

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ И СОЦИАЛЬНОГО РАЗВИТИЯ
РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

Рисполепт Конста®

наименование лекарственного препарата

Регистрационный номер –

Торговое название: Рисполепт Конста®

Международное непатентованное название: рисперидон

Химическое название: 3[2-[4-(6-фтор-1,2-бензизоксазол-3-ил)пиперидил]этил]-6,7,8,9-тетрагидро-2-метил-4Н-пиридо[1,2-а]пиримидин-4-он

Лекарственная форма: Порошок для приготовления суспензии для внутримышечного введения пролонгированного действия

Состав

Активный компонент: рисперидон в виде микрогранул пролонгированного высвобождения (381 мг рисперидона в 1 г микрогранул).

Вспомогательные вещества: молочной и гликолевой кислот сополимер – 619 мг.

Растворитель: кармеллоза натрия 40 мПа·с – 22,5 мг, полисорбат 20 – 1,0 мг, натрия гидрофосфата дигидрат – 1,27 мг, лимонная кислота безводная – 1,0 мг, натрия хлорид – 6,0 мг, натрия гидроксид – 0,54 мг, вода для инъекций – до 1 мл.

Описание

Порошок: белый или почти белый порошок, свободный от видимых посторонних включений.

Растворитель: прозрачный бесцветный раствор, свободный от видимых механических включений.

Суспензия: препарат должен легко образовывать суспензию в растворителе, в суспензии не должно быть комков или видимых включений. Суспензия должна проходить через иглу плавно, с небольшим сопротивлением или без сопротивления.

Фармакотерапевтическая группа: прочие антипсихотические препараты.

Код АТХ: N05AX08

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

Фармакодинамика

Рisperидон является избирательным моноаминергическим антагонистом. Он обладает высоким аффинитетом к серотонинергическим 5-HT₂-рецепторам и дофаминергическим D₂-рецепторам. Кроме того, рisperидон связывается с альфа₁-адренергическими рецепторами и, в меньшей степени, с H₁-гистаминергическими и альфа₂-адренергическими рецепторами. Рisperидон не связывается с холинергическими рецепторами. Несмотря на то, что рisperидон является мощным антагонистом D₂-рецепторов, благодаря чему он улучшает позитивные симптомы шизофрении, этот препарат, по сравнению с типичными нейролептиками, в меньшей степени угнетает двигательную активность и реже вызывает каталепсию. Благодаря сбалансированному центральному антагонизму в отношении серотониновых и дофаминовых рецепторов рisperидон реже вызывает экстрапирамидные побочные эффекты и оказывает терапевтическое действие на негативные и аффективные симптомы шизофрении.

Фармакокинетика

Рisperидон метаболизируется изоферментом CYP2D6 до 9-гидроксириперидона, который обладает такой же фармакологической активностью, как сам рisperидон. Рisperидон и 9-гидроксириперидон образуют активную антипсихотическую фракцию. Другим путем метаболизма рisperидона является N-деалкилирование.

У быстрых метаболизаторов клиренс активной антипсихотической фракции и рisperидона составляет 5,0 и 13,7 л/ч соответственно, а у слабых метаболизаторов – 3,2 и 3,3 л/ч соответственно.

Общие характеристики рisperидона после инъекции пациентам препарата Рisperолепт Конста®

При однократном внутримышечном введении препарата Рisperолепт Конста® профиль высвобождения рisperидона состоит из небольшой начальной фазы (<1% дозы), за которой следует интервал продолжительностью 3 недели. После внутримышечной инъекции основное высвобождение рisperидона начинается через 3 недели, поддерживается с 4-й по 6-ю неделю и снижается к 7-й неделе. В связи с этим, пациент должен принимать дополнительный антипсихотический препарат в течение первых 3 недель после начала лечения препаратом Рisperолепт Конста®.

Сочетание профиля высвобождения рisperидона и режима дозирования (внутримышечная инъекция один раз в две недели) обеспечивает поддержание в плазме терапевтических концентраций рisperидона. Терапевтические концентрации сохраняются до 4-й–6-й недели после последней инъекции препарата Рisperолепт Конста®. Фаза элиминации завершается примерно через 7–8 недель после последней инъекции.

Рisperидон полностью абсорбируется из суспензии Рisperолепт Конста®.

Рisperидон быстро распределяется в тканях организма. Объем распределения составляет 1–2 л/кг. В плазме рisperидон связывается с альбумином и альфа₁-кислым гликопротеином. Связь с белками плазмы рisperидона составляет 90%, а 9-гидроксириперидона – 77%.

После внутримышечных инъекций препарата Рisperолепт Конста® в дозах 25 или 50 мг один раз в две недели средние значения минимальной и максимальной концентрации в плазме активной антипсихотической фракции составляют 9,9–19,2 нг/мл и 17,9–45,5 нг/мл соответственно. При таком режиме дозирования фармакокинетика рisperидона носит линейный характер. В длительном применении (12 месяцев) у пациентов, которым один раз в две недели вводили препарат Рisperолепт Конста® в дозах 25–50 мг, кумуляции рisperидона не наблюдалось. Изучение применения однократной дозы пероральной формы рisperидона показало более высокие концентрации в плазме и уменьшенный клиренс активной антипсихотической фракции на 30% у пожилых пациентов и на 60% у пациентов с почечной недостаточностью. Концентрации рisperидона в плазме у пациентов с печеночной недостаточностью находились в норме, но среднее значение свободной фракции в плазме увеличивалось на 35%.

Показания к применению

Лечение и профилактика обострений шизофрении и шизоаффективных расстройств.

Противопоказания

Гиперчувствительность к рисперидону или к любому другому ингредиенту этого препарата.
Период лактации. Детский возраст до 18 лет.

С осторожностью

Применять с осторожностью при следующих состояниях:

- заболевания сердечно-сосудистой системы (хроническая сердечная недостаточность, перенесенный инфаркт миокарда, нарушения проводимости сердечной мышцы);
- обезвоживание и гиповолемия;
- нарушения мозгового кровообращения;
- болезнь Паркинсона;
- судороги и эпилепсия (в том числе в анамнезе);
- тяжелая почечная или печеночная недостаточность (см. раздел «Способ применения и дозы»);
- злоупотребление лекарственными средствами или лекарственная зависимость;
- 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.

Применение при беременности

Данных о безопасности применения рисперидона у беременных женщин нет. В экспериментах на животных рисперидон не оказывал прямого токсического действия на репродуктивную систему, но вызывал некоторые косвенные эффекты, опосредованные через пролактин и ЦНС. Ни в одном из исследований рисперидон не обладал тератогенным действием. Таким образом, Рисполепт Конста® можно применять во время беременности только в тех случаях, когда потенциальная польза для женщины перевешивает возможный риск для плода.

Применение при лактации

В экспериментах на животных рисперидон и 9-гидроксирисперидон экскретируются с молоком. Обнаружено также, что рисперидон и 9-гидроксирисперидон выделяются с молоком человека. Таким образом, женщины, принимающие Рисполепт Конста®, не должны кормить грудью.

Способ применения и дозы

У пациентов, которые ранее не получали рисперидон, рекомендуется определить переносимость пероральных лекарственных форм рисперидона, прежде чем приступать к лечению препаратом Рисполепт Конста®.

Рисполепт Конста® вводят один раз в 2 недели посредством глубокой инъекции в ягодичную мышцу, используя для этого прилагаемую к шприцу стерильную иглу. Инъекции следует делать попеременно в правую и левую ягодицы. Препарат нельзя вводить внутривенно.

Инструкции по применению даны в разделе «Указания по применению».

Взрослые

Рекомендуемая доза составляет 25 мг внутримышечно один раз в 2 недели. Некоторые пациенты нуждаются в более высоких дозах: 37,5 или 50 мг. В клинических исследованиях не наблюдалось увеличения эффективности при применении 75 мг. Максимальная доза не должна превышать 50 мг один раз в 2 недели.

В 3-недельный период после первого введения препарата Рисполепт Конста® пациент должен принимать эффективное антипсихотическое средство.

Дозу препарата можно повышать не чаще, чем один раз в 4 недели. Эффект такого повышения дозы следует ожидать не раньше, чем через 3 недели после первой инъекции увеличенной дозы.

Пожилые пациенты

Рекомендуемая доза составляет 25 мг внутримышечно один раз в 2 недели. В 3-недельный период после первой инъекции препарата Рисполепт Конста® пациент должен принимать эффективное антипсихотическое средство.

Пациенты с нарушениями функции печени или почек

В настоящее время нет данных о применении препарата Рисполепт Конста® у пациентов с нарушениями функции печени или почек.

Если все же пациента с нарушениями функции печени или почек нужно будет лечить препаратом Рисполепт Конста®, то в первую неделю рекомендуется принимать внутрь 0,5 мг два раза в сутки пероральную лекарственную форму рисперидона. В течение второй недели пациент может принимать 1 мг два раза в сутки или 2 мг один раз в сутки. Если пациент хорошо переносит пероральную дозу не менее 2 мг, то ему можно вводить внутримышечно 25 мг препарата Рисполепт Конста® один раз в 2 недели.

Побочное действие

Побочные эффекты препарата Рисполепт Конста® в терапевтических дозах приведены с распределением по частоте и системно-органным классам. Частоту побочных эффектов классифицировали следующим образом: очень частые ($\geq 1/10$), частые ($\geq 1/100$ и $< 1/10$), нечастые ($\geq 1/1000$ и $< 1/100$), редкие ($\geq 1/10000$ и $< 1/1000$) и очень редкие ($< 1/10000$).

Инфекции:

часто – инфекции верхних дыхательных путей;

нечасто – назофарингит, гриппоподобные инфекции, бронхит, инфекции мочевыводящих путей, ринит, инфекции уха, пневмония, инфекции дыхательных путей (в т.ч. нижних), фарингит, синусит, вирусные инфекции, локализованные инфекции, цистит, гастроэнтерит, подкожный абсцесс.

Гематологические нарушения и нарушения лимфатической системы:

нечасто – нейтропения, анемия;

очень редко – агранулоцитоз, тромбоцитопения.

Нарушения со стороны иммунной системы:

нечасто – гиперчувствительность;

очень редко – анафилактический шок.

Нарушения со стороны эндокринной системы:

нечасто – гиперпролактинемия;

редко – нарушение секреции антидиуретического гормона.

Нарушения метаболизма и питания:

часто – повышенный аппетит, сниженный аппетит;

нечасто – анорексия, гипергликемия;

очень редко – диабетический кетоацидоз, сахарный диабет, гипогликемия, водная интоксикация.

Нарушения со стороны нервной системы:

очень часто – головная боль, паркинсонизм (включая экстрапирамидные расстройства, мышечную ригидность, гипокинезию, ригидность по типу «зубчатого колеса», брадикинезию, мышечные судороги), головокружение, акатизия (включая беспокойство), тремор;

часто – сонливость, седация, обморок, гипестезия, нарушения внимания;

нечасто – нарушение координации, дистония, поздняя дискинезия, заторможенность, слюнотечение, парестезия, постуральное головокружение, повышенная сонливость, судороги, акинезия, дизартрия.

Психические нарушения:

нечасто – бессонница, беспокойство, возбуждение, депрессия, нарушение сна, нарушение засыпания, уменьшение либидо, нервозность;

очень редко – мании.

Нарушения со стороны глаз:

часто – затуманенность зрения;

нечасто – конъюнктивит, уменьшение остроты зрения;

очень редко – окклюзия артерии сетчатки (наблюдается при наличии внутрисердечного дефекта, предрасполагающего к шунту справа налево, например, “овальное окно”).

Нарушения со стороны уха и лабиринта:

нечасто – боль в ухе, вертиго.

Нарушения со стороны сердечно-сосудистой системы:

часто – артериальная гипертензия;

нечасто – тахикардия, атриовентрикулярная блокада I степени, ощущение сердцебиения, синусовая брадикардия, блокада правой и левой ножек пучка Гиса, синусовая тахикардия, снижение артериального давления, ортостатическая гипотензия;

очень редко – мерцательная аритмия.

Нарушения со стороны дыхательной системы:

часто – кашель, заложенность носовых пазух;

нечасто – заложенность носа, боли в глотке и в гортани, одышка, ринорея;

очень редко – синдром апноэ во сне.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта:

часто – запор, сухость во рту, диспепсия, тошнота, зубная боль, гиперсекреция слюны;

нечасто – диарея, рвота, боли в животе (в т.ч. в верхней части живота), дискомфорт в желудке, гастрит;

очень редко – непроходимость кишечника, панкреатит.

Гепатобилиарные нарушения:

очень редко – желтуха.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей:

часто – акне, сухость кожи;

нечасто – высыпания, экзема, зуд (в т.ч. генерализованный);

очень редко – отек Квинке (в т.ч. периоральный отек, отек век, отек лица, наследственный отек Квинке, отек гортани и глотки, окуло-респираторный синдром, отек рта, окологлазнич- ный отек, отек тонкой кишки, отек языка), алопеция.

Нарушения со стороны костно-мышечной системы и соединительной ткани:

часто – боли в конечностях, артралгия;

нечасто – нарушение осанки, боли в спине, миалгия, мышечные боли в груди, боли в ягоди- цах, мышечная слабость, боли в шее.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей:

нечасто – недержание мочи;

очень редко – задержка мочеиспускания.

Нарушения со стороны репродуктивной системы и молочных желез:

нечасто – галакторея, олигоменорея, аменорея, эректильная дисфункция, сексуальная дис- функция, нарушения эякуляции, гинекомастия, дискомфорт в груди, нарушение менструаций, замедленная эякуляция;

очень редко – приапизм.

Общие нарушения и нарушения в месте введения инъекции:

часто – усталость, астения, периферические отеки, боли, гипертермия;

нечасто – падения, боль во время инъекции, боли в месте введения, дискомфорт и боли в об- ласти грудной клетки, гриппоподобное состояние, медлительность, недомогание, уплотнение, опухание и другие реакции в месте инъекции;

очень редко – гипотермия, реакции в месте введения инъекции, такие как абсцесс, флегмона, киста, гематома, некроз, узелки, язва (данные побочные действие отмечались как серьезные, в некоторых случаях требовали хирургического вмешательства).

Нарушения лабораторных и инструментальных показателей:

часто – увеличение или уменьшение массы тела;

нечасто – увеличение концентрации пролактина в крови, увеличение активности аланинаминотрансферазы, нарушения ЭКГ, увеличение активности гаммаглутамилтрансферазы, увеличение концентрации глюкозы, увеличение концентрации микросомальных ферментов печени, увеличение активности аспаратаминотрансферазы, удлинение интервала QT на электрокардиограмме, обнаружение глюкозы в моче.

Ниже дополнительно перечислены побочные действия, наблюдаемые при применении пероральных форм рисперидона:

Инфекции: тонзиллит, инфекции глаз, флегмома, средний отит (в том числе хронический), онихомикоз, акродерматит, бронхопневмония, трахеобронхит.

Гематологические нарушения и нарушения лимфатической системы: гранулоцитопения.

Нарушения со стороны иммунной системы: гиперчувствительность к препарату.

Нарушения метаболизма и питания: полидипсия.

Психические нарушения: уплощения аффекта, спутанность сознания, бессонница, апатичность, аноргазмия.

Нарушения со стороны нервной системы: артериальная гипертензия, нарушение равновесия, отсутствие реакции на стимулы, снижение сознания, нарушение движений, паркинсонический тремор, транзиторная ишемическая атака, инфаркт миокарда, инсульт, нарушение речи, потеря сознания, непроизвольные мышечные сокращения, ишемия головного мозга, цереброваскулярные нарушения, злокачественный нейролептический синдром, диабетическая кома.

Нарушения со стороны глаз: гиперемия глаза, выделения из глаз, вращения глаз, отек век, припухлость глаз, образование корки на краях век, сухость глаз, усиленное слезотечение, светобоязнь, глаукома.

Нарушения со стороны уха и лабиринта: шум в ушах.

Нарушения со стороны сердца: атриовентрикулярная блокада.

Сосудистые нарушения: «приливы» крови.

Респираторные, торакальные нарушения и нарушения со стороны средостения: носовое кровотечение, свистящее дыхание, аспирационная пневмония, дисфония, продуктивный кашель, застой крови в легких, застой крови в дыхательных путях, хрипы, нарушения дыхания, гипервентиляция, отек носа.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: дисфагия, фекалома, дискомфорт в желудке, недержание стула, опухание губ, хейлит, аптиализм.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: эритема, нарушение пигментации кожи, повреждение кожи, эритематозные высыпания, папулезные высыпания, гиперкератоз, перхоть, себоррейный дерматит, генерализованная сыпь, макулопапулезная сыпь.

Нарушения со стороны костно-мышечной системы и соединительной ткани: опухание суставов, скованность в суставах, рабдомиолиз, кривошея.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей: недержание мочи, расстройство мочеиспускания, поллакиурия.

Нарушения со стороны репродуктивной системы и молочных желез: выделения из влагалища, ретроградная эякуляция, отсутствие эякуляции, увеличение груди.

Общие нарушения: жажда, плохое самочувствие, нарушение походки, отёк с возникновением ямки при надавливании, озноб, отек лица, дискомфорт, общий отек, синдром отмены препарата, похолодание конечностей.

Нарушения лабораторных и инструментальных показателей: повышение температуры тела, тахикардия, увеличение количества эозинофилов в крови, увеличение количества лейкоцитов в крови, уменьшение гемоглобина, увеличение активности креатининфосфокиназы в плазме, уменьшение гематокрита, снижение артериального давления, уменьшение температуры тела, увеличение активности трансаминаз.

Передозировка

При использовании парентеральных лекарственных форм рисперидона передозировка менее вероятна, чем при применении пероральных форм (таблетки, покрытые пленочной оболочкой, и раствор для приема внутрь), и поэтому здесь приведена информация, касающаяся пероральных форм.

Симптомы:

Симптомы, наблюдаемые при передозировке, являются усиленными известными фармакологическими эффектами. Они включают в себя седативный эффект, сонливость, тахикардию, понижение артериального давления и экстрапирамидные расстройства. Наблюдалось удлинение интервала QT и судороги. Двухнаправленная желудочковая тахикардия отмечалась при одновременном приеме повышенной дозы перорального рисперидона и пароксетина.

В случае передозировки должна быть рассмотрена возможность вовлечения нескольких препаратов.

Лечение:

Обеспечивают и поддерживают проходимость дыхательных путей, адекватную оксигенацию и вентиляцию. Необходим мониторинг функции сердечно-сосудистой системы, который должен включать постоянный контроль ЭКГ для выявления возможных аритмий.

Рисполепт® не имеет специфического антидота, и поэтому лечение должно быть направлено на поддержание функции ЦНС и сердечно-сосудистой системы, а также должна быть проведена дезинтоксикационная терапия. При тяжелых экстрапирамидных симптомах необходимо вводить антихолинергические препараты. Медицинское наблюдение и мониторинг необходимо продолжать до исчезновения признаков передозировки.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

Рисполепт Конста® повышает выраженность угнетающего влияния на ЦНС опиоидных анальгетиков, снотворных средств, анксиолитиков, трициклических антидепрессантов, средств для общей анестезии, алкоголя.

Рисполепт Конста® может ослаблять действие леводопы и других агонистов дофаминовых рецепторов.

Клинически значимая артериальная гипотензия наблюдается при совместном применении рисперидона с антигипертензивными средствами.

Следует соблюдать осторожность при совместном применении Рисполепт Конста® с лекарственными препаратами, увеличивающими интервал QT.

Установлено, что карбамазепин снижает содержание в плазме активной антипсихотической фракции рисперидона. Сходные эффекты могут вызывать и другие индукторы микросомальных ферментов печени. При назначении и после отмены карбамазепина или других индукторов микросомальных ферментов печени следует скорректировать дозу препарата Рисполепт Конста®.

Флуоксетин и пароксетин, ингибиторы микросомальных ферментов печени, увеличивают концентрацию рисперидона в плазме, но в меньшей степени концентрацию активной антипсихотической фракции. При назначении и после отмены флуоксетина или пароксетина следует скорректировать дозу препарата Рисполепт Конста®.

Топирамат умеренно уменьшает биодоступность рисперидона, но не активной антипсихотической фракции. Данное взаимодействие не считается клинически значимым.

Фенотиазины, трициклические антидепрессанты и некоторые бета-адреноблокаторы могут увеличивать концентрации рисперидона в плазме, но в меньшей степени концентрацию активной антипсихотической фракции. Циметидин и ранитидин увеличивают биодоступность рисперидона, но в минимальной степени влияют на концентрацию активной антипсихотической фракции. Эритромицин, ингибитор индукторов микросомальных ферментов печени не влияет на фармакокинетику рисперидона и активной антипсихотической фракции. Ингибито-

ры холинэстеразы (галантамин и донепезил) не оказывают клинически значимого действия на фармакокинетику рисперидона и активной антипсихотической фракции. При совместном приеме с препаратами, обладающими высокой связываемостью с белками плазмы, не наблюдается клинически значимого вытеснения препарата из белков плазмы.

Рisperидон не оказывает клинически значимого действия на фармакокинетику лития, вальпроевой кислоты, дигоксина или топирамата.

См. раздел «Особые указания» о повышенной смертности пожилых пациентов с деменцией при совместном применении фуросемида и пероральных форм рисперидона.

Особые указания

У пациентов, которые ранее не получали рисперидон, рекомендуется определить переносимость пероральных лекарственных форм рисперидона, прежде чем приступать к лечению препаратом Рисполепт Конста®.

Применение у пожилых пациентов с деменцией

Общая смертность

У пожилых пациентов с деменцией при лечении атипичными антипсихотическими средствами наблюдалась повышенная смертность по сравнению с плацебо в мета-анализе 17 контролируемых исследований атипичных антипсихотических средств, включая рисперидон. В плацебо-контролируемых исследованиях пероральных форм рисперидона для данной популяции частота смертельных случаев составила 4,0% для пациентов, принимающих рисперидон, по сравнению с 3,1% для плацебо. Средний возраст умерших пациентов составляет 86 лет (диапазон 67–100 лет).

Одновременное применение с фуросемидом

Для пожилых пациентов с деменцией, принимающих пероральные формы рисперидона, в плацебо-контролируемых исследованиях наблюдалась повышенная смертность у пациентов, принимавших фуросемид и рисперидон (7,3%, средний возраст 89 лет, диапазон 75–97 лет) по сравнению с группой, принимавшей только рисперидон (4,1%, средний возраст 84 года, диапазон 70–96 лет) и группой, принимавшей только фуросемид (3,1%, средний возраст 80 лет, диапазон 67–90 лет). У пациентов, принимавших фуросемид и рисперидон, в 2 из 4 клинических исследований наблюдалось увеличение количества смертельных исходов.

Не установлено патофизиологических механизмов, объясняющих данное наблюдение. Тем не менее, следует соблюдать особую осторожность при назначении препарата в таких случаях. Не обнаружено увеличения смертности у пациентов, одновременно принимающих другие диуретики вместе с рисперидоном. Независимо от лечения, обезвоживание является общим фактором риска смертности и должно тщательно контролироваться у пожилых пациентов с деменцией.

Побочные эффекты со стороны цереброваскулярной системы

В плацебо-контролируемых исследованиях у пожилых пациентов с деменцией наблюдалось увеличение количества побочных эффектов со стороны цереброваскулярной системы (острые и преходящие нарушения мозгового кровообращения), в том числе смертельные случаи у пациентов (средний возраст 85 лет, диапазон 73–97 лет) при применении рисперидона по сравнению с плацебо.

Поздняя дискинезия/экстрапирамидные симптомы

Препараты, обладающие свойствами антагонистов дофаминовых рецепторов, могут вызывать позднюю дискинезию, которая характеризуется ритмическими непроизвольными движениями, преимущественно языка и/или лица. В случае возникновения объективных и субъективных симптомов поздней дискинезии необходимо отменить Рисполепт Конста®, а также другие антипсихотические препараты (если они применялись).

Злокачественный нейролептический синдром

Известно, что классические нейролептики могут вызывать злокачественный нейролептический синдром, который характеризуется гипертермией, ригидностью мышц, нестабильностью вегетативной нервной системы, угнетением сознания и повышением концентраций креатинфосфокиназы (КФК) в сыворотке. В случае возникновения этого синдрома необходимо отменить все антипсихотические препараты, включая рисперидон. Следует также учитывать, что после последней инъекции препарата Рисполепт Конста® рисперидон присутствует в плазме до (минимум) 6 недель.

Гипергликемия и сахарный диабет

При лечении препаратом Рисполепт Конста® наблюдались гипергликемия, сахарный диабет или обострение уже имеющегося сахарного диабета. Установление взаимосвязи между применением атипичных антипсихотических препаратов и нарушениями обмена глюкозы осложнено повышенным риском развития сахарного диабета у пациентов с шизофренией и распространенностью сахарного диабета в общей популяции. Учитывая эти факторы, взаимосвязь между применением атипичных антипсихотических препаратов и развитием побочных действий, связанных с гипергликемией, установлена не полностью. У всех пациентов необходимо проводить клинический контроль на наличие симптомов гипергликемии и сахарного диабета.

Увеличение массы тела

При лечении препаратом Рисполепт® наблюдалось значительное увеличение массы тела. Необходимо проводить контроль массы тела пациентов при терапии препаратом Рисполепт®.

Интервал QT.

Как и для других антипсихотических средств, следует соблюдать осторожность при назначении Рисполепт Конста® пациентам с аритмиями в анамнезе, пациентам с врожденным удлинением интервала QT и при совместном применении с препаратами, увеличивающими интервал QT.

Необходимо соблюдать осторожность во избежание случайного введения препарата Рисполепт Конста® в кровеносный сосуд.

Нельзя подвергать препарат воздействию температур выше 25 °C.

При отсутствии холодильника препарат Рисполепт Конста® перед использованием можно хранить при температуре не выше 25 °C не более 7 дней.

После приготовления суспензии: суспензия физически и химически стабильна в течение 24 ч при температуре 25 °C. С микробиологической точки зрения, суспензию желательно использовать сразу же после приготовления. Если суспензию не используют сразу после приготовления, то ее можно хранить не более 6 ч при температуре 25 °C.

Рисперидон может снижать скорость психических и физических реакций, и поэтому пациентам следует рекомендовать воздерживаться от вождения автомобиля и работы с механизмами.

Несовместимые сочетания

Рисполепт Конста® нельзя смешивать или разводить никакими другими лекарствами и жидкостями помимо специального растворителя, содержащегося в упаковке.

Срок годности

3 года.

Не использовать после истечения срока годности.

Условия хранения

Хранить при температуре от 2 до 8 °C в защищенном от света месте.

Не подвергать воздействию температур выше 25 °C.

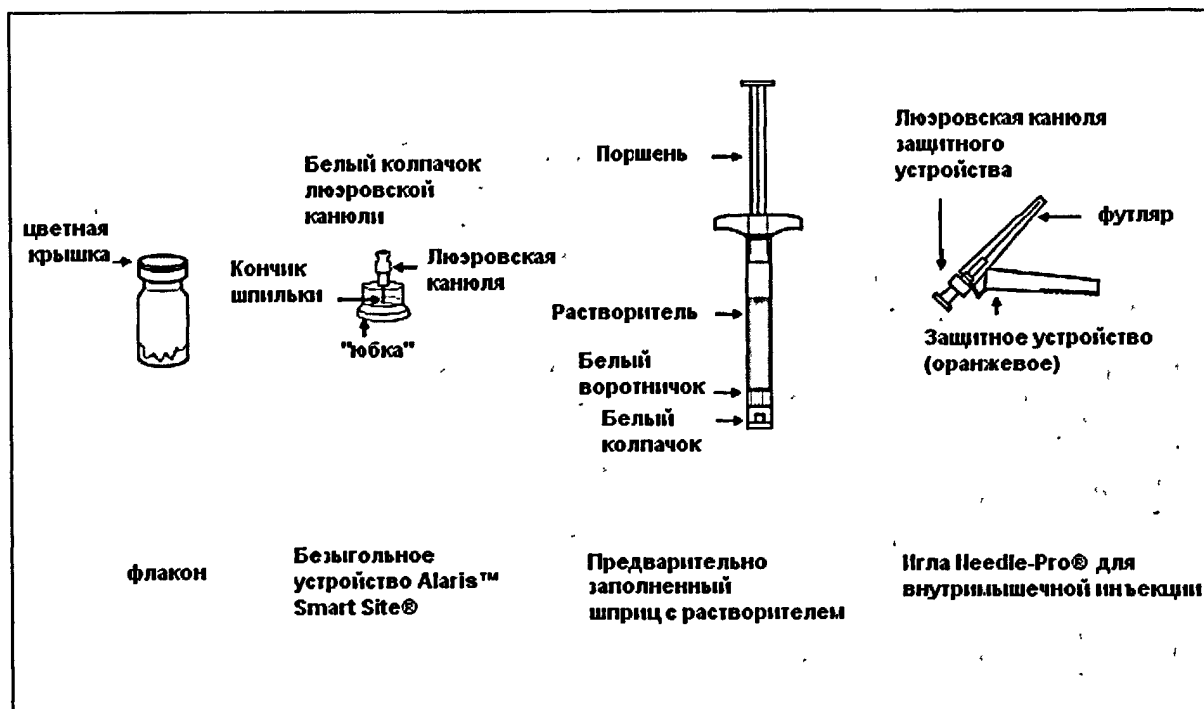
При отсутствии холодильника препарат перед использованием можно хранить при температуре не выше 25 °С не более 7 дней.
Хранить в недоступном для детей месте.

Форма выпуска

Порошок для приготовления суспензии для внутримышечного введения пролонгированного действия 25 мг, 37,5 мг, 50 мг

В комплект поставки входит:

- Один флакон с порошком, содержащим микрогранулы пролонгированного высвобождения Рисполепт Конста® по 25, 37,5 или 50 мг рисперидона
- Один предварительно заполненный шприц с растворителем 2 мл
- 1 безыгольное устройство Alaris™ Smart Site® для приготовления суспензии
- Одна безопасная игла Needle-Pro® (с защитным устройством) для внутримышечной инъекции



Цвет пробки отличается в зависимости от дозировки препарата: для 25 мг – розовый, для 37,5 мг – зеленый, для 50 мг – голубой.

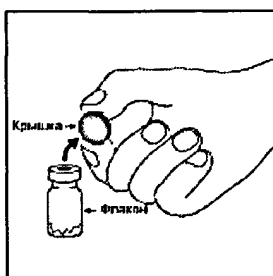
Компоненты упаковывают в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной, покрытую прозрачной пленкой полиэтиленовой. Одну контурную упаковку вместе с инструкцией по применению помещают в картонную пачку.

Указания по применению

Для приготовления суспензии из находящихся во флаконе микрогранул Рисполепт Конста® пролонгированного действия можно использовать только растворитель, находящийся в предварительно заполненном шприце. Готовую суспензию вводят внутримышечно только безопасной иглой Needle-Pro®. Нельзя заменять находящиеся в упаковке компоненты какими-либо другими изделиями. Для обеспечения применения полной дозы рисперидона должно быть введено все содержимое флакона.

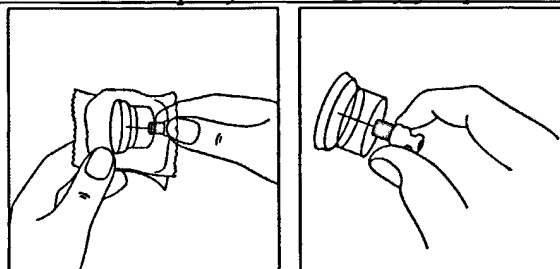
Извлеките упаковку Рисполепт Конста® из холодильника и дайте ей нагреться до комнатной температуры перед приготовлением суспензии.

1. Снимите цветную пластиковую крышку с флакона.

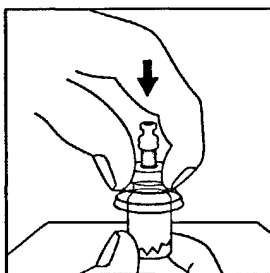


2. Вскройте blisterную упаковку и извлеките безыгольное устройство Alaris™ Smart Site®, придерживая его за белый колпачок.

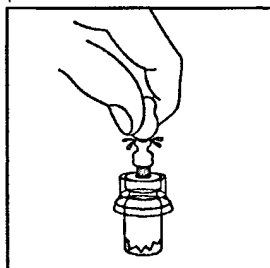
Ни в коем случае нельзя прикасаться к острому наконечнику устройства.



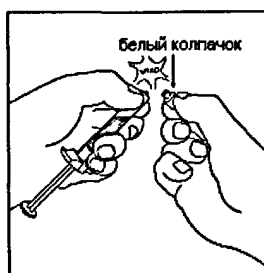
3. Поставьте флакон на твердую поверхность. Движением сверху вниз проткните кончик шпильки безыгольного устройства к центру каучуковой пробки флакона до прочной фиксации устройства на крышке флакона.



4. Протрите место крепления устройства со шприцем (голубой круг) подходящим антисептиком перед его соединением со шприцем.



5. Шприц имеет белый наконечник, состоящий из двух частей: белого воротничка и глянцевого белого колпачка. Для того, чтобы вскрыть шприц, держите шприц за белый воротничок и отломите глянцевый белый колпачок (**БЕЛЫЙ КОЛПАЧОК НЕЛЬЗЯ ОТКРУЧИВАТЬ**). Снимите белый колпачок вместе с находящимся внутри него каучуковым наконечником.

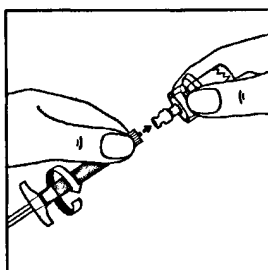


Во время всех стадий сборки держите шприц только за белый воротничок, расположенный на наконечнике шприца. Будьте аккуратны и не перетягивайте компоненты при сборке, т.к. при этом части шприца могут оторваться от него.

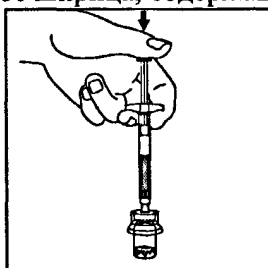
6. Придерживая шприц за белый воротничок, вставьте шприц в голубой круг устройства, нажмите и поверните по часовой стрелке, с тем чтобы он прочно соединился с устройством (необходимо избегать перекручивания).

Для предотвращения вращения устройства во время соединения со шприцем прочно удерживайте «юбку».

Шприц и устройство должны находиться на одной линии.

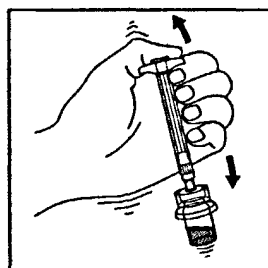


7. Введите во флакон все содержимое шприца, содержащего растворитель.



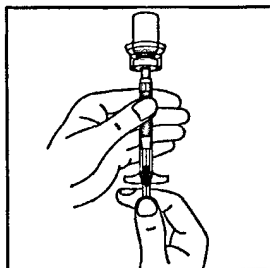
8. Придерживая поршень шприца большим пальцем, энергично встряхивайте содержимое флакона не менее 10 секунд до образования однородной суспензии.

После правильного перемешивания суспензия становится однородной, густой, молочного цвета. Микрогранулы могут быть видны в жидкости, но не должно оставаться сухих микрогранул.

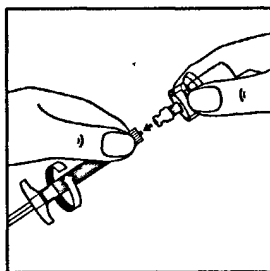


9. НЕ ХРАНИТЕ ФЛАКОН ПОСЛЕ ПРИГОТОВЛЕНИЯ СУСПЕНЗИИ, ПОСКОЛЬКУ СУСПЕНЗИЯ МОЖЕТ РАССЛОИТЬСЯ.

10. Переверните флакон дном вверх и медленно втяните в шприц все содержимое флакона. Отделите часть этикетки от флакона по линии перфорации и приклейте ее к шприцу (для идентификации).

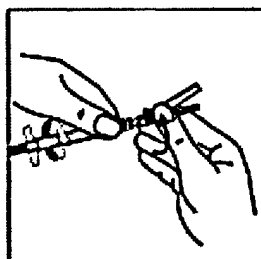


11. Придерживая шприц за белый воротничок, отвинтите шприц из устройства. Выбросьте флакон и безыгльное устройство.

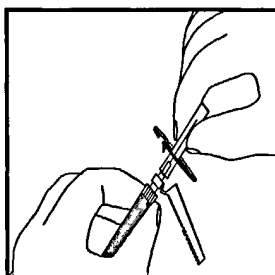


12. Вскройте блистерную упаковку иглы Needle-Pro®. Нельзя дотрагиваться до части иглы, присоединяющейся к шприцу. Извлеките иглу из упаковки, держа ее за прозрачный футляр.

13. Придерживая шприц за белый воротничок, присоедините люэровскую канюлю оранжевого защитного устройства иглы Needle-Pro® к шприцу легким поворотом по часовой стрелке.

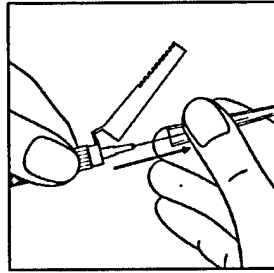


14. Продолжая придерживать шприц за белый воротничок, зажмите прозрачный футляр иглы и плотно закрепите иглу в защитном устройстве Needle-Pro® путем нажатия и поворота по часовой стрелке.



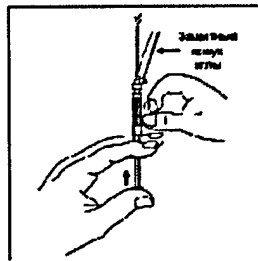
15. НЕПОСРЕДСТВЕННО ПЕРЕД ВВЕДЕНИЕМ ПРЕПАРАТ РИСПОЛЕНТ КОНСТА® НЕОБХОДИМО РЕСУСПЕНДИРОВАТЬ, ПОСКОЛЬКУ ПОСЛЕ ПРИГОТОВЛЕНИЯ СУСПЕНЗИИ ВО ФЛАКОНЕ ЧАСТЬ МИКРОГРАНУЛ МОЖЕТ ОСЕСТЬ. ДЛЯ РЕСУСПЕНДИРОВАНИЯ МИКРОГРАНУЛ ЭНЕРГИЧНО ВСТРЯХИВАЙТЕ ШПРИЦ.

16. Придерживая шприц за белый воротничок, снимите прозрачный футляр с иглы. НЕ СГИБАЙТЕ футляр, т.к. при этом соединение люэровского наконечника может быть нарушено.



17. Слегка постучите пальцем по шприцу, чтобы находящиеся в нем пузырьки воздуха поднялись вверх. Удаляют из шприца и иглы пузырьки воздуха, держа шприц так, чтобы игла была направлена вертикально вверх, и слегка продвигая поршень вверх. Введите все содержимое шприца в верхний наружный квадрант ягодичной области.

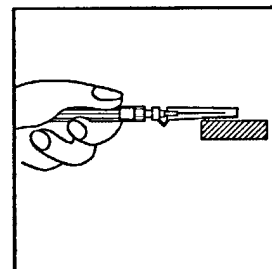
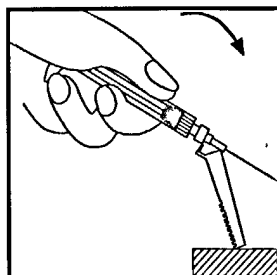
СУСПЕНЗИЮ НЕЛЬЗЯ ВВОДИТЬ ВНУТРИВЕННО!



Предостережение: во избежание травмирования медицинского персонала загрязненной иглой нельзя:

- Дотрагиваться руками до иглы при прижимании устройства Needle-Pro® к игле.
- Разбирать устройство Needle-Pro®
- Пытаться выпрямить иглу Needle-Pro®, если она погнулась.
- Небрежно обращаться с устройством Needle-Pro®, вследствие чего кончик иглы может торчать из футляра.

18. После выполнения инъекции введите иглу в оранжевое устройство Needle-Pro® с помощью одной руки. Для этого аккуратно прижмите защитный кожух оранжевого устройства Needle-Pro® к столу или любой другой плоской поверхности. КАК ТОЛЬКО ОРАНЖЕВОЕ УСТРОЙСТВО NEEDLE-PRO® ПРИЖАТО, ИГЛА ДОЛЖНА ПЛОТНО ВОЙТИ В ОРАНЖЕВОЕ УСТРОЙСТВО NEEDLE-PRO®. Перед тем, как выбросить иглу, визуально убедитесь в том, что игла плотно закреплена в оранжевом устройстве Needle-Pro®. Выбросьте иглу.



Условия отпуска из аптек
По рецепту

Изготовитель

Изготовитель лекарственной формы и первичная упаковка (порошок):

Алкermес Инк., 265, Олингер Серкл, Уилмингтон, Огайо, 45177, США

Изготовитель лекарственной формы и первичная упаковка (растворитель):

Веттер Фарма-Фертигунг ГмбХ и Ко. КГ, Шутценштрассе 87, 88193 Равенсбург, Германия
или

Веттер Фарма-Фертигунг ГмбХ и Ко. КГ, Эйзенбахнштрассе 2-4, 88085 Лангенарген, Германия
или

Силаг АГ, Хохштрассе 201, Шаффхаузен, Швейцария

Вторичная упаковка и выпускающий контроль:

Силаг АГ, Хохштрассе 201, Шаффхаузен, Швейцария

Держатель регистрационного удостоверения, организация, принимающая претензии:

ООО «Джонсон & Джонсон», Россия, 121614, Москва, ул. Крылатская, 17/2

Контактные телефоны:

Тел.: (495) 755-83-57

Факс: (495) 755-83-58

Представитель фирмы

ООО «Джонсон & Джонсон», Россия

Специалист по регистрации



Л.В. Кузнецова