Сперидан



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:

Таблетки, покрытые оболочкой белого цвета, овальные, двояковыпуклые, с риской на одной стороне и гравировками "Т" с одной стороны от риски и "2" - с другой; на изломе - ядро белого цвета.

	1 таб.
рисперидон	2 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая - 17.5 мг, лактоза безводная - 122.5 мг, магния стеарат - 1 мг, крахмал прежелатинизированный - 37 мг.

Состав пленочной оболочки: гипромеллоза - 3.293 мг, макрогол 6000 - 0.805 мг, титана диоксид - 0.402 мг.

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

Таблетки, покрытые оболочкой белого цвета, овальные, двояковыпуклые, с риской на одной стороне и гравировками "Т" с одной стороны от риски и "4" - с другой; на изломе - ядро белого цвета.

	1 таб.
рисперидон	4 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая - 35 мг, лактоза безводная - 245 мг, магния стеарат - 2 мг, крахмал прежелатинизированный - 74 мг.

Состав пленочной оболочки: гипромеллоза - 6.586 мг, макрогол 6000 - 1.61 мг, титана диоксид - 0.804 мг.

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

Фармакотерапевтическая группа:

- Нейротропные средства

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, допаминовым D_2-рецепторам; также связывается с α_1-адренорецепторами и при несколько меньшей аффинности 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. 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 экстрапирамидной симптоматики.

Рисперидон может вызывать дозозависимое увеличение концентрации пролактина в плазме.

Фармакокинетика

Всасывание

При приеме внутрь абсорбируется быстро и полностью, при этом пища не влияет на полноту и скорость абсорбции. C_{max} в плазме достигается через 1-2 ч.

C_{ss} рисперидона в организме у большинства пациентов достигается в течение 1 дня, 9-гидрокси-рисперидона - через 4-5 дней. Концентрации рисперидона в плазме пропорциональны дозе препарата (в пределах терапевтических доз).

Распределение

Препарат быстро распределяется, проникает в ЦНС, грудное молоко. V_d -1.1 л/кг. Связывание с белками плазмы (с альфа$_1$-гликопротеином и альбумином) рисперидона - 90%, 9-гидрокси-рисперидона - 77%.

Метаболизм

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

Выведение

$T_{1/2}$ рисперидона составляет 3 ч, $T_{1/2}$ 9-гидрокси-рисперидона - 21 ч. 70% препарата выводится почками, из них 35-45% - в виде фармакологически активной фракции; с желчью выводится 14% от принятой дозы препарата.

При однократном приеме отмечаются высокие уровни активных концентраций в плазме и медленное выведение у пожилых пациентов и у пациентов с почечной недостаточностью.

Показания к применению:

— острая и хроническая шизофрения 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 агрессии (вспышки гнева, физическое насилие), при нарушениях деятельности (возбуждение, бред) или психотических симптомах;

— в качестве вспомогательной терапии (как стабилизатор настроения) - поведенческие расстройства у подростков в возрасте старше 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;

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

Относится к болезням:

- Биполярное расстройство
- Деменция

- Шизофрения

Противопоказания:

— период лактации (грудное вскармливание);

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

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

Способ применения и дозы:

При *шизофрении* **взрослым и подросткам в возрасте старше 15 лет** препарат назначают 1-2 раза/сут. Начальная суточная доза составляет 2 мг. На 2-й день суточную дозу следует увеличить до 4 мг. Затем дозу можно либо сохранить на прежнем уровне, либо при необходимости индивидуально скорректировать. Оптимальная суточная доза - 4-6 мг. В ряде случаев может быть оправдано более медленное повышение дозы и более низкие начальная и поддерживающая дозы.

При назначении суточной дозы более 10 мг не отмечено более высокой эффективности по сравнению с меньшими дозами. При этом может отмечаться развитие экстрапирамидных симптомов. В связи с тем, что безопасность доз более 16 мг/сут не изучалась, дозы выше этого уровня применять нельзя.

Пациентам пожилого возраста рекомендуемая начальная доза составляет 500 мкг 2 раза/сут. Дозу можно индивидуально увеличивать на 500 мкг в сутки до 1-2 мг 2 раза/сут.

У **пациентов с заболеваниями печени и почек** рекомендуемая начальная доза составляет 500 мкг 2 раза/сут. Дозу можно постепенно увеличить до 1-2 мг 2 раза/сут.

Сведения по использованию препарата для *лечения шизофрении* у **детей младше 15 лет** отсутствуют.

При *злоупотреблении лекарственными средствами или лекарственной зависимости* рекомендуемая суточная доза препарата составляет 2-4 мг.

При *поведенческих расстройствах у больных с деменцией* рекомендуемая начальная доза составляет по 250 мкг 2 раза/сут (следует использовать соответствующую лекарственную форму). Дозу при необходимости можно индивидуально увеличивать на 250 мкг в день (не чаще чем через день). Для большинства пациентов оптимальной дозой является 500 мкг 2 раза/сут. Однако некоторым пациентам показан прием препарата в дозе по 1 мг 2 раза/сут. После достижения оптимальной дозы может быть рекомендован прием препарата 1 раз/сут.

При *маниях при биполярных расстройствах* рекомендуется начальная доза препарата составляет 2 мг 1 раз/сут. При необходимости доза может быть повышена на 2 мг в день, не чаще чем через день. Для большинства пациентов оптимальной суточной дозой является 2-6 мг.

При *расстройствах поведения у пациентов с задержкой умственного развития* **пациентам с массой тела 50 кг и более** рекомендованная начальная доза препарата — 500 мкг 1 раз/сут. При необходимости доза может быть повышена на 500 мкг в день, не чаще чем через день. Для большинства пациентов оптимальная суточная доза - 1 мг.

Однако для некоторых пациентов предпочтительней прием препарата в дозе 500 мкг/сут, тогда как некоторым пациентам требуется увеличение дозы до 1.5 мг/сут.

Пациентам 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 в день, не чаще чем через день. Для большинства пациентов оптимальной дозой является доза 500 мкг/сут. Однако для некоторых пациентов предпочтительней прием препарата в дозе 250 мкг/сут, тогда как некоторым требуется увеличение дозы до 750 мкг/сут.

Длительный прием Сперидана у подростков должен проводиться под постоянным контролем врача.

Применение 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 пожилых больных 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), нейролептический злокачественный синдром (гипертермия, мышечная ригидность, нестабильность автономных функций, нарушение сознания и повышение уровня КФК), нарушения терморегуляции и 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 мочеполовой системы: приапизм, нарушения эрекции, нарушения эякуляции, аноргазмия, 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. Проводят симптоматическую терапию, направленную на поддержание жизненно важных функций организма. Специфический антидот отсутствует.

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.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Безопасность рисперидона у беременных не изучалась. При беременности применение возможно только в случаях, когда ожидаемая польза терапии для матери превышает потенциальный риск для плода.

Поскольку рисперидон и 9-гидрокси-рисперидон выделяется с грудным молоком, при необходимости применения препарата в период лактации следует прекратить грудное вскармливание.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Учитывая, что Сперидан оказывает действие в первую очередь на ЦНС, его следует применять с осторожностью в сочетании с другими препаратами центрального действия и с акоголем.

Сперидан уменьшает эффективность леводопы и других агонистов допамина.

Клозапин снижает клиренс рисперидона.

При применении карбамазепина 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 могут повышать концентрации рисперидона в плазме, однако это не влияет на концентрацию активной антипсихотической фракции.

Флуоксетин может повышать концентрацию рисперидона в плазме, однако в меньшей степени концентрацию активной антипсихотической фракции, поэтому дозы рисперидона следует корректировать.

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

Гипотензивные лекарственные средства усиливают выраженность снижения АД при одновременном применении со Спериданом.

Особые указания и меры предосторожности:

Переход от терапии другими антипсихотическими препаратами. При шизофрении в начале лечения Спериданом рекомендуется постепенно отменить предыдущую терапию, если это клинически оправдано. Если пациенты переводятся с терапии депо формами антипсихотических препаратов, то прием Сперидана рекомендуется начинать вместо следующей запланированной инъекции. Периодически следует оценивать необходимость продолжения терапии противопаркинсоническими лекарственными средствами. В связи с альфа-адреноблокирующим действием рисперидона может возникнуть ортостатическая гипотензия, особенно в период начального подбора дозы. При возникновении гипотонии 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 злокачественного нейролептического синдрома, характеризующегося гипертермией, мышечной ригидностью, нестабильностью автономных функций, нарушениями сознания и повышением уровня КФК необходимо отменить все антипсихотические лекарственные средства, включая рисперидон.

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

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

Во время лечения необходимо воздержаться от приема алкоголя.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Во время лечения необходимо воздерживаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

С *осторожностью* следует назначать препарат при тяжелой почечной недостаточности.

У **пациентов с заболеваниями почек** рекомендуемая начальная доза составляет 500 мкг 2 раза/сут. Дозу можно постепенно увеличить до 1-2 мг 2 раза/сут.

При нарушениях функции печени

С *осторожностью* следует назначать препарат при тяжелой печеночной недостаточности.

У **пациентов с заболеваниями печени** рекомендуемая начальная доза составляет 500 мкг 2 раза/сут. Дозу можно постепенно увеличить до 1-2 мг 2 раза/сут.

Применение в пожилом возрасте

Пациентам пожилого возраста рекомендуемая начальная доза составляет 500 мкг 2 раза/сут. Дозу можно индивидуально увеличивать на 500 мкг в сутки до 1-2 мг 2 раза/сут.

Применение в детском возрасте

Применение у **детей младше 15 лет** не рекомендуется.

Условия хранения:

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

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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