

РЕСПОНГИЛ

ИНСТРУКЦИЯ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ

«ОДОБРЕНО»
Министерство здравоохранения
Республики Узбекистан
Государственное унитарное предприятие
«Государственный центр экспертизы и
стандартизации лекарственных средств,
изделий медицинского назначения
и медицинской техники»
№3 от 7.02.2018 г.

Торговое название препарата: Респонгил.

Международное непатентованное название: Рисперидон.

Лекарственная форма: таблетки покрытые пленочной оболочкой.

Состав:

Респонгил 2 мг: одна таблетка покрытая пленочной оболочкой содержит:

активное вещество: рисперидон 2 мг

вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая, крошкармеллоза натрия, кремния диоксид коллоидный безводный, магния стеарат, опадрай белый, краситель желтый «Солнечный закат» 85 Е 110.

Респонгил 4 мг: одна таблетка покрытая пленочной оболочкой содержит:

активное вещество: рисперидон 4 мг

вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая, крошкармеллоза натрия, кремния диоксид коллоидный безводный, магния стеарат, опадрай зеленый.

Фармакотерапевтическая группа: антипсихотическое (нейролептическое) средство.

Код АТХ: N05AX08.

Фармакологическое действие

Фармакодинамика:

Антипсихотическое средство (нейролептик), производное бензизоксазола. Оказывает также седативное, противорвотное и гипотермическое действие. Селективный моноаминергический антагонист, обладает высокой тропностью к серотонинергическим 5-HT₂ и дофаминергическим D₂-рецепторам. Связывается также с альфа1-адренорецепторами при несколько меньшей аффинности с N1-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.

Поддавляет продуктивную симптоматику (бред, галлюцинации, агрессивность), автоматизм. Вызывает меньшее подавление моторной активности и в меньшей степени индуцирует каталепсию, чем классические антипсихотические лекарственные средства (нейролептики). Сбалансированный центральный антагонизм к серотонину и допамину может уменьшать склонность к экстрапирамидным побочным действиям и расширять терапевтическое воздействие препарата с охватом негативных и аффективных симптомов шизофрении. Может индуцировать зависящее от дозы увеличение концентрации пролактина в плазме.

Фармакокинетика:

После приема внутрь рисперидон полностью абсорбируется из ЖКТ. C_{max} в плазме достигается через 1-2 ч. Пища не оказывает влияния на абсорбцию препарата, поэтому Респонгил можно назначать независимо от приема пищи. Рисперидон быстро распределяется в организме. V_d составляет 1-2 л/кг. В плазме рисперидон связывается с альбумином и альфа₂-гликопротеином. Рисперидон на 88% связывается с белками плазмы, 9-гидроксирисперидон - на 77%. C_{ss} рисперидона в организме у большинства пациентов достигается в течение 1 дня. C_{ss} 9-гидроксирисперидона достигается в течение 4-5 дней. Концентрации рисперидона в плазме пропорциональны дозе препарата (в пределах терапевтических доз).

Рисперидон метаболизируется в печени при участии изофермента CYP2D6 с образованием 9-гидроксирисперидона, который обладает аналогичным рисперидону фармакологическим действием. Рисперидон и 9-гидроксирисперидон составляют активную антипсихотическую фракцию. Другим путем метаболизма рисперидона является N-деалкилирование.

После приема внутрь у больных с психозом T_{1/2} рисперидона из плазмы составляет около 3-4 ч. T_{1/2} 9-гидроксирисперидона и активной антипсихотической фракции составляет 24 ч. Через неделю приема препарата 70% дозы выводится с мочой, 14% - с калом. В моче рисперидон плюс 9-гидроксирисперидон составляют 35-45% дозы. Остальное количество составляют неактивные метаболиты.

Фармакокинетика в особых клинических случаях:

У пациентов пожилого возраста и у больных с почечной недостаточностью после однократного приема препарата внутрь наблюдались более высокие концентрации в плазме и замедленное выведение рисперидона. У пациентов с печеночной недостаточностью концентрация рисперидона в плазме не изменялась.

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

- гиперчувствительность к компонентам препарата;
- период лактации;
- детский возраст (до 15 лет) - эффективность и безопасность не установлены.

С осторожностью применяется при опухолях мозга, кишечной непроходимости, передозировке лекарственными средствами, синдроме Реле (противорвотный эффект рисперидона может маскировать симптомы этих состояний), заболеваниях сердечнососудистой системы (хроническая сердечная недостаточность, атриовентрикулярная блокада, инфаркт миокарда), обезвоживании, нарушениях мозгового кровообращения, гиповолемии, болезни Паркинсона, судорогах (в т.ч. в анамнезе), злоупотреблении лекарственными средствами, лекарственной зависимости, почечной недостаточности тяжелой степени, печеночной недостаточности тяжелой степени, состояниях, предрасполагающих к развитию тахикардии типа «пируэт» (брадикардия, нарушение электролитного баланса, сопутствующий прием лекарственных средств, удлиняющих интервал QT), берменности.

Способ применения и дозы

Применяется внутрь. Взрослым и детям старше 15 лет назначается 1 или 2 раза в сутки.

Шизофрения. Начальная доза составляет 2 мг/сут. На 2 день - до 4 мг/сут. С этого момента при необходимости дозу можно либо сохранить на прежнем уровне, либо индивидуально скорректировать в диапазоне - 4-6 мг/сут.

Дозы выше 10 мг/сут не показали более высокой эффективности по сравнению с меньшими дозами и могут вызвать появление экстрапирамидных симптомов. Максимальная суточная доза составляет 16 мг.

Поведенческие расстройства у больных с деменцией: Оптимальная доза - 1 мг 1 раз в день.

Биполярные расстройства при маниах: начальная доза - 2 мг/сут на 1 прием. Увеличение дозы (на 2 мг/сут) - не чаще чем через день. Оптимальная доза - 2-6 мг/сут.

Поведенческие расстройства у пациентов с задержкой умственного развития или с доминированием в клинической картине деструктивных тенденций. Пациенты с массой тела 50 кг и более. Оптимальная доза - 1 мг/сут.

Рекомендуется в 2 раза уменьшить как начальную дозу, так и последующие увеличения дозы у пожилых пациентов и у больных почечной или печеночной недостаточностью (при необходимости использовать адекватную лекарственную форму).

Побочное действие

Со стороны центральной нервной системы: бессонница, agitation, тревожность, головная боль, сонливость, повышенная утомляемость, головокружение, снижение способности к концентрации внимания, нечеткость зрения, экстрапирамидные симптомы (тремор, ригидность, гиперсаливация, брадикардия, акатизия, острая дистония), мания или гипомания, инсульт (у пожилых больных с предрасполагающими факторами). У больных шизофренией - гиперволемия (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 автономных функций, нарушение сознания и повышение активности креатинфосфокиназы), нарушения терморегуляции, эпилептические припадки.

Со стороны пищеварительной системы: запоры, диспепсия, тошнота или рвота, боль в животе, повышение активности «печеночных» трансаминаз, сухость во рту, гипосаливация или гиперсаливация, анорексия.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: ортостатическая гипотензия, рефлекторная тахикардия или повышение артериального давления (АД).

Со стороны органов кровообращения: нейтропения, тромбоцитопения.

Со стороны эндокринной системы: галакторея, гинекомастия, нарушения менструального цикла, amenoreya, повышение или снижение массы тела, гипергликемия или обострение ранее существовавшего сахарного диабета.

Со стороны мочеполовой системы: приапизм, нарушения эрекции, нарушения эякуляции, нарушения оргазма, в том числе аноргазмия, недержание мочи.

Аллергические реакции: зуд, сыпь, ангионевротический отек.

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

Прочие: артралгия, ринит.

Передозировка

Симптомы: сонливость, седация, тахикардия, снижение АД, экстрапирамидные расстройства, редко - удлинение интервала QT.

Лечение: обеспечить свободную проходимость дыхательных путей для обеспечения адекватного снабжения кислородом и вентиляции, промывание желудка (после интубации, если больной без сознания) и прием активированного угля вместе со слабительным. Немедленно начать мониторинг ЭКГ для выявления возможных аритмий. Специфического антидота нет. Необходимо проводить симптоматическую терапию, направленную на поддержание жизненно важных функций организма. При снижении АД и сосудистом коллапсе - внутривенно вводить инфузионные растворы и/или адреностимуляторы. В случае развития острых экстрапирамидных симптомов - антихолинергические лекарственные средства. Постоянное медицинское наблюдение и мониторингрование следует продолжать до исчезновения симптомов интоксикации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Рисперидон уменьшает эффективность леводопы и агонистов дофамин-Фенотиазины, трициклические антидепрессанты и бета-адреноблокаторы повышают концентрацию рисперидона в плазме (не влияют на концентрацию активной антипсихотической фракции).

При одновременном приеме карбамазепина и других индукторов микросомальных ферментов отмечается снижение концентрации активной антипсихотической фракции рисперидона в плазме. Клозапин снижает клиренс рисперидона.

При одновременном применении с рисперидоном этанол, лекарственные средства, угнетающие центральную нервную систему (ЦНС), приводят к аддитивному угнетению функции ЦНС.

Гипотензивные лекарственные средства усиливают выраженность снижения АД на фоне применения рисперидона.

Флуоксетин может повышать концентрацию рисперидона в плазме (в меньшей степени - его активной антипсихотической фракции).

Особые указания

При шизофрении, в начале лечения Респонгилом, рекомендуется постепенно отменить предыдущую терапию, если это клинически оправдано. Если пациенты переводятся с терапии депо-формами антипсихотических лекарственных средств, то прием рекомендуется начинать вместо следующей запланированной инъекции. Периодически следует оценивать необходимость продолжения текущей терапии противопаркинсоническими лекарственными средствами.

Риск развития мании или гипомании может быть существенно снижен при использовании низких доз Респонгила или при их постепенном увеличении. При возникновении ортостатической гипотензии, особенно в начальном периоде подбора дозы, следует рассмотреть вопрос о снижении дозы. У пациентов с заболеваниями сердечно-сосудистой системы, а также при обезвоживании, гиповолемии или цереброваскулярных нарушениях дозу Респонгила следует увеличивать постепенно. Если возникают признаки и симптомы поздней дискинезии, следует рассмотреть вопрос об отмене всех антипсихотических лекарственных средств. При злокачественном нейролептическом синдроме - необходимо отменить все антипсихотические лекарственные средства, включая Респонгил.

При отмене карбамазепина и других индукторов микросомальных ферментов доза Респонгила должна быть снижена.

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

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при вождении транспортных средств и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Респонгил 2 мг или 4 мг: 10 таблеток покрытых плёночной оболочкой в контурной ячейковой упаковке. По 2 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по медицинскому применению в картонной коробке.

Условия хранения

Хранить в сухом и защищенном от света месте при температуре не выше 25°C. Хранить в недоступном для детей месте!

Срок годности

Не использовать по истечении срока годности.

Условия отпуска

По рецепту врача.

Владелец торговой марки и
регистрационного удостоверения:
SPEY MEDICAL Ltd.,
Лондон, Великобритания.

Производитель:

РЕПЛЕК ФАРМ Лтд, Скопье
Скопье, Республика Македония.

Наименование и адрес организации, принимающей претензии (предложения) по качеству лекарственных средств на территории Республики Узбекистан

ООО «Ameliya Pharm Service» un. Ойбек 36, БЛ "East line", 100015, Ташкент.
тел: +998 71 15050581, 1505082