Риссет



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 светло-оранжевого цвета, круглые, двояковыпуклые, с риской на одной стороне.

	1 таб.
рисперидон	2 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 66 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 28.243 мг, крахмал кукурузный - 17.243 мг, карбоксиметилкрахмал натрия - 5 мг, тальк - 757 мкг, магния стеарат - 757 мкг.

Состав пленочной оболочки: опадрай II 31F58914 белый (гипромеллоза, лактозы моногидрат, титана диоксид (E171), макрогол 4000, натрия цитрата дигидрат) - 4.972 мг, краситель солнечный закат желтый (E110) - 28 мкг.

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

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой зеленого цвета, круглые, двояковыпуклые, с риской на одной стороне.

	1 таб.
рисперидон	4 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 132 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 56.486 мг, крахмал кукурузный - 34.486 мг, карбоксиметилкрахмал натрия - 10 мг, тальк - 1.514 мг, магния стеарат - 1.514 мг.

Состав пленочной оболочки: опадрай II 31F58914 белый (гипромеллоза, лактозы моногидрат, титана диоксид (E171), макрогол 4000, натрия цитрата дигидрат) - 9.91 мг, краситель хинолиновый желтый (E104) - 75 мкг, индигокармин (E132) - 15 мкг.

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

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антипсихотический препарат (нейролептик), производное бензизоксазола. Оказывает также седативное, противорвотное и гипотермическое действие. Селективный моноаминергический антагонист, обладает высокой тропностью к серотониновым 5-HT_2-рецепторам и допаминовым D_2-рецепторам, связывается также с α_1-адренорецепторами и с несколько меньшей аффинностью 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.

Подавляет продуктивную симптоматику (бред, галлюцинации, агрессивность), автоматизм. Вызывает меньшее 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 с охватом негативных и аффективных симптомов шизофрении. Может индуцировать зависящее от дозы увеличение концентрации пролактина в плазме.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь абсорбция быстрая и полная (пища не влияет на полноту и скорость абсорбции). Абсолютная биодоступность - 74%, относительная - 94%. T_{max} рисперидона - 1 ч, 9-гидроксирисперидона - 3 ч (при высокой активности изофермента CYP2D6) и 17 ч (при низкой активности изофермента CYP2D6).

Распределение

C_{ss} рисперидона в организме у большинства пациентов достигается в течение 1 дня, а 9-гидроксирисперидона - 4-5 дней. Концентрации рисперидона и 9-гидроксирисперидона в плазме пропорциональны дозе препарата (в пределах 1-16 мг/сут). Быстро распределяется в организме, проникает в ЦНС, грудное молоко. V_d - 1-2 л/кг. Связывание с белками плазмы (с альфа$_1$-кислым гликопротеином и альбуминами) рисперидона - 90%, 9-гидроксирисперидона - 77%.

Метаболизм

Метаболизируется изоферментом CYP2D6 до активного метаболита 9-гидроксирисперидона (рисперидон и 9-гидроксирисперидон составляют активную антипсихотическую фракцию). Другим путем метаболизма является N-дезалкилирование.

Выведение

$T_{1/2}$ рисперидона - 3 ч (при высокой активности изофермента CYP2D6) и 20 ч (при низкой активности изофермента CYP2D6), $T_{1/2}$ 9-гидроксирисперидона - 21 ч (при высокой активности изофермента CYP2D6) и 30 ч (при низкой активности изофермента CYP2D6); активной антипсихотической фракции - 20 ч.

Выводится почками 70% (35-45% в виде фармакологически активной антипсихотической фракции) и с желчью (14%).

Фармакокинетика в особых клинических случаях

При хронической почечной недостаточности клиренс активной антипсихотической фракции снижается на 60%.

При печеночной недостаточности содержание рисперидона в плазме повышается на 35%.

У пациентов пожилого снижается клиренс и удлиняется $T_{1/2}$.

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 шизофрении;

— поведенческих расстройств у пациентов с деменцией при проявлении симптомов агрессивности (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 (агрессивность, импульсивность, аутоагрессия) является ведущим в клинической картине заболевания.

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

Относится к болезням:

- Деменция
- Шизофрения

Противопоказания:

— детский возраст до 15 лет (эффективность и безопасность не установлены);

— мании при биполярных аффективных расстройствах у детей в возрасте до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены);

— дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция;

— период лактации;

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью:* заболевания сердечно-сосудистой системы (хроническая сердечная недостаточность, перенесенный инфаркт миокарда, нарушения проводимости сердечной мышцы); состояния, предрасполагающие к развитию тахикардии типа "пируэт" (брадикардия, нарушение электролитного баланса, сопутствующий прием лекарственных средств, удлиняющих интервал QT); факторы риска развития тромбоэмболии венозных сосудов; обезвоживание и гиповолемия; нарушение мозгового кровообращения; опухоль мозга (в т.ч. пролактинома гипофиза); болезнь Паркинсона; болезнь диффузных телец Леви; судороги (в т.ч. в анамнезе); почечная недостаточность тяжелой степени; тяжелая печеночная недостаточность; злоупотребление лекарственными средствами или лекарственная зависимость; кишечная непроходимость; острая передозировка лекарств; синдром Рейе (противорвотный эффект рисперидона может маскировать симптомы этих состояний); беременность; пациенты пожилого возраста с деменцией.

Способ применения и дозы:

Шизофрения

Препарат назначают внутрь, 1 или 2 раза/сут. Начальная доза - 2 мг/сут. На 2-й 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, например, у пациентов с впервые возникшим эпизодом заболевания, может быть оправдано более медленное повышение дозы и более низкие начальная и поддерживающая дозы.

При применении в дозах более 10 мг/сут не наблюдалось усиления терапевтического эффекта по сравнению с меньшими дозами, при этом возможно появление экстрапирамидных симптомов. Максимальная суточная доза - 16 мг/сут.

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

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

Поведенческие расстройства у пациентов с деменцией

Для большинства пациентов оптимальной дозой является 500 мкг 2 раза/сут. Дозу можно повышать не более чем на 500 мкг, не чаще чем через день. Однако некоторым пациентам показан прием по 1 мг 2 раза/сут. При достижении оптимальной дозы может быть рекомендован прием 1 раз/сут.

Поведенческие расстройства у пациентов с задержкой умственного развития

Начальная доза составляет 500 мкг 1 раз/сут. Дозу можно повышать не более чем на 500 мкг, не чаще чем через день. Обычная поддерживающая доза составляет 1 мг 1 раз/сут. Интервал дозирования - 0.5-1.5 мг 1 раз/сут.

Мании при биполярных аффективных расстройствах

Для **взрослых** начальная доза - 2 мг 1 раз/сут. Далее дозу подбирают индивидуально, повышая ее на 1 мг/сут, не чаще чем через день. В большинстве случаев оптимальной является доза от 2 до 6 мг/сут.

Как и при любой симптоматической терапии, во время лечения следует оценивать эффективность и при необходимости корректировать режим дозирования.

Для **пациентов пожилого возраста** рекомендуется начальная доза 500 мкг 2 раза/сут. При необходимости дозу увеличивают до 1-2 мг 2 раза/сут.

При **заболеваниях печени и почек** рекомендуется начальная доза 500 мкг 2 раза/сут. Дозу постепенно увеличивают до 1-2 мг 2 раза/сут.

Побочное действие:

Со стороны нервной системы: бессонница, ажитация, тревожность, головная боль, сонливость, повышенная утомляемость, головокружение, снижение способности к концентрации внимания, нечеткость зрительного восприятия, мания, гипомания, экстрапирамидные симптомы (тремор, ригидность, гиперсаливация, брадикинезия, акатизия, острая дистония).

У больных шизофренией - гиперволемия (либо из-за полидипсии, либо из-за синдрома неадекватной секреции АДГ), поздняя дискинезия (непроизвольные ритмичные движения преимущественно языка и/или лица), ЗНС (гипертермия, мышечная ригидность, нестабильность автономных функций, нарушение сознания и повышение активности КФК), нарушения терморегуляции и эпилептические припадки.

Со стороны пищеварительной системы: запор, диспепсия, тошнота или рвота, боли в животе, повышение активности печеночных трансаминаз, сухость слизистой оболочки полости рта, гипо- или гиперсаливация, анорексия, усиление аппетита.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: ортостатическая гипотензия, рефлекторная тахикардия, повышение АД, удлинение интервала QT, желудочковая аритмия типа "пируэт", фибрилляция желудочков, инсульт и транзиторные ишемические атаки (у пожилых пациентов с деменцией), тромбоэмболия венозных сосудов, в т.ч. тромбоэмболия легочных сосудов и глубоких вен.

Со стороны системы кроветворения: нейтропения, тромбоцитопения.

Со стороны эндокринной системы: галакторея, гинекомастия, нарушения менструального цикла, аменорея, повышение или снижение массы тела, гипергликемия и обострение существовавшего ранее сахарного диабета.

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

Со стороны мочевыделительной системы: недержание мочи, инфекция мочевыводящих путей.

Со стороны кожных покровов: сухость кожи, гиперпигментация, зуд, себорея.

Аллергические реакции: ринит, сыпь, ангионевротический отек, фотосенсибилизация.

Прочие: артралгия.

Передозировка:

Симптомы: усиление фармакологических эффектов - сонливость, седативный эффект, тахикардия, снижение АД, экстрапирамидные симптомы. Сообщалось о приеме препарата в дозе до 360 мг. 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 иметь в виду возможность приема нескольких препаратов.

Лечение: следует обеспечить свободную проходимость дыхательных путей для поддержания адекватного снабжения кислородом и вентиляции; промывание желудка (после интубации, если больной без сознания) и применение активированного угля вместе со слабительными средствами. Следует немедленно начать мониторирование ЭКГ для выявления возможной аритмии. Специфического антидота не существует. Необходимо проводить соответствующую симптоматическую терапию. Снижение АД и коллапс следует устранять в/в инфузиями жидкости и/или адреномиметиками. В случае развития острых экстрапирамидных симптомов следует применить м-холиноблокаторы. 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 препарата Риссет при беременности возможно только в том случае, если ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода. Поскольку рисперидон и 9-гидроксирисперидон проникают в грудное молоко, при необходимости применения препарата Риссет в период лактации следует прекратить грудное вскармливание.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Учитывая, что антипсихотические препараты, в т.ч. рисперидон, оказывают воздействие в первую очередь на ЦНС, их следует применять с осторожностью в сочетании с другими препаратами центрального действия.

Рисперидон усиливает эффект этанола, опиоидных анальгетиков, блокаторов гистаминовых H_1-рецепторов и бензодиазепинов.

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

При терапии комбинацией рисперидона с другими антипсихотическими препаратами, литием, антидепрессантами, противопаркинсоническими средствами, препаратами с центральным антихолинергическим эффектом увеличивается риск развития поздней дискинезии.

Рисперидон не оказывает влияния на клинический эффект и фармакокинетику лития, вальпроевой кислоты, дигоксина и топирамата, поэтому при таких комбинациях коррекции дозы не требуется.

Рисперидон уменьшает эффективность леводопы и других агонистов допаминовых рецепторов. Похожий эффект возможен при применении рисперидона в комбинации с другими индукторами микросомальных ферментов печени такими, как барбитураты, рифампицин, фенитоин и зверобой продырявленный. В этом случае доза рисперидона должна быть пересмотрена.

Не следует назначать препарат совместно с карбамазепином пациентам с маниями при биполярном аффективном расстройстве. При применении карбамазепина отмечается снижение концентрации активной антипсихотической фазы рисперидона в плазме.

Клозапин снижает клиренс рисперидона.

Производные фенотиазина, трициклические антидепрессанты и некоторые бета-адреноблокаторы могут повышать концентрацию рисперидона в плазме, при этом концентрация активной антипсихотической фазы не изменяется.

Хинидин, флуоксетин, пароксетин, тербинафин и другие ингибиторы изофермента CYP2D6 могут повышать концентрацию в плазме рисперидона и, в меньшей степени, концентрацию активной антипсихотической фазы.

Циметидин и ранитидин увеличивают концентрацию рисперидона в плазме, но антипсихотический эффект при этом не увеличивается.

Одновременное применение рисперидона с фуросемидом у пожилых пациентов на фоне цереброваскулярной деменции, ассоциировалось с высокой смертностью. Механизм такого взаимодействия не имеет четкого объяснения. Необходимо оценивать соотношение потенциальной пользы и возможного риска для этих пациентов при одновременном применении рисперидона и диуретических средств, в т.ч. фуросемида.

Рисперидон может увеличивать АД, снижая эффективность феноксибензамина, лабеталола и других альфа-адреноблокаторов, резерпина, метилдопы и других гипотензивных средств центрального действия.

Рисперидон блокирует гипотензивный эффект гуанетидина.

Требует внимания и осторожности сопутствующий прием рисперидона с лекарственными средствами, удлиняющими интервал QT, такими как другие антипсихотические средства, антиаритмические средства классов I A и III, моксифлоксацин, эритромицин, метадон, мефлохин, эритромицин, трициклические антидепрессанты, литий и цизаприд.

Необходимо быть осторожными при сопутствующем приеме рисперидона с лекарственными средствами, которые могут вызвать нарушения электролитного обмена, такие как тиазидные диуретики (гипокалиемия). Такое сочетание увеличивает риск развития злокачественной аритмии.

Особые указания и меры предосторожности:

При шизофрении, перед лечением препаратом Риссет, рекомендуется постепенно отменить предыдущую терапию, если это клинически оправдано. Если пациенты переводятся с терапии депо-формами антипсихотических препаратов, то прием рекомендуется начинать вместо следующей запланированной инъекции. Периодически следует оценивать необходимость в продолжении текущей терапии противопаркинсоническими средствами.

Риссет необходимо с осторожностью применять у пожилых пациентов с деменцией, в т.ч. при приеме фуросемида и других диуретических средств.

Мета-анализ результатов 17 контролируемых клинических исследований показал повышенную смертность пожилых пациентов с деменцией (средний возраст 86 лет), получавших атипичные антипсихотические препараты, в т.ч. рисперидон, по сравнению с плацебо. Среди пациентов, получавших рисперидон и плацебо, смертность составляла соответственно 4% и 3.1%.

Для пожилых пациентов с деменцией, принимающих рисперидон, наблюдалась повышенная смертность у пациентов, принимавших фуросемид и рисперидон по сравнению с группой, принимавшей только рисперидон и группой,

принимавшей только фуросемид. Не установлено патофизиологических механизмов, объясняющих данное наблюдение. Не обнаружено увеличения смертности у пожилых пациентов, одновременно принимающих другие диуретики вместе с рисперидоном. Независимо от лечения, дегидратация является общим фактором риска смертности и должна тщательно контролироваться у пожилых пациентов с деменцией.

В плацебо-контролируемых исследованиях обнаружена повышенная частота нарушений мозгового кровообращения (инсульт и/или транзиторные ишемические атаки), в т.ч. со смертельным исходом, у пожилых пациентов с деменцией, получавших некоторые атипичные антипсихотические препараты, в т.ч. рисперидон, по сравнению с применением плацебо.

У пациентов с заболеваниями сердечно-сосудистой системы, а также при обезвоживании, гиповолемии или цереброваскулярных нарушениях дозу следует увеличивать постепенно. При возникновении ортостатической гипотензии, особенно в начальном периоде подбора дозы, следует рассмотреть вопрос о снижении дозы.

Антипсихотические препараты, в т.ч. рисперидон, способствуют развитию тромбоэмболических осложнений у пациентов, имеющих предрасположенность к образованию тромбов. До начала терапии рисперидоном необходимо выявить все возможные факторы риска развития тромбоэмболии венозных сосудов и предпринять соответствующие меры для предупреждения развития тромбоэмболических осложнений.

Риск развития мании или гипомании может быть существенно снижен при применении низких доз или их постепенного наращивания.

Если возникают признаки и симптомы поздней дискинезии или ЗНС необходимо отменить все антипсихотические препараты, в т.ч. рисперидон, провести симптоматическую терапию и рассмотреть вопрос о возобновлении терапии антипсихотическими препаратами. Для предупреждения развития злокачественного нейролептического синдрома на фоне лечения антипсихотическими препаратами необходимо регулярно проводить коррекцию принимаемой дозы. Необходимо тщательно оценить соотношение потенциальной пользы и возможного риска перед применением рисперидона у пациентов с болезнью диффузных телец Леви и болезнью Паркинсона, поскольку у таких пациентов может быть увеличен риск развития ЗНС и повышена чувствительность к антипсихотическим препаратам.

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

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

Использование в педиатрии

Рисперидон детям может назначать только врач, имеющий специальную подготовку по детской психиатрии.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения пациенты должны соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

При заболеваниях почек рекомендуется начальная доза - 500 мкг 2 раза/сут. Эту дозу постепенно можно увеличить до 1-2 мг 2 раза/сут.

При нарушениях функции печени

При заболеваниях печени рекомендуется начальная доза - 500 мкг 2 раза/сут. Эту дозу постепенно можно увеличить до 1-2 мг 2 раза/сут.

Применение в пожилом возрасте

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

Применять с осторожностью у пациентов пожилого возраста с деменцией.

Применение в детском возрасте

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

Условия хранения:

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

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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