МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ И СОЦИАЛЬНОГО РАЗВИТИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

Сенорм

наименование лекарственного препарата

Регистрационный номер:

Торговое название: Сенорм (Senorm)

Международное непатентованное или группировочное название: галоперидол

Лекарственная форма: раствор для внутривенного и внутримышечного введения

Состав:

в 1 мл раствора содержится: галоперидола - 5 мг

Вспомогательные вещества: молочная кислота – 5 мкг, метилпарагидроксибензоат – 1,8 мг, пропилпарагидроксибензоат – 200 мкг, вода для инъекций - до 1 мл.

Описание: прозрачный бесцветный раствор.

Фармакотерапевтическая группа: Антипсихотическое (нейролептическое) средство.

Код АТХ: N05AD01

Фармакологические свойства

Фармакодинамика: Антипсихотическое средство (нейролептик), производное бутирофенона. Обладает выраженным антипсихотическим действием, блокирует постсинаптические дофаминовые рецепторы в мезолимбических и мезокортикальных структурах головного мозга. Высокая антипсихотическая активность сочетается с умеренным седативным эффектом (в небольших дозах оказывает активирующее действие) и выраженным противорвотным действием. Вызывает экстрапирамидные расстройства, практически не оказывает холиноблокирующего действия.

Седативное действие обусловлено блокадой альфа-адренорецепторов ретикулярной формации ствола головного мозга; противорвотное действие - блокадой дофаминовых D2-рецепторов триггерной зоны рвотного центра; гипотермическое действие и галакторея - блокадой дофаминовых рецепторов гипоталамуса. Длительный прием сопровождается изменением эндокринного статуса, в передней доле гипофиза увеличивается продукция пролактина и снижается - гонадотропных гормонов.

Фармакокинетика: максимальные концентрации в крови после внутримышечного введения достигаются через 20 мин. Галоперидол на 90 % связывается с белками плазмы, 10 % представляют собой свободную фракцию. Отношение концентрации в эритроцитах к концентрации в плазме 1:12. Концентрация галоперидола в тканях выше, чем в крови, препарат имеет тенденцию к кумуляции в тканях. Галоперидол метаболизируется в печени, метаболит не является активным. Также, галоперидол подвергается окислительному N-дезалкилированию и глюкуронированию. Период полувыведения из плазмы после внутримышечного введения - 21 час (17-25 ч). Галоперидол выводится в виде метаболитов с каловыми массами – 60 % (в т.ч. с желчью – 15 %) и с мочой – 40 %, (в т.ч 1 % - в неизменённом виде). Легко проникает через гистогематические барьеры, в т.ч. через плацентарный и гематоэнцефалический, проникает в грудное молоко.

Показания к применению

- Купирование и лечение психотических расстройств различной этиологии;
- Премедикация перед оперативным вмешательством.

Противопоказания

Гиперчувствительность, тяжелое токсическое угнетение функции ЦНС и коматозные состояния любой этиологии; заболевания ЦНС, сопровождающиеся пирамидными и экстрапирамидными расстройствами (болезнь Паркинсона и т.п.); повышенная чувствительность к производным бутирофенона; беременность, период грудного вскармливания; дети до 3-х лет.

С осторожностью: Декомпенсированные заболевания сердечно-сосудистой системы (в т.ч. стенокардия, нарушения внутрисердечной проводимости, удлинение интервала QT или предрасположенность к этому - гипокалиемия, одновременное применение др. лекарственных средств (ЛС), которые могут вызывать удлинение интервала QT, эпилепсия, закрыто-угольная глаукома, печеночная и/или почечная недостаточность, гипертиреоз (с явлениями тиреотоксикоза), легочно-сердечная и дыхательная недостаточность (в т.ч. при ХОБЛ и острых инфекционных заболеваниях), гиперплазия предстательной железы с задержкой мочи, алкоголизм.

Способ применения и дозы

Для купирования психомоторного возбуждения галоперидол в первые дни вводят внутримышечно по 2,5 - 5 мг 2-3 раза в сутки, либо внутривенно в той же дозе (ампулу следует развести в 10-15 мл воды для инъекций), максимальная суточная доза 60 мг. По достижении устойчивого седативного эффекта переходят на прием препарата внутрь. Для пациентов пожилого возраста 0,5 - 1,5 мг (0,1 - 0,3 мл раствора), максимальная суточная доза - 5 мг (1 мл раствора).

Для детей старше 3-х лет доза составляет 0,025 - 0,05 мг в сутки, поделенная на 2 приема. Максимальная суточная доза - 0,15 мг/кг.

Парентеральный способ введения галоперидола должен проводиться под тщательным контролем врача, особенно у пожилых пациентов и детей, при достижении терапевтического эффекта следует перейти на прием препарата внутрь.

Побочные действия

Со стороны нервной системы: головная боль, головокружение, бессонница или сонливость (различной степени выраженности), тревога, акатизия, эйфория, депрессия, судорожные расстройства, экстрапирамидные расстройства; при длительном лечении - поздняя дискинезия (причмокивание и сморщивание губ, надувание щек, быстрые и червеобразные движения языка, неконтролируемые жевательные движения, неконтролируемые движения рук и ног), поздняя дистония (учащенное моргание или спазмы век, необычное выражение лица или положение тела, неконтролируемые изгибающиеся движения шеи, туловища, рук и ног) и злокачественный нейролептический синдром (гипертермия, мышечная ригидность, затрудненное или учащенное дыхание, тахикардия, аритмия, повышение или снижение артериального давления (АД), повышенное потоотделение, недержание мочи, судорожные расстройства, угнетение сознания).

Со стороны сердечно-сосудистой системы: при использовании в высоких дозах -

снижение АД, ортостатическая гипотензия, аритмии, тахикардия, изменения на ЭКГ (удлинение интервала QT, признаки трепетания и мерцания желудочков).

Со стороны пищеварительной системы: при применении в высоких дозах - снижение аппетита, сухость во рту, гипосаливация, тошнота, рвота, диарея или запоры, нарушение функции печени, вплоть до развития желтухи.

Со стороны органов кроветворения: временная лейкопения или лейкоцитоз, агранулоцитоз, эритропения и тенденция к моноцитозу.

Со стороны мочеполовой системы: задержка мочи (при гиперплазии предстательной железы), периферические отеки, боли в грудных железах, гинекомастия, гиперпролактинемия, нарушение менструального цикла, снижение потенции, повышение либидо, приапизм.

Со стороны органов чувств: катаракта, ретинопатия, нечеткость зрения.

Аллергические реакции: макулопапулезные и акнеобразные изменения кожи, фотосенсибилизация, бронхоспазм, ларингоспазм.

Лабораторные показатели: гипонатриемия, гипер- или гипогликемия.

Прочие: алопеция, увеличение массы тела.

Передозировка

При передозировке препарата возможно появление острых нейролептических реакций, перечисленных выше.

Симптомы: ригидность мышц, тремор, сонливость, снижение, иногда повышение артериального давления, в тяжёлых случаях - коматозное состояние, угнетение дыхания, шок, удлинение интервала QT, аритмия.

Особо должно настораживать повышение температуры тела, которое может быть одним из симптомов злокачественного нейролептического синдрома. В тяжелых случаях передозировки могут наблюдаться различные формы нарушения сознания, вплоть до комы, судорожные реакции.

Лечение: При угнетении дыхания может потребоваться искусственная вентиляция лёгких. При гипотонии и коллапсе - внутривенно, для поддержания кровообращения вводят плазму или концентрированный альбумин, допамин, или норэпинефрин. Эпинефрин в этих случаях применять категорически запрещается, так как может спровоцировать выраженную гипотонию! Для купирования экстрапирамидных симптомов центральные холиноблокаторы и противопаркинсонические лекарственные средства. Внутривенно вводят диазепам, раствора глюкозы, ноотропы, витамины группы В и С. Диализ неэффективен. Специфического антидота нет.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Повышает выраженность угнетающего влияния на ЦНС этанола, трициклических антидепрессантов, опиоидных анальгетиков, барбитуратов и снотворных ЛС, средств для общей анестезии.

Усиливает действие периферических антихолинергических блокаторов и большинства гипотензивных средств (снижает действие гуанетидина вследствие вытеснения его из альфа-адренергических нейронов и подавления его захвата этими нейронами). Тормозит метаболизм трициклических антидепрессантов и ингибиторов МАО, при этом увеличивается (взаимно) их седативный эффект и токсичность.

При одновременном применении с бупропионом снижает эпилептический порог и увеличивает риск возникновения больших эпилептических припадков.

Уменьшает эффект противосудорожных средств (снижение судорожного порога галоперидолом).

Ослабляет сосудосуживающее действие допамина, фенилэфрина, норэпинефрина, эфедрина и эпинефрина (блокада альфа-адренорецепторов галоперидолом, что может привести к извращению действия эпинефрина и к парадоксальному снижению АД).

Снижает эффект противопаркинсонических средств (антагонистическое влияние на дофаминергические структуры ЦНС).

Изменяет (может повышать или снижать) эффект антикоагулянтов. Уменьшает действие бромокриптина (может потребоваться корректировка дозы). При применении с метилдопой увеличивает риск развития психических нарушений (в т.ч. дезориентацию в пространстве, замедление и затруднение процессов мышления).

Амфетамины снижают антипсихотическое действие галоперидола, который в свою очередь уменьшает их психостимулирующий эффект (блокада галоперидолом альфа-адренорецепторов).

Антихолинергические, антигистаминные (I поколения) и противопаркинсонические лекарственные средства могут усиливать антихолинергическое влияние галоперидола и снижают его антипсихотическое действие (может потребоваться коррекция дозы).

Длительное применение карбамазепина, барбитуратов и др. индукторов микросомального окисления снижает концентрацию галоперидола в плазме.

В сочетании с препаратами лития (особенно в высоких дозах) возможно развитие энцефалопатии (может вызвать необратимую нейроинтоксикацию) и усиление экстрапирамидной симптоматики.

При одновременном приеме с флуоксетином возрастает риск развития побочных эффектов со стороны ЦНС, особенно экстрапирамидных реакций.

При одновременном применении с препаратами, вызывающими экстрапирамидные реакции, повышает частоту и тяжесть экстрапирамидных расстройств.

Употребление крепкого чая или кофе (особенно в больших количествах) снижает действие галоперидола.

Особые указания

Парентеральное введение должно проводиться под строгим контролем врача, особенно, в случае больных пожилого и детского возраста. По достижении терапевтического эффекта следует перейти на пероральную форму лечения.

Поскольку галоперидол может вызывать удлинение интервала QT, следует соблюдать осторожность при наличии риска пролонгирования QT (синдром QT, гипокалиемия, препараты, вызывающие удлинение интервала QT), особенно при парентеральном введении. В связи с метаболизмом галоперидола в печени, важно проявлять осторожность при назначении его больным с нарушением печёночной функции. Во время лечения больным следует регулярно осуществлять мониторинг ЭКГ, формулы крови, «печеночных» проб. Известны случаи развития судорог, вызванных галоперидолом. Больным эпилепсией и больным, в состояниях, предрасполагающих к развитию судорожного синдрома (алкоголизм, травма головного мозга в анамнезе), препарат следует применять с особой осторожностью.

Для купирования экстрапирамидных расстройств назначают противопаркинсонические средства (циклодол и др.), ноотропы, витамины; их применение продолжают и после отмены галоперидола, если они выводятся из организма быстрее, чем галоперидол во избежание усиления экстрапирамидных симптомов.

При развитии поздней дискинезии рекомендуется постепенное снижение дозы (вплоть до полной отмены препарата).

Необходимо соблюдать осторожность при выполнении тяжелой физической работы, принятии горячей ванны (возможно развитие теплового удара вследствие подавления центральной и периферической терморегуляции в гипоталамусе).

Во время лечения не следует принимать "противопростудные" безрецептурные лекарственные средства (возможно усиление антихолинергических эффектов и риска возникновения теплового удара). Следует защищать открытые участки кожи от избыточного солнечного излучения вследствие повышенного риска фотосенсибилизации.

Лечение прекращают постепенно во избежание возникновения синдрома "отмены".

Противорвотное действие может маскировать признаки лекарственной токсичности и затруднять диагностику состояний, первым симптомом которых является тошнота.

Во время приёма галоперидола запрещается вождение транспортных средств, обслуживание механизмов и выполнение других видов работ, требующих повышенной концентрации внимания, а так же приём алкоголя.

Форма выпуска

Раствор для внутривенного и внутримышечного введения 5 мг/мл.

По 1 мл в ампулы из стекла янтарного цвета. По 5 ампул вместе с инструкцией по применению в картонную пачку.

Условия хранения

В сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25°С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года. Не использовать препарат после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек

По рецепту

Производитель

«Сан Фармасьютикал Индастриз Лтд.», Индия

«Sun Pharmaceutical Industries Ltd.», India

Халол Барода Хайвэй,

Халол-389 350,

Дист. Панчмахал,

Гуджарат, Индия

Направление претензий по качеству в адрес Московского представительства:

117420, г.Москва, ул.Профсоюзная, дом 57, офис 722

тел. (495) 334-28-77

Глава Представительства К.К.Каннипутур