

ТИББИЁТДА ҚЎЛЛАНИЛИШИГА ДОИР ЙЎРИҚНОМА

Препаратнинг савдо номи: Респонгил.

Халқаро патентланмаган номи: Рисперидон.

Дори шакли: плёнка қобик билан қўлланган таблеткалар.

Таркиби:

Респонгил 2 мг: плёнка қобик билан қўлланган бир таблетка қуйидагиларни сақлайди:

фаол модда: 2 мг рисперидон

ёрдамчи моддалар: лактоза моногидрати, микрокристалл целлюлоза, натрий кроскармеллоза, сувсиз коллоид кремний диоксиди, магний стеарати, оқ опадрий, сарик «Күёш шафақи» бўёғисини 85 Е 110.

Респонгил 4 мг: плёнка қобик билан қўлланган бир таблетка қуйидагиларни сақлайди:

фаол модда: 4 мг рисперидон

ёрдамчи моддалар: лактоза моногидрати, микрокристалл целлюлоза, натрий кроскармеллоза, сувсиз коллоид кремний диоксиди, магний стеарати, яшил опадрий.

Фармакотерапевтик гуруҳи: антипсихотик (нейролептик) восита.

АТХ коди: N05AX08.

Фармакологик хусусиятлари**Фармакодинамикаси:**

Антипсихотик восита (нейролептик), бензизоксазол ҳосиласи. Шунингдек седатив, қусишга қарши ва гипотетмик таъсир кўрсатади. Селектив моноаминергик антагонисти серотонергик 5-HT₂ ва дофаминергик D₂-рецепторларга нисбатан юқори озқувчанликка эга. Шунингдек 11-гистаминергик ва альфа2-адренергик рецепторлари билан бир неча камроқ аффилиқда альфа1-адренорецепторлар билан боғланади. Холинорецепторларга нисбатан озқувчанликка эга эмас. Антипсихотик таъсири мезолимбик ва мезокортикал тизимларнинг дофамин D₂-рецепторларини блокадеси билан боғлиқ. Седатив таъсири бош мия устунинг ретикуляр формацияси адренорецепторларини блокаи билан боғлиқ; қусишга қарши таъсири – қусиш маркази триггер зонасининг дофамин D₂-рецепторларини блокаи билан боғлиқ; гипотетмик таъсири – гипоталамуснинг дофамин рецепторларини блокаи билан боғлиқ. Продуктив симптоматика (босинқираш, галлюцинациялар, жиззакчилик), автономияни бостиради. Камроқ даражада мотор фаоллигини бостиргани чакиради ва камроқ даражада классик антипсихотик дори воситалари (нейролептиклар) га қараганда каталесияни усайтиради. Серотонин ва дофаминга нисбатан мувозанатланган марказий антагонизми экстрапирамид ноқуш таъсирларга нисбатан мойиллигини камайтириши ва шизофрениянинг негатив ва аффектив симптомлари қамраб препаратнинг терапевтик таъсирини кенгайтириши мумкин.

Плазмадаги пролактиннинг концентрациясини ошиши препаратнинг дозасига боғлиқлики камайтириши мумкин.

Фармакокинетикаси:

Рисперидон ичга қабул қилингандан кейин меъда-ичак йўлларидан (МИЙ) тўлиқ сўрилади. Плазмадаги C_{max} максимал концентрациясига 1-2 соатдан кейин эришилади. Овқатланмиш препаратнинг сўрилишига таъсир кўрсатмайди, шунинг учун Респонгилни овқат истеъмо қилишдан қатъий назар буюриш мумкин.

Рисперидон организмда тез тақсимланади. V_d 1-2 л/кг ни ташкил қилади. Плазмада рисперидон альбумин ва альфа₂-гликопротеин билан боғланади. Рисперидон плазма оқсиллари билан 88% га, 9-гидроксис-рисперидон – 77% га боғланади. Рисперидоннинг C_{ss} кўпчилиқ пациентларнинг организмда 1 кун давомида эришилади. 9-гидроксис-рисперидоннинг C_{ss} 4-5 кун давомида эришилади. Рисперидоннинг плазмадаги концентрацияси препаратнинг дозаси билан (терапевтик доза чегарасида) пропорционалдир.

Рисперидон жигарда CYP2D6 иштирокида рисперидоннинг фармакологик таъсирига эга бўлган 9-гидроксисрисперидонни ҳосил қилиб метабализмга учрайди. Рисперидон ва 9-гидроксисрисперидон фаол антипсихотик фракциясини ташкил этади. Рисперидон метабализмининг бошқа йўли бўлиб N-дезалкилланни ҳисобланади.

Психози бўлган беморлар препаратни ичга қабул қилгандан кейин рисперидоннинг плазмадаги C_{ss} тахминан 3 соатни ташкил қилади. 9-гидроксисрисперидон ва фаол антипсихотик фракциясининг T_{1/2} 24 соатни ташкил этади. Бир ҳафтадан кейин қабул қилинган препаратнинг 70% сийдик билан, 14% ахлат билан чиқарилади. Сийдикда рисперидон ва 9-гидроксис-рисперидон 35-45% ни ташкил қилади. Қолган миқдори нофаол метаболитларини ташкил қилади.

Алоҳида клиник ҳолатлардаги фармакокинетикаси:

Кекса ёшдаги пациентлар ва буйрак етishмовчилиги бўлган беморларда препарат ичга бир маротаба қабул қилингандан кейин плазмада рисперидоннинг янада юқори концентрацияси ва чиқарилишини секинлаштири кузатилади. Жигар етishмовчилиги бўлган пациентларда рисперидоннинг плазмадаги концентрацияси узгармаган.

Қўлланилиши

- шизофрения (ўткир ва сурункали) ва продуктив ва/ёки негатив симптоматика билан бўлган бошқа психотик ҳолатлар;
- турпи хил рухий касалликларда аффектив бузилишлар;
- жиззакчилик симптомлари (қаттиқ габзланиш, жисмоний зўрлаш) пайдо бўлганда, рухий фаоллиғини бузилишлари (қўзғалиш, босинқираш) ёки психотик симптомлар бўлганда деменцияси бўлган пациентларда ҳулқ-атворини бузилишлари;
- биполяр бузилишларда маниания даволашда ёрдамчи даволаш сифатида;
- интеллектуал даражаси пасайган ёки ақлий ривожланишдан орқада қолган катта ёшдаги пациентлард ва 15 ёшдаги ўсимларда, агар деструктив ҳулқ-атвор (тажовускорлик, импульсивлик, аутоагрессия) касаллигининг клиник манзарасида асосий ҳисобланган ҳолатларда ҳулқ-атвор бузилишларини ёрдамчи даволаш сифатида қўлланади.

Қўллаш мумкин бўлмаган ҳолатлар

- Препаратнинг компонентларига ўта юқори сезувчанлик;
 - Лактация даври;
 - Болалик ёши (15 ёшгача) –самарадорлиги ва ҳавфсизлиги аниқланмаган.
- Бош мия ўсмаси, ичак тутулиши, дори воситаларини дозаси ошириб юборилиши, Рейе синдроми (рисперидоннинг қусишга қарши самараси ўшуб ҳолатларинг симптомларини ниқобланиш мумкин), юрак-қон томир тизими касалликлари (сурункали юрак етishмовчилиги, атриовентрикуляр блокада, миокард инфаркти), сувсизланиш, бош мия қон айланishi бузилиши, гиповолемия, Паркинсон касаллиги, тиришчилар (шу жумладан ананемизда), дори воситаларини суициетмоқ қилиш, дорига қарамалик, оқид даражадаги буйрак етishмовчилиги, оқид даражадаги жигар етishмовчилиги, "тирош" туридаги тахикардияни ривожланишига мойиллик ҳолатлари (брадикардия, электролит мувозанатини бузилиши, QT интервал узайтирувчи дори воситаларини ёндosh қабул қилиш), ҳомилдорликда препарат эҳтиёткорлик билан қўлланилади.

Қўллаш усули ва дозалари

Ичга қўлланилади. Катталар ва 15 ёшдан ошган болаларга суткада 1 ёки 2 марта буюрилади. Шизофренияда. Бошланғич доза суткада 2 мг ни ташкил қилади. 2-кунда – суткада 4 мг гача қабул қилинади. Шу вақтдан бошлаб зарурати бўлганда дозанинг олдинги даражаси сақлаб туриш ёки индивидуал равишда суткада 4-6 мг диапазонда мувофиқлаштириш мумкин. Препаратнинг суткада 10 мг дан юқори дозаси кичик дозаси билан солиштирилганда янада юқори самарадорлиқни кўрсатмаган ҳамда экстрапирамид симптомларни юзага чиқишини чакориши мумкин. Максимал суткалик доза 16 мг ни ташкил этади. Деменцияси бўлган пациентларда ҳулқ-атворини бузилишлари: Оптимал дозаси – кунига 1 мг дан 1 марта. Маниярларда биполяр бузилишлар: бошланғич дозаси – суткада 2 мг 1 қабулда. Дозани ошириш (суткада 2 мг га) – кунорага нисбатан тез-тез эмас. Оптимал дозаси – суткада 2-6 мг 1 марта. Ақлий ривожланиши тўхтаган ёки клиник манзарасида деструктив тенденция

доминирланган пациентларда ҳулқ-атвори бузилишлари. Тана вазни 50 кг ва ундан ортiқ бўлган пациентлар. Оптимал доза – суткада 1 мг. Кекса ёшдаги пациентлар ва буйрак ёки жигар етishмовчилиги бўлган беморларда бошланғич дозасини 2 марта камайтириш каби кейинги дозаларини ошириш тавсия этилади (зарурати бўлганда адекват дори шакли ишлатиш керак).

Ножўтаъсирлари

Марказий нерв тизими томонидан: уйқусизлик, ажитация, хавотирлик, бош оғриғи, уйқучанлик, юқори чарчоқлик, бош айланиши, диққатни жамлаш қобилиятини пасайиши, кўришни ноаниқлиғи, экстрапирамид симптомлар (тремор, ригидлик, гиперсаливация, брадикинезия, акатизия, ўткир дистония), маниа ёки гипомания, инсулът (мойил оммилари бўлган кекса беморларда). Шизофренияси бўлган беморларда - гиперволемия (полидисидия ёки антидиуретик гормоннинг ноадекват секретцияси туфайли), кечки диокнезия (ихтиёрсиз ритмик ҳаракатлар, асосан таъ ва/ёки юзنى), хавфли нейролептик синдром (гипертермия, мушак ригидлиги, бекорор автоном функциялар, онғни бузилиши ва креатинфосфокиназаанинг фаоллигини ошиши), терморегуляцияни бузилиши, тўтқаноқ хуружлари.

Овқат ҳазм қилиш тизими томонидан: казиятлар, диспепсия, кўнгли айниши ёки қусиш, қоринда оғриқ, "жигар" трансаминазалари фаоллигини ошиши, оғиз қуриши, гипосаливация ёки гиперсаливация, анорексия.

Юрак-қон томир тизими томонидан: ортостатик гипотензия, рефлектор тахикардия ёки артериал босим (АБ) ни ошиши.

Қон яратиш аъзолари томонидан: нейтронения, тромбоцитопения.

Эндокрин тизими томонидан: галакторея, гинекомастия, ҳайз циклини бузилиши, аменорея, тана вазини ошиши ёки камайтиши, гипергликемия ёки аввал мавжуд бўлган қандади диабетни зурайиши.

Сийдик-жусий тизими томонидан: приапизм, эрекцияни бузилиши, эякуляцияни бузилиши, орғазми бузилиши, шу жумладан анорғазмия, сийдикни тутиб туролмаслик.

Аллергик реакциялар: қичиши, тошма, ангионевротик шиш.

Тери қопламлари томонидан: терини қуриши, гиперпигментация, себорея, фотосенсибилизация.

Бошқалар: артралгия, ринит.

Дозани ошириб юборилиши

Симптомлари: уйқучанлик, седация, тахикардия, АБ пасайиши, экстрапирамид бузилишлар, кам ҳолларда - QT интервалини узайиши.

Даволаш: кислородни адекват таъминоти ва вентилляция таъминлаш учун нафас йўлларини эркин ўтказувчанлиғини таъминлаш, меъдани қувиш (агар бемор ҳушсиз бўлса, интубациядан кейин) ва феолаштирилган кўмирни сурғи воситалари билан бирга қабул қилиш лозим. Юзага чиқиши мумкин бўлган аритмияларни аниқлаш учун дарҳол ЭКГ мониторингини бошлаш керак. Махсус антидоти йўқ. Организмининг ҳаётий муҳим функцияларини тутиб туришга қаратилган симптоматик даволашни ўтказиш зарур. АБ пасайганда ва қон томир қолпаси кузатиладган – вена ичига инфузион эритмалар ва/ёки адреностимуляторларни юбориш лозим. Ўткир экстрапирамид симптомлар ривожланган ҳолларда - антихолинергик дори воситалари қўлланилади. Доимий тиббий кузатув ва интоксикациянинг симптомлари йўқолганида мониторингини давом эттириш керак.

Бошқа дори воситалари билан ўзаро таъсири

Рисперидон леводола ва дофамин агонистларининг самарадорлигини камайтиради. Фенотиазинлар, трициклик антидепрессантлар ва бета-адреноблокаторлар рисперидоннинг плазмадаги концентрациясини оширади (фаол антипсихотик фракциясининг концентрациясига таъсир қилмайди). Карбамазепин ва бошқа микросомал ферментларнинг индукторлари бир вақтда қабул қилингандан рисперидоннинг плазмадаги фаол антипсихотик фракциясининг концентрациясини пасайиши кузатилади. Клозапин рисперидоннинг клиренсини камайтиради.

Рисперидонни этанол, марказий нерв тизимини (МНТ) усайтирувчи дори воситалари билан бир вақтда қўлланганда МНТ функциясини аддитив усайишига олиб келади. Гипотензив дори воситалари рисперидонни қўллаш фонида АБ ни аққол пасайишини кучайтиради.

Флуоксетин рисперидоннинг плазмадаги концентрациясини (камроқдаражада – унинг фаол антипсихотик фракциясини) ошириши мумкин.

Махсус кўрсатмалар

Шизофренияда Респонгил билан даволаанишни бошида олдинги даволашни, агар бу клиник тасдиғини топган бўлса, аста-секин бекор қилиш тавсия этилади. Агар пациентлар антипсихотик дори воситаларинг даволашни депозакли билан ўтказилса, у ҳолда кейинги режалаштирилган инъекция билан бирга қабулни бошлаш тавсия этилади. Паркинсонизмга қарши дори воситалари билан жорий даволашнинг давом эттириши зарурлигини вақти-вақти билан баҳолаш керак.

Мания ёки гипоманияни ривожланиш хавфи Респонгилнинг паст дозаси ишлатилганда ёки уларни аста-секин оширилганда сезилари даражада камайган бўлиши мумкин.

Ортостатик гипотензия пайдо бўлганда, айниқса дозани танлаш даврини бошида, дозани камайтириш тўғрисидаги масалани қўриб қилиш керак. Юрак-қон томир тизими касалликлари бўлган пациентларда, шунингдек сувсизланишда, гиповолемия ёки цереброваскуляр бузилишларда Респонгилнинг дозасини аста-секин ошириш керак. Агар дискинезиянинг кечки белгилари ва симптомлари пайдо бўлса, барча антипсихотик дори воситаларини бекор қилиш тўғрисидаги масалани қўриб чиқиш керак. Хавфли нейролептик синдромда - барча антипсихотик дори воситаларини, жумладан Респонгилни бекор қилиш керак.

Карбамазепин ва бошқа микросомал ферментларнинг индукторлари бекор қилингандан Респонгилнинг дозаси камайтирилган бўлиши керак. Пациентларга тана вазини ошиши мумкинлиги туфайли тўйиб овқатланишдан сақланиш тавсия этилиши керак.

Даволаниш даврида транспорт воситаларини ҳайдаш ва диққатни юқори жамлаш ва психомотор реакция тезлигини талаб қилувчи бошқа потенциал хавфли фаолият турлари билан шуғулланишда эҳтиёткорликка риоя қилиш лозим.

Чиқарилиш шакли

Респонгил 2 мг ёки 4 мг: 10 плёнка қобик билан қўлланган таблетка контур уяли урамда. 2 контур уяли урам тиббиётда қўлланилишига доир йўриқномаси билан картон қўтда.

Сақлаш шароити

Қуруқ ва ёруғликдан ҳимояланган жойда, 25°С дан юқори бўлмаган ҳароратда сақлансин. Болалар ололмайдиган жойда сақлансин.

Яроқлилик муддати

Яроқлилик муддати ўтган қўлланилмасин.

Дорихоналардан бериш тартиби

Рецепт бўйича.

Савдо маркаси эгаси

Рўйхатдан ўтказиш гувоҳномаси:

SPEY MEDICAL Ltd.,

Лондон, Великобритания.

Ишлаб чиқарилган

РЕПЛЕК ФАРМ Лтд. Скопье

Скопье, Македония Республикаси.

Ўзбекистон Республикаси ҳудудида дори воситаларининг сифати бўйича эътирозлар (таклифлар) ни қабул қилувчи ташкилот номи ва манзили

"Ameliya Pharm Service" МҲК, ул. Ойбек б/к, БЦ "East line", 100015, Ташкент. тел.: +998 71 15050581, 1505082