

ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению препарата.

РИСПАКСОЛ®

РЕГИСТРАЦИОННЫЙ НОМЕР:

МЕЖДУНАРОДНОЕ НЕПАТЕНТОВАННОЕ НАЗВАНИЕ (МНН): рисперидон.

ТОРГОВОЕ НАЗВАНИЕ ПРЕПАРАТА: Рискасол®.

ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА: таблетки покрытые пленочной оболочкой.

СОСТАВ

1 таблетка содержит:

действующее вещество: рисперидон - 1 мг, 2 мг или 4 мг.

вспомогательные вещества: лактоза, безводная; крахмал кукурузный, магния стеарат, кремния диоксид коллоидный, безводный; целлюлоза микрокристаллическая.

Оболочка таблетки:

таблетки 1 мг: краситель – Опадрай II белый 33G28707 (гипромеллоза (гидроксипропилметилцеллюлоза), лактоза моногидрат, макрогол 3000, титана диоксид, глицерилтриацетат); карнаубский воск;

таблетки 2 мг: краситель – Опадрай оранжевый OY-8729 (гипромеллоза (гидроксипропилметилцеллюлоза), макрогол 400, титана диоксид, желтый «солнечный закат» FCF (E 110), желтый хинолиновый (E 104)), макрогол 6000, карнаубский воск.

таблетки 4 мг: краситель – Опадрай АМБ зеленый 80W21165 (железа оксид черный (E 172), индигокармин (E 132), лецитин сои, спирт поливиниловый, желтый хинолиновый (E 104), тальк, титана диоксид, ксантановая камедь), карнаубский воск.

ОПИСАНИЕ

Таблетки 1 мг:

круглые двояковыпуклые таблетки с риской на одной стороне, покрытые оболочкой белого цвета. На месте разлома белые.

Таблетки 2 мг:

круглые двояковыпуклые таблетки с риской на одной стороне, покрытые оболочкой оранжевого цвета. На месте разлома белые.

Таблетки 4 мг:

круглые двояковыпуклые таблетки с риской (на четыре части) на одной стороне, покрытые оболочкой зеленого цвета. На месте разлома белые.

ФАРМАКОТЕРАПЕВТИЧЕСКАЯ ГРУППА

антипсихотическое средство (нейролептик).

Код АТХ: N05AX08



ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

Фармакодинамика

Антипсихотическое средство (нейролептик), производное бензизоксазола; оказывает также седативное, противорвотное и гипотермическое действие.

Рisperидон является селективным моноаминергическим антагонистом с выраженным сродством к серотонинергическим 5-HT₂ и дофаминергическим D₂-рецепторам, связывается также с альфа₁-адренорецепторами и, при несколько меньшей аффинности, с H₁-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, агрессивность), автоматизм. Вызывает меньшее подавление моторной активности и в меньшей степени индуцирует каталепсию, чем классические антипсихотики (нейролептики).

Сбалансированный центральный антагонизм к серотонину и дофамину может уменьшать риск возникновения экстрапирамидной симптоматики.

Рisperидон может вызывать дозозависимое увеличение концентрации пролактина в плазме.

Фармакокинетика

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

Рisperидон подвергается метаболизму с участием Р-450 IID₆ цитохрома с образованием 9-гидроксириперидона, который обладает аналогичным фармакологическим действием. Рisperидон и 9-гидроксириперидон представляют собой эффективную антипсихотическую фракцию.

При приеме внутрь рisperидон выводится с периодом полувыведения около 3 часов. Установлено, что период полувыведения 9-гидроксириперидона и активной антипсихотической фракции составляет 24 часа.

У большинства пациентов равновесная концентрация рisperидона наблюдается через один день после начала лечения. Равновесное состояние 9-гидроксириперидона в большинстве случаев достигается через 3-4 дня после начала лечения. Концентрация рisperидона в плазме пропорциональна дозе препарата (в пределах терапевтических доз).

Рisperидон быстро распределяется в организме. Объем распределения составляет 1 - 2 л/кг. В плазме рisperидон связывается с альбумином и α -1-гликопротеидом. Связывание рisperидона с белками плазмы составляет 88 %, 9-гидроксириперидона – 77 %.

Выводится почками – 70 % (из них 35 – 45 % в виде фармакологически активной фракции) и 14 % – с желчью. Остальное количество приходится на неактивные метаболиты.

У пациентов пожилого возраста после однократного приема препарата внутрь наблюдались повышенные концентрации активной фракции в плазме до 30 %, и у больных с почечной недостаточностью – до 60 %, а также сниженный клиренс антипсихотической фракции.

Наличие печеночной недостаточности не влияет на содержание концентрации рисперидона в плазме, но у таких больных среднее количество свободной фракции в плазме было на 35 % выше.

ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ

- шизофрения (острая и хроническая) и другие психотические состояния с преобладанием продуктивной симптоматики (бред, галлюцинации, агрессивность), негативной симптоматики (скудость речи, эмоциональная и социальная отрешенность);
- аффективные расстройства при различных психических заболеваниях;
- поведенческие расстройства у пациентов с деменцией при проявлении симптомов агрессивности (вспышки гнева, физическое насилие), при нарушениях 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 гиповолемия;
- 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).

Применение при беременности и в период лактации. Безопасность применения рисперидона у беременных не изучалась. При беременности можно использовать только в том случае, если положительный эффект оправдывает возможный риск. Поскольку рисперидон и 9-гидроксирисперидон проникают в грудное молоко, женщинам, применяющим препарат, не следует кормить грудью.

СПОСОБ ПРИМЕНЕНИЯ И ДОЗЫ

Риспаксол можно принимать во время еды или в перерывах между едой; таблетки можно запивать небольшим количеством воды.



Шизофрения

Взрослые и дети старше 15 лет.

Рisperидон 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.

Сведения по использованию для лечения шизофрении у детей моложе 15 лет отсутствуют.

Пожилые пациенты.

Рекомендуется начальная доза 0,5 мг на прием дважды в сутки. Дозировку можно индивидуально увеличить по 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 день (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 день. Однако некоторым пациентам показан прием по 1 мг 2 раза в день.

По достижении оптимальной дозы может быть рекомендован прием препарата один раз в день.

Мании при биполярных расстройствах

Рекомендованная начальная доза препарата - 2 мг в день за 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, весящие 50 кг и более - рекомендованная начальная доза препарата - 0,5 мг в один раз в день. При необходимости эта доза может быть повышена на 0,5 мг в день, не чаще чем через день. Для большинства пациентов оптимальной дозой является доза 1 мг в день. Однако для некоторых пациентов предпочтительней прием по 0,5 мг в день, тогда как некоторым требуется увеличение дозы до 1,5 мг в день.

Пациенты, весящие менее 50 кг - рекомендованная начальная доза препарата - 0,25 мг один раз в день. При необходимости эта доза может быть повышена на 0,25 мг в день, не чаще чем через день. Для большинства пациентов оптимальной дозой является доза 0,5 мг в день. Однако для некоторых пациентов предпочтительней прием по 0,25 мг в день, тогда как некоторым требуется увеличение дозы до 0,75 мг в день.

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

Применение у детей младше 15 лет не рекомендуется.

ПОБОЧНОЕ ДЕЙСТВИЕ

Как и другие лекарственные средства, риспаксол может оказать побочное действие, которое, однако, проявляется не у всех.

Риспаксол обладает хорошей переносимостью.

Возможны следующие побочные действия:

Со стороны центральной нервной системы (ЦНС): бессонница, жажда, тревога, головная боль; иногда – сонливость, утомляемость, головокружение, нарушение концентрации внимания, нарушение четкости зрения; редко – экстрапирамидные симптомы (в т.ч. тремор, ригидность, гиперсаливация, брадикинезия, акатизия, острая дистония). У больных с шизофренией возможны гиперволеия (либо из-за полидипсии, либо из-за синдрома неадекватной секреции антидиуретического гормона), поздняя дискинезия (непроизвольные ритмические движения преимущественно языка и/или лица), злокачественный нейролептический синдром (гипертермия, мышечная ригидность, нестабильность вегетативных функций, нарушение сознания и повышение уровня креатинфосфокиназы), нарушения терморегуляции и судорожные припадки.

Со стороны пищеварительной системы: запор, диспепсия, тошнота, рвота, боли в животе, повышение активности печеночных ферментов, сухость во рту, гипо- или гиперсаливация, анорексия, усиление аппетита, повышение или снижение массы тела.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: ортостатическая гипотензия и рефлекторная тахикардия, повышение артериального давления. На фоне терапии риспаксомом описано развитие инсультов, в основном, у пожилых больных с предрасполагающими факторами.

Со стороны системы кроветворения: нейтропения, тромбоцитопения.

Со стороны эндокринной системы: возможны галакторея, гинекомастия, нарушения менструального цикла, аменорея; в единичных случаях - развитие гипергликемии или ухудшение течения сахарного диабета.

Со стороны мочеполовой системы: приапизм, нарушения эрекции, нарушения эякуляции, аноргазмия, недержание мочи.

Аллергические реакции: ринит, кожная сыпь, ангионевротический отек.

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

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. Симптоматическая терапия, направленная на поддержание жизненно важных функций организма.

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

ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ С ДРУГИМИ ЛЕКАРСТВЕННЫМИ ПРЕПАРАТАМИ

С учетом того, что риспаксол оказывает воздействие в первую очередь на ЦНС, его следует применять с осторожностью в сочетании с другими препаратами центрального действия и алкоголем. Риспаксол уменьшает эффективность леводопы и других агонистов дофамина. Клозапин снижает клиренс рисперидона. При одновременном применении риспаксола и карбамазепина отмечалось снижение концентрации активной антипсихотической фракции рисперидона в плазме. Аналогичные эффекты могут наблюдаться при использовании других индукторов печеночных ферментов. При одновременном применении с риспаксомом фенотиазины, трициклические антидепрессанты и некоторые бета-адреноблокаторы могут повышать концентрации рисперидона в плазме, однако это не влияет на концентрацию активной антипсихотической фракции.

При одновременном применении с риспаксомом флуоксетин может повышать концентрацию рисперидона в плазме, однако, в меньшей степени концентрацию активной антипсихотической фракции. При применении риспаксола вместе с другими препаратами, в высокой степени связывающимися с белками плазмы, клинически выраженного вытеснения какого-либо препарата из белковой фракции плазмы не наблюдается. Антигипертензивные препараты усиливают выраженность снижения артериального давления на фоне приема риспаксола.

ОСОБЫЕ ПРЕДУПРЕЖДЕНИЯ И МЕРЫ ПРЕДОСТОРОЖНОСТИ

Переход от терапии другими антипсихотическими препаратами.

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. Периодически следует оценивать необходимость продолжения терапии противопаркинсоническими лекарственными средствами.

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, согласно рекомендациям (см. Способ применения и дозы).

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.

Таблетки риспаксола содержат лактозу. Данный препарат не следует принимать пациентам с непереносимостью сахаров, а именно с редко встречающейся врожденной непереносимостью галактозы, дефицитом лактазы, или синдромом мальабсорбции глюкозы/галактозы.



Рекомендации водителям транспортных средств и операторам

Риспаксол может повлиять на активную деятельность, для которой необходима быстрота реакций. Поэтому не следует управлять автомобилем или обслуживать механизмы, пока не выявлена индивидуальная переносимость препарата.

ФОРМА ВЫПУСКА

Таблетки покрытые пленочной оболочкой 1 мг, 2 мг или 4 мг.

По 10 таблеток в блистере (ПВХ/фольга). 2 или 6 блистеров вместе с инструкцией по медицинскому применению в пачке картонной.

УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ

Хранить в защищенном от света месте, 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 врача.

ПРОИЗВОДИТЕЛЬ

АО ГРИНДЕКС.

Ул. Крустпилс, 53, Рига, LV-1057, Латвия

Телефон +371 67083205.

Факс: +371 67083505

Электронная почта: grindeks@grindeks.lv

Организация, принимающая претензии: представительство в Москве.

Адрес представительства: 123242, Москва, ул. Б. Грузинская, д. 14, комн. правления 2, тел. в Москве (495) 7716505*.

И.о. директора ИДКЭЛС

Представитель фирмы

А.Н. Васильев



* В случае изменения телефонного номера представительства указывается новый номер телефона.