза 2910 15 мПа.с - 2 мг, натрия лаурилсульфат - 0.4 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 20 мг, магния стеарат - 1 мг, кремния диоксид коллоидный - 0.6 мг.

Состав оболочки: гипромеллоза 2910 5 мПа.с - 4 мг, пропиленгликоль - 1 мг, тальк - 1.2 мг, титана диоксид - 2 мг, краситель солнечный закат желтый (E110) - 0.05 мг.

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

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой желтого цвета, продолговатые, двояковыпуклые, с риской, с надписями "Ris" и "3" на одной стороне.

	1 таб.
рисперидон	3 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 195 мг, крахмал кукурузный - 66 мг, гипромеллоза 2910 15 мПа.с - 3 мг, натрия лаурилсульфат - 0.6 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 30 мг, магния стеарат - 1.5 мг, кремния диоксид коллоидный - 0.9 мг.

Состав оболочки: гипромеллоза 2910 5 мПа.с - 5.2 мг, пропиленгликоль - 1.3 мг, тальк - 1.56 мг, титана диоксид - 2.6 мг, краситель хинолиновый желтый (Е104) - 0.052 мг.

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

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой зеленого цвета, продолговатые, двояковыпуклые, с риской, с надписями "Ris" и "4" на одной стороне.

	1 таб.
рисперидон	4 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 260 мг, крахмал кукурузный - 88 мг, гипромеллоза 2910 15 мПа.с - 4 мг, натрия лаурилсульфат - 0.8 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 40 мг, магния стеарат - 2 мг, кремния диоксид коллоидный - 1.2 мг.

Состав оболочки: гипромеллоза 2910 5 мПа.с - 6.8 мг, пропиленгликоль - 1.7 мг, тальк - 2.04 мг, титана диоксид - 3.4 мг, краситель хинолиновый желтый (Е104) - 0.068 мг, индигокармин (Е132) - 0.68 мг.

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

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

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

Рисперидон - селективный моноаминергический антагонист, обладает высокой аффинностью к серотониновым 5-HT_2- и допаминовым D_2-рецепторам. Связывается с α_1-адренорецепторами и несколько слабее - 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.

Рисперидон снижает продуктивную симптоматику шизофрении (бред, галлюцинации), агрессивность, 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 и расширять терапевтическое воздействие препарата на негативные и аффективные симптомы шизофрении.

Рисперидон может вызывать дозозависимое увеличение концентрации пролактина в плазме.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь рисперидон полностью абсорбируется из ЖКТ. C_{max} в плазме достигается через 1-2 ч. Пища не оказывает влияния на абсорбцию препарата, поэтому Рисполепт можно назначать независимо от приема пищи.

Распределение

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

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

C_{ss} 9-гидрокси-рисперидона достигается в течение 4-5 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 у больных с психозом $T_{1/2}$ рисперидона из плазмы составляет около 3 ч. $T_{1/2}$ 9-гидрокси-рисперидона и активной антипсихотической фракции составляют 24 ч.

Через неделю приема препарата 70% дозы выводится с мочой, 14% - с калом. В моче рисперидон плюс 9-гидрокси-рисперидон составляют 35-45% дозы. Остальное количество составляют неактивные метаболиты.

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.

У пациентов с печеночной недостаточностью концентрация рисперидона в плазме не изменялась.

Показания к применению:

Купирование острых приступов и длительная поддерживающая терапия:

— острой и хронической шизофрении и других психотических расстройств с продуктивной и негативной симптоматикой;

— аффективных расстройств при различных психических заболеваниях;

— поведенческих расстройств у пациентов с деменцией при проявлении симптомов агрессии (вспышки гнева, физическое насилие), нарушениях деятельности (возбуждение, бред) или психотических симптомах;

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

Для стабилизации настроения при лечении маний при биполярных расстройствах (в качестве средства вспомогательной терапии).

Относится к болезням:

- Биполярное расстройство
- Деменция
- Шизофрения

Противопоказания:

— период лактации (грудное вскармливание);

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

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** Рисполепт можно назначать 1 или 2 раза/сут. Начальная доза препарата Рисполепт – 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.

К терапии препаратом Рисполепт можно добавить бензодиазепины, если требуется дополнительный седативный эффект.

Данные о применении препарата Рисполепт 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 или с доминированием в клинической картине деструктивных тенденций* пациентам **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 предпочтителен прием по 500 мкг/сут, тогда как некоторым требуется увеличение дозы до 1.5 мг/сут.

Пациентам **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 предпочтителен прием по 250 мкг/сут, тогда как некоторым требуется увеличение дозы до 750 мкг/сут.

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). У больных с шизофренией возможны гиперволемия (либо из-за полидипсии, либо из-за синдрома неадекватной секреции АДГ), 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 и рефлекторная тахикардия, повышение АД. На фоне терапии Рисполептом 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.

Аллергические реакции: ринит, кожная сыпь, ангионевротический отек.

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

Прочие: артралгия.

Передозировка:

Симптомы: сонливость, проявления седативного действия, тахикардия, артериальная гипотензия, экстрапирамидные симптомы. Сообщалось о приеме до 360 мг препарата. Полученные данные позволяют предположить широкий спектр безопасности препарата. В редких случаях при передозировке отмечалось удлинение интервала QT.

В случае острой передозировки при комбинированной терапии следует проанализировать возможность вовлечения других препаратов.

Лечение: следует обеспечить свободную проходимость дыхательных путей для обеспечения адекватного снабжения кислородом и вентиляции. Показано промывание желудка (после интубации, если больной без сознания) и назначение активированного угля вместе со слабительным. Следует немедленно начать мониторирование ЭКГ для выявления возможных нарушений сердечного ритма.

Специфического антидота не существует, следует проводить соответствующую симптоматическую терапию. При артериальной гипотензии и сосудистом коллапсе следует вводить в/в инфузионные растворы и/или применять симпатомиметические препараты. В случае развития острых экстрапирамидных симптомов следует назначить антихолинергические препараты. Постоянное медицинское наблюдение и мониторирование следует продолжать до исчезновения симптомов интоксикации.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Безопасность применения препарата Рисполепт при беременности не изучена. Применение препарата Рисполепт 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 Рисполепт оказывает воздействие в первую очередь на ЦНС, его следует применять с осторожностью в сочетании с другими препаратами центрального действия и алкоголем.

Рисполепт уменьшает эффективность леводопы и других агонистов допамина.

Клозапин снижает клиренс рисперидона.

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

При применении Рисполепта 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 Рисполепта.

Особые указания и меры предосторожности:

При шизофрении в начале лечения препаратом Рисполепт рекомендуется постепенно отменить предыдущую терапию, если это клинически оправдано. При этом, если пациенты переводятся с терапии депо формами антипсихотических препаратов, то терапию Рисполептом рекомендуется начинать вместо следующей

запланированной инъекции. Периодически следует оценивать необходимость в продолжении текущей терапии антипаркинсоническими препаратами.

В связи с альфа-адреноблокирующим действием препарата Рисполепт 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.

Имеются сообщения о том, что возникновение экстрапирамидных симптомов является фактором риска для развития поздней дискинезии. Рисполепт реже вызывает появление экстрапирамидных симптомов, чем классические нейролептики. Если возникают признаки и симптомы поздней дискинезии, следует рассмотреть вопрос об отмене всех антипсихотических препаратов.

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

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

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

Использование в педиатрии

Данные о безопасности и эффективности применения препарата Рисполепт у **детей младше 15 лет** отсутствуют, поэтому назначение препарата данной категории пациентов не рекомендуется. Длительный прием препарата Рисполепт у **подростков** следует проводить под постоянным контролем врача.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

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

При нарушениях функции почек

С осторожностью следует применять препарат у пациентов с почечной недостаточностью тяжелой степени.

При нарушениях функции печени

С осторожностью следует применять препарат у пациентов с тяжелой печеночной недостаточностью.

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 препарата Рисполепт у **детей младше 15 лет** отсутствуют, поэтому назначение препарата данной категории пациентов не рекомендуется. Длительный прием препарата Рисполепт у **подростков** следует проводить под постоянным контролем врача.

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре от 15° до 30°С.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.