по медицинскому применению препарата

ЛЕПТИНОРМ

Регистрационный номер:
Торговое название препарата: ЛЕПТИНОРМ
Международное непатентованное название: рисперидон
Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой
Состав:
Дозировка 2 мг
Ядро таблетки: *действующее вещество:* рисперидон 2 мг;
вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, крахмал кукурузный, целлюлоза мирокристаллическая (Avicel pH 101), гипромеллоза – 2910 (5 cps), натрия лаурилсульфат, целлюлоза мирокристаллическая (Avicel pH 102), кремния диоксид коллоидный, магния стеарат.
Оболочка: гипромеллоза – 2910 (5 cps), гипромеллоза – 2910 (15 cps), пропиленгликоль, титана диоксид, тальк очищенный, краситель оранжево-желтый S.
Дозировка 4 мг
Ядро таблетки: *действующее вещество:* рисперидон 4 мг;
вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, крахмал кукурузный, целлюлоза мирокристаллическая (Avicel pH 101), гипромеллоза – 2910 (5 cps), натрия лаурилсульфат, целлюлоза мирокристаллическая (Avicel pH 102), кремния диоксид коллоидный, магния стеарат.
Оболочка: гипромеллоза – 2910 (5 cps), гипромеллоза – 2910 (15 cps), пропиленгликоль, титана диоксид, тальк очищенный, краситель индигокармин (E132), краситель хинолин желтый (E104).

Описание
2мг: Светло-оранжевая двояковыпуклая таблетка продолговатой формы, покрытая пленочной оболочкой, с риской на одной стороне.
4 мг: Зеленая двояковыпуклая таблетка продолговатой формы, покрытая пленочной оболочкой, с риской на одной стороне.

Фармакотерапевтическая группа: антипсихотическое средство (нейролептик)
Код АТХ: N05AX08

Фармакологические свойства
Фармакодинамика
Рисперидон является антипсихотическим средством, оказывает также седативное, противорвотное и гипотермическое действие. Рисперидон является селективным моноаминергическим антагонистом с выраженным сродством к серотонинергическим 5-НТ2 и дофаминергическим D2-рецепторам, связывается также с альфа1-адренорецепторами и при несколько меньшей аффинности с Н1-гистаминергическими и альфа2-адренергическими рецепторами. Не обладает тропностью к холинорецепторам
Антипсихотическое действие обусловлено блокадой дофаминовых D2-рецепторов мезолимбической и мезокортикальной системы.
Седативное действие обусловлено блокадой адренорецепторов ретикулярной формации ствола головного мозга; противорвотное действие - блокадой дофаминовых D2-рецепторов триггерной зоны рвотного центра; гипотермическое действие - блокадой дофаминовых рецепторов гипоталамуса.
Снижает продуктивную симптоматику (бред, галлюцинации), автоматизм. Вызывает меньшее подавление моторной активности и в меньшей степени индуцирует каталепсию, чем классические антипсихотические средства (нейролептики).
Сбалансированный центральный антагонизм к серотонину и дофамину может уменьшать риск возникновения экстрапирамидной симптоматики.
Рисперидон может вызывать дозозависимое увеличение концентрации пролактина в плазме

Фармакокинетика

При приёме внутрь рисперидон полностью всасывается (независимо от приема пищи) и максимальные уровни концентрации в плазме крови наблюдаются через 1-2 часа.

Рисперидон подвергается метаболизму с участием Р-450 2D6 цитохрома с образованием 9-гидроксирисперидона, который обладает аналогичным фармакологическим действием. Рисперидон и 9-гидроксирисперидон представляют собой активную антипсихотическую фракцию. Дальнейший метаболизм рисперидона заключается в N-дезалкилировании. При приёме внутрь рисперидон выводится с периодом полувыведения около 3 часов. У большинства пациентов равновесная концентрация рисперидона наблюдается через один день после начала лечения. Равновесное состояние 9-гидроксирисперидона в большинстве случаев достигается через 3-4 дня после начала лечения.

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

Рисперидон быстро распределяется в организме. Объём распределения составляет 1-2 л/кг. Связь с белками плазмы (с альбумином и альфа-1-гликопротеином) рисперидона составляет 88%, 9-гидроксирисперидона - 77%.

Выводится почками –70% (из них 35-45% в виде фармакологически активной фракции) и 14 % с желчью. При однократном приеме отмечаются высокие уровни концентрации в плазме и медленное выведение у пожилых пациентов и больных с недостаточной функцией почек.

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 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 болезни.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к компонентам препарата; период лактации.

С осторожностью:

- Заболевания сердечно-сосудистой системы (хроническая сердечная недостаточность, перенесенный инфаркт миокарда, нарушения проводимости сердечной мышцы)
- обезвоживание и гиповолюмия
- нарушения мозгового кровообращения
- болезнь Паркинсона
- судороги (в том числе в анамнезе)
- тяжелая почечная или печеночная недостаточность (см. рекомендации по дозированию)
- злоупотребление лекарственными средствами или лекарственная зависимость (см. рекомендации по дозированию)
- состояния, предрасполагающие к развитию тахикардии типа «пируэт» (брадикардия, нарушение электролитного баланса, сопутствующий прием лекарственных средств, удлиняющих интервал QT)
- опухоль мозга, кишечная непроходимость, случаи острой передозировки лекарств, синдром Рейе (противорвотный эффект рисперидона может маскировать симптомы этих состояний)
- беременность, детский возраст до 15 лет (эффективность и безопасность не установлены).

Беременность и период лактации. Безопасность рисперидона у беременных не изучалась. Лептинорм можно использовать при беременности только в том случае, если положительный эффект лечения матери оправдывает возможный риск для плода.
Поскольку рисперидон и 9-гидроксирисперидон проникают в грудное молоко, применение препарата в период кормления грудью противопоказано.

Способ применения и дозы
Шизофрения.
Взрослые и дети старше 15 лет. Рисперидон может назначаться один или два раза в сутки. Начальная доза - 2 мг в сутки. На второй день дозу следует увеличить до 4 мг в сутки. С этого момента дозу можно либо сохранить на прежнем уровне, либо индивидуально скорректировать при необходимости. Обычно оптимальной дозой является 4-6 мг в сутки. В ряде случаев может быть оправдано более медленное повышение дозы и более низкие начальная и поддерживающая дозы.
Дозы выше 10 мг в сутки не показали более высокой эффективности по сравнению с меньшими дозами и могут вызвать появление экстрапирамидных симптомов. В связи с тем, что безопасность доз выше 16 мг в сутки не изучалась, дозы выше этого уровня применять нельзя.
Пожилые пациенты. Рекомендуется начальная доза 0,5 мг на прием дважды в сутки. Дозировку можно индивидуально увеличить от 0,5 мг дважды в сутки до 1-2 мг дважды в сутки.
Заболевания печени и почек. Рекомендуется начальная доза 0,5 мг на прием 2 раза в сутки. Эту дозу постепенно можно увеличить до 1-2 мг на прием дважды в сутки.
Злоупотребление лекарственными средствами или лекарственная зависимость - рекомендуемая суточная доза препарата – 2-4 мг.
Поведенческие расстройства у больных с деменцией.
Рекомендуется начальная доза по 0,25 мг на прием дважды в сутки (следует использовать адекватную лекарственную форму). Дозировку при необходимости можно индивидуально увеличивать по 0,25 мг 2 раза в сутки, не чаще, чем через день. Для большинства пациентов оптимальной дозой является 0,5 мг дважды в сутки. Однако некоторым пациентам показан прием по 1 мг 2 раза в сутки.
По достижении оптимальной дозы может быть рекомендован прием препарата один раз в сутки.
Мании при биполярных расстройствах
Рекомендованная начальная доза препарата - 2 мг в сутки в один прием. При необходимости эта доза может быть повышена на 2 мг в день, не чаще, чем через день. Для большинства пациентов оптимальной дозой является 2-6 мг в сутки.
Расстройства поведения у пациентов с задержкой умственного развития
Пациенты с массой тела 50 кг и более - рекомендованная начальная доза препарата – 0,5 мг один раз в сутки. При необходимости эта доза может быть повышена на 0,5 мг в сутки, не чаще, чем через день. Для большинства пациентов оптимальной дозой является доза 1 мг в сутки. Однако для некоторых пациентов предпочтительней прием по 0,5 мг в сутки, тогда как некоторым требуется увеличение дозы до 1,5 мг в сутки.
Пациенты с массой тела менее 50 кг - Рекомендованная начальная доза препарата – 0,25 мг один раз в сутки. При необходимости эта доза может быть повышена на 0,25 мг в сутки, не чаще, чем через день. Для большинства пациентов оптимальной дозой является доза 0,5 мг в сутки. Однако для некоторых пациентов предпочтительней прием по 0,25 мг в сутки, тогда как некоторым требуется увеличение дозы до 0,75 мг в сутки.
Рекомендуется в 2 раза уменьшить как начальную дозу, так и последующие увеличения дозы у престарелых пациентов и у больных с почечной или печеночной недостаточностью.
Длительный прием рисперидона у подростков должен проводиться под постоянным контролем врача.

Побочное действие
Со стороны 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), поздняя дискинезия (непроизвольные ритмические движения преимущественно языка и/или лица), нейролептический злокачественный синдром (гипертермия, мышечная ригидность, нестабильность автономных функций, нарушение сознания и повышение уровня креатинфосфокиназы), 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 артериального давления.

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.

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

Прочие: артралгия, возможна гиперволемия, вызванная полидипсией или синдромом неадекватной секреции антидиуретического гормона.

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. Симптоматическая терапия, направленная 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.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

С учетом того, что рисперидон оказывает действие в первую очередь на центральную нервную систему, его следует применять с осторожностью в сочетании с другими препаратами центрального действия и с алкоголем.

Рисперидон уменьшает эффективность леводопы и других агонистов дофамина.

Клозапин снижает клиренс рисперидона.

При использовании карбамазепина отмечалось снижение концентрации активной антипсихотической фракции в плазме. Аналогичные эффекты могут наблюдаться при использовании других индукторов печеночных ферментов.

Флуоксетин может повышать концентрацию рисперидона в плазме (в меньшей степени активной антипсихотической фракции, т.к. не влияет на концентрацию в плазме 9-гидроксирисперидона).

При применении рисперидона 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 артериального давления на фоне рисперидона.

Особые указания

При шизофрении, в начале лечения рисперидоном, рекомендуется постепенно отменить предыдущую терапию, если это клинически оправдано. Если пациенты переводятся с терапии депо-формами антипсихотических препаратов, то прием рисперидона рекомендуется начинать вместо следующей запланированной инъекции.
В связи с α-адреноблокирующим действием Рисперидона может возникать ортостатическая гипотония, 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.
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 нейролептического злокачественного синдрома, характеризующегося гипертермией, мышечной ригидностью, нестабильностью автономных функций, нарушениями сознания и повышением уровня креатинфосфокиназы 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.

Влияние на способность управлять автомобилем и другими механизмами.
Во время лечения необходимо воздержаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций, а также от приёма алкоголя.

Форма выпуска
Таблетки, покрытые пленочной оболочкой 2 мг, 4 мг.
10 таблеток в блистер из трехслойной ПВХ/ПЭНП/ПВДХ пленки и алюминиевой фольги.
3 блистера для дозировки 4 мг, 2 или 3 блистера для дозировки 2 мг в картонную пачку вместе с инструкций по применению.

Условия хранения
При температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности
2 года. Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек
По рецепту

Производитель
ТОРРЕНТ ФАРМАСЬЮТИКАЛС Лтд., Индия

Претензии по качеству препарата направлять по адресу:
Представительство в России:
г. Москва 117418
ул. Новочеремушкинская, д. 61
тел: (495) 232 04 30/31
факс: (495) 232 94 09

И.о. директора ИДКЭЛС А.Н. Васильев

Представитель фирмы О.Н. Лукьянова