Сизодон-Сан



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 оболочкой оранжевого цвета, круглые, двояковыпуклые, с риской на одной стороне.

	1 таб.
рисперидон	1 мг
-"-	2 мг
-"-	3 мг
-"-	4 мг

Вспомогательные вещества: лактоза, крахмал, целлюлоза микрокристаллическая, натрия бензоат, тальк очищенный, магния стеарат, кремния диоксид коллоидный, натрия крахмала гликолат.

Состав оболочки: эудражит Е-100, титана диоксид, краситель сансет желтый, полиэтиленгликоль 6000, натрия лаурилсульфат, изопропанол, ацетон, вода очищенная.

10 шт. - стрипы алюминиевые (1) - пачки картонные.
10 шт. - стрипы алюминиевые (2) - пачки картонные.
10 шт. - стрипы алюминиевые (3) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антипсихотическое средство (нейролептик). Оказывает также седативное, противорвотное и гипотермическое действие. Сизодон-Сан - селективный моноаминергический антагонист с выраженным сродством к серотониновым 5-HT_2- и допаминовым D_2-рецепторам, связывается также с α_1-адренорецепторами и при несколько меньшей аффинности - с гистаминовыми H_1- 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.

Снижает продуктивную симптоматику (бред, галлюцинации), автоматизм. Вызывает меньшее подавление моторной активности и в меньшей степени индуцирует каталепсию, чем классические антипсихотики (нейролептики).

Сбалансированный центральный антагонизм к серотонину и допамину может уменьшать риск возникновения экстрапирамидных симптомов.

Сизодон-Сан может вызывать дозозависимое увеличение концентрации пролактина в плазме.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь Сизодон-Сан полностью всасывается из ЖКТ (независимо от приема пищи), C_{max} рисперидона в плазме крови наблюдаются через 1-2 ч.

Концентрация рисперидона в плазме крови пропорциональна дозе препарата (в диапазоне терапевтических доз).

Распределение

У большинства пациентов C_{ss} рисперидона наблюдается через 1 день после начала лечения. Равновесное состояние 9-гидрокси-рисперидона в большинстве случаев достигается через 3-4 дня после начала лечения.

Рисперидон быстро распределяется в организме. V_d составляет 1-2 л/кг. Связывание с белками плазмы (с альбумином и кислым α_1-гликопротеином) составляет для рисперидона и 9-гидрокси-рисперидона 88% и 77% соответственно.

Метаболизм

Рисперидон метаболизируется при участии изофермента CYP2D6 с образованием 9-гидрокси-рисперидона, который обладает аналогичным фармакологическим действием. Рисперидон и 9-гидрокси-рисперидон представляют собой эффективную антипсихотическую фракцию. Дальнейший метаболизм препарата заключается в N-деалкилировании.

Выведение

При приеме препарата внутрь $T_{1/2}$ рисперидона составляет около 3 ч. Установлено, что $T_{1/2}$ 9-гидрокси-рисперидона и активной антипсихотической фракции составляет 24 ч.

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

Фармакокинетика в особых клинических случаях

При однократном приеме отмечаются высокие концентрации активного вещества и его активного метаболита в плазме крови и замедленное выведение у пациентов пожилого возраста и при почечной недостаточности.

Показания к применению:

— шизофрения (острая и хроническая) и другие психотические состояния с продуктивной и/или негативной симптоматикой;

— аффективные расстройства при различных психических заболеваниях;

— поведенческие расстройства у пациентов с деменцией при проявлении симптомов агрессивности (вспышки гнева, физическое насилие), при нарушениях психической деятельности (возбуждение, бред) или психотических симптомах;

— в качестве вспомогательной терапии при лечении маний при биполярных расстройствах;

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

Относится к болезням:

- Биполярное расстройство
- Деменция
- Шизофрения

Противопоказания:

— период лактации (грудное вскармливание).

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью* следует применять препарат при заболеваниях сердечно-сосудистой системы (хроническая сердечная недостаточность, перенесенный инфаркт миокарда, нарушения проводимости сердечной мышцы); обезвоживании и гиповолемии; нарушении мозгового кровообращения; при болезни Паркинсона; при судорогах (в т.ч. в анамнезе); почечной недостаточности тяжелой степени, тяжелой печеночной недостаточности; злоупотреблении лекарственными средствами или лекарственной зависимости; при состояниях, предрасполагающих к развитию желудочковой тахикардии типа "пируэт" (брадикардия, нарушение электролитного баланса, сопутствующий прием лекарственных средств, удлиняющих интервал QT); при опухоли мозга, кишечной непроходимости, случаях острой передозировки лекарственных препаратов, при синдроме Рейе (противорвотный эффект рисперидона может маскировать симптомы этих состояний); при беременности, у детей в возрасте до 15 лет (эффективность и безопасность не установлены).

Способ применения и дозы:

Шизофрения

Взрослым и детям старше 15 лет Сизодон-Сан можно назначать 1 или 2 раза в сут.

Начальная доза - 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 оптимальная доза составляет 4-6 мг/сут. В ряде случаев может быть оправдано более медленное повышение дозы и более низкие начальная и поддерживающая дозы.

Препарат в дозах более 10 мг/сут не проявляет более высокой эффективности по сравнению с меньшими дозами и может вызвать появление экстрапирамидных симптомов. В связи с тем, что безопасность препарата в дозах более 16 мг/сут не изучена, превышать указанную дозу нельзя.

Данные о применении препарата для лечения шизофрении у **детей младше 15 лет** отсутствуют.

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

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

У **пациентов, злоупотребляющих лекарственными средствами, или при лекарственной зависимости** рекомендуемая доза препарата составляет 2-4 мг/сут.

Поведенческие расстройства у пациентов с деменцией

Рекомендуемая начальная доза - по 250 мкг 2 раза/сут (следует использовать адекватную лекарственную форму). Дозу при необходимости можно увеличивать по 250 мкг 2 раза/сут, не чаще чем через день. Для большинства пациентов оптимальная доза составляет 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.

Мании при биполярных расстройствах

Рекомендуемая начальная доза препарата составляет 2 мг 1 раз/сут. При необходимости дозу можно увеличить на 2 мг/сут, не чаще чем через день. Для большинства пациентов оптимальная доза составляет 2-6 мг/сут.

Расстройства поведения у пациентов с задержкой умственного развития

Для **пациентов с массой тела 50 кг и более** рекомендуемая начальная доза препарата – 500 мкг 1 раз/сут. При необходимости эта доза может быть повышена на 500 мкг/сут, не чаще чем через день. Для большинства пациентов оптимальная доза составляет 1 мг/сут. Однако для некоторых пациентов предпочтителен прием по 500 мкг/сут, в других случаях требуется увеличение дозы до 1.5 мг/сут.

Для **пациентов с массой тела менее 50 кг** рекомендуемая начальная доза препарата – 250 мкг 1 раз/сут. При необходимости эта доза может быть повышена на 250 мкг/сут, не чаще чем через день. Для большинства пациентов оптимальная доза составляет 500 мкг/сут. Однако для некоторых пациентов предпочтителен прием по 250 мкг/сут, в других случаях требуется увеличение дозы до 750 мкг/сут.

Длительное лечение **подростков** препаратом Сизодон-Сан следует проводить под постоянным контролем врача. Применение препарата у **детей младше 15 лет** не рекомендуется.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: бессонница, ажитация, тревога, головная боль; иногда – сонливость, повышенная утомляемость, головокружение, нарушение концентрации внимания, неясность зрения; редко - экстрапирамидные симптомы (тремор, ригидность, гиперсаливация, брадикинезия, акатизия, острая дистония), мания или гипомания, инсульт (у пациентов пожилого возраста с предрасполагающими факторами), а также 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 автономных функций, нарушение сознания и повышение уровня КФК), нарушения терморегуляции, эпилептические припадки.

Со стороны пищеварительной системы: запоры, диспепсия, тошнота или рвота, боль в животе, повышение активности печеночных трансаминаз, сухость во рту, гипо- или гиперсаливация, анорексия и/или усиление аппетита, повышение или снижение массы тела.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: иногда ортостатическая гипотензия, рефлекторная тахикардия или повышение АД.

Со стороны органов кроветворения: нейтропения, тромбоцитопения.

Со стороны эндокринной системы: галакторея, гинекомастия, нарушение менструального цикла, аменорея, увеличение 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.

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

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

Прочие: артралгия.

Передозировка:

Симптомы: сонливость, седативный эффект, угнетение сознания, тахикардия, артериальная гипотензия, экстрапирамидные расстройства, в редких случаях удлинение интервала QT.

Лечение: необходимо обеспечить свободную проходимость дыхательных путей для обеспечения адекватной оксигенации и вентиляции, промывание желудка (после интубации, если больной без сознания) и назначение активированного угля в сочетании со слабительными средствами. Показано проведение симптоматической терапии, направленной на поддержание жизненно важных функций организма.

Для своевременного диагностирования возможных нарушений ритма сердца необходимо как можно быстрее начать мониторирование ЭКГ. Тщательное медицинское наблюдение и ЭКГ мониторирование проводят до полного исчезновения симптомов интоксикации. Специфический антидот отсутствует.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Клинические данные по безопасности применения препарата Сизодон-Сан при беременности отсутствуют. Применение препарата при беременности возможно только в том случае, когда предполагаемая польза для матери превосходит потенциальный риск для плода.

Поскольку рисперидон и 9-гидрокси-рисперидон выделяются с грудным молоком, при необходимости применения препарата в период лактации следует решить вопрос о прекращении грудного вскармливания.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

С учетом того, что Сизодон-Сан оказывает действие в первую очередь на ЦНС, его следует применять с осторожностью в сочетании с другими препаратами центрального действия и с этанолом.

Сизодон-Сан уменьшает эффективность леводопы и других агонистов допамина.

Клозапин снижает клиренс рисперидона.

При одновременном применении карбамазепина и Сизодон-Сана отмечалось снижение концентрации активной антипсихотической фракции рисперидона в плазме. Аналогичные эффекты могут наблюдаться при применении других индукторов печеночных ферментов.

Фенотиазины, трициклические антидепрессанты и некоторые бета-адреноблокаторы способны повышать концентрацию рисперидона в плазме крови, однако это не влияет на концентрацию активной антипсихотической фракции препарата.

Флуоксетин может повышать концентрацию рисперидона в плазме крови, однако в меньшей степени концентрацию активной антипсихотической фракции, поэтому при данной комбинации требуется коррекция дозы Сизодон-Сана.

При применении Сизодон-Сана в сочетании с другими препаратами, характеризующимися высокой степенью связывания с белками плазмы, клинически выраженного вытеснения какого-либо препарата из белковой фракции плазмы не наблюдается.

Гипотензивные лекарственные средства увеличивают выраженность снижения АД на фоне применения Сизодон-Сана.

Особые указания и меры предосторожности:

Переход от терапии другими антипсихотическими препаратами. При шизофрении, в начале лечения препаратом Сизодон-Сан, рекомендуется постепенно отменить предыдущую терапию, если это клинически оправдано. Если пациентов переводят с терапии депо формами антипсихотических препаратов, то прием Сизодон-Сана рекомендуется начинать вместо следующей запланированной инъекции. Периодически следует оценивать необходимость продолжения терапии противопаркинсоническими лекарственными средствами.

В связи с альфа-адреноблокирующим действием Сизодон-Сана может возникать ортостатическая гипотензия, особенно в период начального подбора дозы. При возникновении гипотении 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, согласно рекомендациям.

Возникновение экстрапирамидных симптомов является фактором риска для развития поздней дискинезии. В случае возникновения признаков и симптомов поздней дискинезии, следует рассмотреть вопрос об отмене всех антипсихотических препаратов. При возникновении ЗНС, характеризующегося гипертермией, мышечной ригидностью, нестабильностью автономных функций, нарушениями сознания и повышением уровня КФК, необходимо отменить все антипсихотические лекарственные средства, включая Сизодон-Сан.

При отмене карбамазепина и других индукторов печеночных ферментов дозу препарата Сизодон-Сан следует уменьшить.

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

В период лечения пациентам следует избегать употребления алкоголя.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения 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 при почечной недостаточности тяжелой степени. В таких случаях требуется коррекция режима дозирования.

При нарушениях функции печени

С осторожностью следует применять препарат при тяжелой печеночной недостаточности. В таких случаях требуется коррекция режима дозирования.

Применение в пожилом возрасте

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

Применение в детском возрасте

Данные о применении препарата для лечения шизофрении у **детей младше 15 лет** отсутствуют.

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить в недоступном для детей, сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25°С.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Sizodon-San