Риссет Квитаб

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр Википедия
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Таблетки, диспергируемые в полости рта, круглые, плоскоцилиндрические, белого цвета с гладкой или пористой поверхностью и шероховатыми краями.

	1 таб.
рисперидон	2 мг

Вспомогательные вещества: маннитол (пеарлитол 50C) - 174.85 мг, маннитол (пеарлитол 200SD) - 16.15 мг, карбоксиметилкрахмал натрия (тип А) - 6 мг, ароматизатор мятный (HF84 NAT, WONF-SD491) - 1 мг.

14 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры (4) - 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.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь абсорбция быстрая и полная (пища не влияет на полноту и скорость абсорбции). Абсолютная биодоступность рисперидона - 70%, относительная биодоступность таблеток рисперидона - 94% по сравнению с раствором. T_{max} в плазме крови достигается через 1-2 ч.

Концентрация рисперидона в плазме зависит от дозы.

Распределение

Связывание с белками плазмы (с альфа$_1$-кислым гликопротеином и альбуминами) рисперидона - 88%, 9-гидроксирисперидона - 77%. Рисперидон быстро и хорошо распределяется в организме. V_d - 1-2 л/кг.

C_{ss} рисперидона в организме у большинства пациентов достигается в течение 1 дня, а 9-гидроксирисперидона - 4-5 дней.

Метаболизм

Метаболизируется в печени при участии изофермента CYP2D6. Основной путь биотрансформации - гидроксилирование с образованием основного активного метаболита 9-гидроксирисперидона, который имеет сходные фармакологические свойства с рисперидоном. Другой путь метаболизма, имеющий минимальное значение, - N-деалкилирование. Рисперидон и 9-гидроксирисперидон формируют активную антипсихотическую фракцию.

Хотя гидроксилирование рисперидона подвержено генотипическому полиморфизму, различия фармакокинетики и эффекта активных метаболитов у разных фенотипов минимальны.

Выведение

$T_{1/2}$ рисперидона при активном метаболизме составляет 3 ч, при медленном метаболизме - 20 ч, $T_{1/2}$ 9-гидроксирисперидона при активном метаболизме - 21 ч, при медленном метаболизме - 30 ч; активной антипсихотической фракции у обоих фенотипов - 20 ч.

После одной недели приема 70% принятого рисперидона выводится почками, 14% - с калом. 35-45% фракции, выделяемой с мочой, состоит из неизмененного рисперидона и 9-гидроксирисперидона.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Фармакокинетика у взрослых и детей не различается.

У пациентов пожилого возраста при однократном приеме наблюдается снижение плазменного клиренса на 30% и увеличение $T_{1/2}$ на 38%.

У пациентов с почечной недостаточностью клиренс активной антипсихотической фракции снижается на 60%.

У пациентов с печеночной недостаточностью концентрация рисперидона в плазме не отличалась от других пациентов, несмотря на то, что свободная фракция рисперидона была повышена в среднем примерно на 35%.

Показания к применению:

— шизофрения;

— лечение маниакальных эпизодов средней и тяжелой степени, обусловленных биполярным расстройством.

Относится к болезням:

- Биполярное расстройство
- Шизофрения

Противопоказания:

— детский и подростковый возраст до 18 лет;

— беременность;

— период лактации (грудного вскармливания);

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью:* хроническая сердечная недостаточность; ИБС; перенесенный инфаркт миокарда; AV-блокада; 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; нарушение мозгового кровообращения; опухоль мозга (в т.ч. пролактинома гипофиза); кишечная непроходимость; острая передозировка лекарств; синдром Рейе (противорвотный эффект рисперидона может маскировать симптомы этих состояний).

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь. Таблетки препарата Риссет Квитаб для рассасывания очень хрупкие, их не следует делить и жевать. Извлекают таблетки из блистера сухими руками, потянув вверх край фольги, и сразу же помещают их на язык. Если таблетки принимают во время еды, то во рту не должно быть пищи, когда пациент кладет таблетку на язык. Таблетки начинают распадаться во рту уже через несколько секунд, и после этого их можно сразу же проглотить, не запивая водой. При необходимости можно запить таблетку водой или другой жидкостью.

Шизофрения

Рекомендуется принимать препарат 1-2 раза/сут. Начальная доза - 2 мг/сут. На 2 день доза может быть увеличена 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 препарата Риссет Квитаб в дозах более 10 мг/сут не наблюдалось усиления терапевтического эффекта по сравнению с меньшими дозами, при этом увеличивалась вероятность появления экстрапирамидных симптомов. Максимальная суточная доза 16 мг/сут.

Пациентам пожилого возраста Риссет Квитаб рекомендуется назначать в дозе 2-4 мг/сут.

Лечение маниакальных эпизодов средней и тяжелой степени, обусловленных биполярным расстройством

Рекомендуется принимать препарат 1 раз/сут. Начальная доза - 2 мг/сут. При необходимости увеличение дозы на 1 мг/сут следует проводить не ранее чем через 24 ч. Рекомендуемый диапазон доз от 2 до 6 мг/сут. Необходимо регулярно оценивать целесообразность дальнейшего применения препарата Риссет Квитаб у пациентов с этой патологией.

Пациентам пожилого возраста Риссет Квитаб рекомендуется назначать в дозе 2-4 мг/сут.

При **заболеваниях печени и почек** рекомендуется доза 2-4 мг/сут.

Побочное действие:

Определение частоты побочных реакций (согласно ВОЗ): очень часто (≥ 10%), часто (≥ 1%, но < 10%), нечасто (≥ 0.1%, но < 1%), редко - (≥ 0.01%, но < 0.1%), очень редко, включая единичные случаи (< 0.01%); частота неизвестна (недостаточно данных для оценки частоты явления в популяции).

Инфекции: часто - пневмония, грипп, трахеобронхит, инфекции верхних дыхательных путей, инфекции мочевыводящих путей; нечасто - синусит, инфекции уха, вирусные инфекции, тонзиллит, воспаление подкожной клетчатки, средний отит, инфекция глаз, онихомикоз, акродерматит, цистит; редко - хронический средний отит.

Со стороны обмена веществ: часто - повышение/снижение аппетита, увеличение массы тела; нечасто - анорексия, полидипсия, повышение температуры тела; редко - снижение температуры тела; очень редко - диабетический кетоацидоз; частота неизвестна - водная интоксикация.

Со стороны системы кроветворения: нечасто - анемия, тромбоцитопения, эозинофилия, снижение гемоглобина; редко - гранулоцитопения; очень редко - нейтропения; частота неизвестна - агранулоцитоз.

Со стороны иммунной системы: нечасто - реакция гиперчувствительности; частота неизвестна - анафилактическая реакция.

Со стороны нервной системы: очень часто - бессонница, паркинсонизм (включая экстрапирамидные расстройства, костно-мышечную ригидность, синдром зубчатого колеса, акинезию, брадикинезию, гипокинезию, мышечную ригидность); часто - беспокойство, нервозность, спутанность сознания, вялость, акатизия, тремор, седативный эффект, дистония (включая мышечные спазмы, непроизвольные мышечные сокращения, контрактуру мышц, движения глазных яблок, паралич языка), летаргия, постуральное кровотечение, дискинезия (включая подергивания мышц, хорею и хореоатетоз), синкопе, преходящая ишемическая атака, подавленное состояние, слюнотечение, инсульт, нарушение внимания; нечасто - возбуждение, уплощение аффекта, нарушения сна, ослабление либидо, аноргазмия, отсутствие реакции на раздражители, нарушение координации, потеря сознания, нарушение речи, гипестезия, нарушение движений, поздняя дискинезия, ЗНС, диабетическая кома; очень редко - мании.

Со стороны пищеварительной системы: часто - тошнота, рвота, диарея, запор, боль в животе, диспепсия, сухость во рту, дискомфорт в желудке; нечасто - дисфагия, гастрит, фекалома, повышение активности печеночных трансаминаз; редко - непроходимость кишечника, желтуха, панкреатит, хейлит, аптиализм.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - тахикардия; нечасто - ортостатическая гипотензия, AV-блокада, ощущение сердцебиения, синусовая брадикардия, блокада ветви желудочно-предсердного пучка Гиса, приливы,

удлинение интервала QT на ЭКГ; редко - инсульт и транзиторная ишемическая атака (в основном у пациентов пожилого возраста с деменцией, связанной с психозом); частота неизвестна - венозная тромбоэмболия.

Со стороны органа зрения: часто - затуманивание зрения; нечасто - конъюнктивит, гиперемия глаза, сухость глаза, повышенное слезовыделение, орбитальный отек, светобоязнь; редко - глаукома, снижение остроты зрения, вращательный нистагм.

Со стороны органа слуха: нечасто - боль, звон в ушах.

Со стороны органов дыхания: часто - одышка, носовое кровотечение, кашель, заложенность носа, боль в горле; нечасто - ринит, нарушение дыхания, дисфония, свистящее дыхание, аспирационная пневмония, продуктивный кашель, закупорка дыхательных путей, влажные хрипы, отек носа; очень редко - гипервентиляция, синдром апноэ во сне.

Со стороны эндокринной системы: часто - увеличение концентрации пролактина в плазме крови; нечасто - гипергликемия; редко - неадекватная секреция АДГ.

Со стороны репродуктивной системы: нечасто - аменорея, нарушение сексуальной функции, эректильная дисфункция, нарушение эякуляции, галакторея, гинекомастия, нарушение менструального цикла; частота неизвестна - приапизм.

Со стороны мочевыводящих путей: часто - энурез; нечасто - дизурия, недержание мочи, поллакиурия.

Со стороны кожи и подкожных тканей: часто - кожная сыпь, эритема; нечасто - нарушение пигментации кожи, зуд, акне, повреждение кожи, эритематозные высыпания, алопеция, себорейный дерматит, сухость кожи, гиперкератоз; редко - перхоть.

Со стороны костно-мышечной и соединительной ткани: часто - артралгия, боль в спине, боль в конечностях; нечасто - мышечная слабость, миалгия, боль в шее, опухание суставов, тугоподвижность суставов, боль в грудной клетке; редко - рабдомиолиз.

Общие нарушения: часто - усталость, астения, периферические отеки, нарушение походки; нечасто - жажда, гриппоподобное состояние, плохое самочувствие, медлительность, озноб, похолодание конечностей, отек лица, общий отек.

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, направленную на поддержание функции ЦНС и сердечно-сосудистой системы, дезинтоксикационную терапию. При выраженном понижении АД или сосудистом коллапсе следует вводить в/в инфузионные растворы и/или применять симпатомиметические лекарственные препараты. В случае развития острых экстрапирамидных симптомов следует применять антихолинергические препараты. Постоянное медицинское наблюдение за жизненно важными функциями следует продолжать до исчезновения симптомов интоксикации.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Безопасность применения рисперидона при беременности изучена недостаточно. По данным постмаркетинговых исследований применение рисперидона в III триместре беременности может вызывать развитие обратимых экстрапирамидных симптомов у новорожденных. Применение препарата Риссет Квитаб при беременности противопоказано.

Поскольку рисперидон и 9-гидроксирисперидон выделяется с грудным молоком, при необходимости применения препарата Риссет Квитаб 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 фракции 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 фракции не изменяется.

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

Карбамазепин, рифампицин, зверобой продырявленный, фенитоин, фенобарбитал являются индукторами изофермента CYP3A4 и снижают концентрацию антипсихотической фракции рисперидона в плазме. При отмене карбамазепина и других индукторов изофермента CYP3A4 дозу рисперидона следует уменьшить.

Верапамил, являясь ингибитором CYP3A4, повышает концентрацию рисперидона в плазме.

Циметидин и ранитидин увеличивают концентрацию рисперидона в плазме, но антипсихотический эффект при этом не увеличивается, т.к. сцепление активных метаболитов уменьшено.

Альфа$_1$-адреноблокирующий эффект рисперидона может повышать АД, снижая эффективность феноксибензамина, лабеталола и других альфа-адреноблокирующих симпатомиметиков, резерпина, метилдопы и других гипотензивных средств центрального действия. В противоположность этому, антигипертензивный эффект гуанетидина блокируется.

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

Требуется осторожность при одновременном применении рисперидона с лекарственными средствами, которые могут вызвать нарушения электролитного обмена, такими как тиазидные диуретики (гипокалиемия). Такое сочетание увеличивает риск развития злокачественной аритмии.

При применении рисперидона вместе с другими препаратами, в высокой степени связывающимися с белками плазмы, клинически выраженного вытеснения какого-либо активного вещества из белковой фракции плазмы не наблюдается.

Особые указания и меры предосторожности:

При шизофрении, в начале лечения препаратом Риссет Квитаб, 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 лекарственными средствами.

Одновременное применение рисперидона с фуросемидом у пациентов пожилого возраста с деменцией ассоциировалось с высокой смертностью. Механизм такого взаимодействия не имеет четкого объяснения. Тем не менее, следует соблюдать осторожность в таких случаях.

Рисперидон необходимо с осторожностью применять у пациентов пожилого возраста, у которых в анамнезе есть указания на цереброваскулярные расстройства, т.к. существует риск развития инсульта или транзиторной ишемической атаки.

Антипсихотические препараты, в т.ч. рисперидон, способствуют развитию тромбоэмболических осложнений у пациентов, имеющих предрасположенность к образованию тромбов. До начала терапии препаратом Риссет Квитаб 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 рисперидона в низких дозах или их постепенного повышения.

При возникновении ортостатической гипотензии, особенно в начальном периоде подбора дозы, 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.

Антипсихотические препараты, в т.ч. Риссет Квитаб, следует с осторожностью применять у пациентов с врожденным удлинением интервала QT, ИБС, нарушением проводимости, аритмией или одновременным применением лекарственных препаратов, которые вызывают удлинение интервала QT, а также при гипокалиемии.

Если возникают признаки и симптомы поздней дискинезии/экстрапирамидных симптомов, следует рассмотреть вопрос об отмене всех антипсихотических препаратов.

При развитии ЗНС необходимо отменить все антипсихотические препараты, включая Риссет Квитаб, и провести симптоматическое лечение. После нормализации состояния врач решает вопрос о возобновлении терапии рисперидоном. Для предупреждения развития ЗНС на фоне лечения антипсихотическими препаратами необходимо регулярно проводить коррекцию принимаемой дозы.

Необходимо тщательно оценить соотношение потенциальной пользы и возможного риска при применении рисперидона у пациентов, страдающим деменцией, связанной с тельцам Леви или болезнью Паркинсона, поскольку у таких пациентов может быть увеличен риск развития ЗНС и повышена чувствительность к антипсихотическим препаратам.

У пациентов с сахарным диабетом или риском развития сахарного диабета необходимо контролировать концентрацию глюкозы в крови.

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

В редких случаях при повышении дозы антипсихотических препаратов, в т.ч. рисперидона, могут появиться симптомы тошноты, рвоты, повышенного потоотделения и сонливости. Необходимо либо приостановить прием препарата до исчезновения симптомов, либо уменьшить его дозу.

Использование в педиатрии

Отсутствуют данные об эффективности и безопасности применения рисперидона у **детей и подростков младше 18 лет**.

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 доза 2-4 мг/сут.

При нарушениях функции печени

При **заболеваниях печени** рекомендуется доза 2-4 мг/сут.

Применение в пожилом возрасте

Пациентам пожилого возраста Риссет Квитаб рекомендуется назначать в дозе 2-4 мг/сут.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в 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/Risset_Kvitab