

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування препарату

РИСПЕРОН (RISPERON)

Склад:

діюча речовина: рисперидон;

1 таблетка містить рисперидону 2 мг;

допоміжні речовини: лактози моногідрат, крохмаль кукурудзяний, целюлоза мікрокристалічна, гіпромелоза, магнію стеарат, кремнію діоксид колоїдний безводний, натрію лаурилсульфат, покриття для нанесення оболонки Opadry II Yellow та Opadry II White.

Лікарська форма. Таблетки, вкриті плівковою оболонкою.

Фармакотерапевтична група. Антипсихотичні засоби. Код АТС N05A X08.

Клінічні характеристики.

Показання.

Лікування гострого психотичного стану при шизофренії та довготривала підтримуюча терапія при хронічному перебігу шизофренії для запобігання рецидивам.

Монотерапія або комбіноване лікування гострих маніакальних та змішаних епізодів при біполярних розладах.

Протипоказання. Рисперон протипоказаний пацієнтам з встановленою гіперчутливістю до препарату.

Спосіб застосування та дози.

Шизофренія.

Дорослим в більшості випадків препарат призначають у початковій дозі 2 мг на добу в 1 або 2 прийоми, при необхідності дозу збільшують на 1-2 мг за добу. Для більшості пацієнтів рекомендована доза становить 4 – 6 мг на добу.

Доза, що перевищує 10 мг на добу, в більшості випадків не має додаткових переваг ефективності, може призводити до збільшення кількості побічних реакцій, тому рекомендується з обмеженням.

Підтримуюча терапія шизофренії (запобігання рецидивам) потребує застосування 2 – 6 мг Рисперону на добу. Пацієнти на підтримуючій терапії потребують періодичного обстеження, оскільки доза препарату може змінюватися.

Для пацієнтів літнього віку і пацієнтів з вираженими порушеннями функцій печінки та/або нирок початкову та наступні дози препарату зменшують удвічі.

Біполярні розлади.

Рекомендована початкова доза Рисперону становить 2– 3 мг на добу. За необхідності дозу змінюють додаванням 1 мг/добу через день до 6 мг препарату на добу або зменшенням на 1 мг/добу. Ефективність доз, що перевищують 6 мг, при біполярних розладах не вивчалась.

Рекомендації для підбору доз препарату

Показання для застосування	Початкова доза	Доза для титрування	Цільова доза	Діапазон ефективних доз
Шизофренія	2 мг/добу	1-2 мг/добу	4-6 мг/добу	4-16 мг/добу
Біполярні розлади	2-3 мг/добу	1 мг/добу	1-6 мг/добу	1-6 мг/добу

Побічні реакції.

Побічні ефекти, що спостерігаються у зв'язку із застосуванням Рисперону, перелічені нижче.

З боку нервової системи та органів чуття: порушення сну, у т.ч. безсоння або сонливість, підвищена

збудливість, стомлюваність, порушення уваги, неспокій, тривога, головний біль, запаморочення, екстрапірамідні розлади (тремор, ригідність, брадикаїнезія, гіпокінезія, гіперсалівація, акаїзія, гостра дистонія), пізня дискінезія, нейролептичний злоякісний синдром, порушення терморегуляції, судомні напади, інсульт (у схильних пацієнтів літнього віку), сплутаність свідомості, втрата свідомості, летаргія, ортостатичне запаморочення, транзиторна ішемічна атака, цереброваскулярні розлади, дизартрія, розлади рухів, гіперсомнія, манія, паркінсонізм, відсутність реакції на подразник.

Порушення з боку органів зору: порушення зору, нечіткість зору, кон'юнктивіт, очна гіперемія, виділення з очей, закочування очей, набряк повік, припухлість очей, кірка на краю повіки, сухість очей, слезоточивість, фотофобія, глаукома, зниження гостроти зору.

Порушення з боку органів слуху та вестибулярного апарату: дзвін у вухах, біль у вухах, розлади рівноваги.

Ендокринні розлади: гіперпролактинемія, галакторея, гінекомастія, синдром неадекватної секреції антидіуретичного гормону (АДГ), підвищення рівня глюкози крові, гіперглікемія (у хворих на цукровий діабет), діабетична кома.

Кардіальні порушення: ортостатична гіпотензія, рефлексорна тахікардія, артеріальна гіпертензія, відчуття серцебиття, синусова брадикардія, синусова тахікардія, атріовентрикулярна блокада першого ступеня, блокада лівої гілки пучка Гіса, блокада правої гілки пучка Гіса, фібриляція передсердь, подовження інтервалу QT на кардіограмі.

Порушення з боку дихальної системи, органів грудної клітки: закладеність носа, носова кровотеча, фаринголарингічний біль, назофарингіт, тонзиліт, трахеїт, бронхіт, пневмонія, кашель, диспное, свистяче дихання, дисфонія, продуктивний кашель, застійні явища в дихальних шляхах, вологі хрипи, гіпервентиляція, синдром апное у сні, синусит, грипоподібний синдром.

Інфекції та інвазії: інфекції вуха (середній отит, у тому числі хронічний), вірусні інфекції, інфекції ока, інфекції сечовивідних шляхів (у тому числі цистит).

Шлунково-кишкові розлади: анорексія, диспепсія, гіперсалівація, нудота, блювання, сухість у роті, абдомінальний дискомфорт, нетримання калу, гастрит, припухлість губ, хейліт, кишкова непрохідність, панкреатит, жовтуха, біль у животі, запор, підвищення рівня печінкових трансаміназ.

Розлади з боку сечовидільної системи: енурез, дизурія, поліурія, нетримання сечі.

Розлади репродуктивної системи та молочних залоз: збільшення молочних залоз, дисменорея, аменорея, імпотенція, порушення ерекції та еякуляції, аноргазмія, зниження лібідо, пріапізм, сексуальна дисфункція, ретроградна еякуляція, вагінальні виділення.

Зміни з боку шкіри та підшкірної клітковини: целюліт, оніхомікоз, акародерматит, висипи на шкірі (еритематозні, папульозні, макулопапульозні, генералізовані), зміна кольору шкіри, сухість шкіри, лупа, себорейний дерматит, гіперкератоз, свербіж, алопеція, гіперемія.

Порушення з боку системи крові та лімфатичної системи: нейтро- та тромбоцитопенія, тромбоцитопенічна пурпура, анемія, зниження гемоглобіну, зниження гематокриту, гранулоцитопенія, агранулоцитоз, тромбоцитопенія (включаючи зниження кількості тромбоцитів, зниження утворення тромбоцитів).

Порушення з боку імунної системи: ангіоневротичний набряк (термін включає ангіоневротичний набряк, навколоротовий набряк, набряк очей, періорбітальний набряк, набряк обличчя, рота, язика, гортані, гортанно-трахеальний набряк, спадковий ангіоневротичний набряк, окуло-респіраторний синдром, гострий набряк тонкої кишки).

Порушення з боку опорно-рухової системи та сполучної тканини: артралгія, біль в кінцівках, порушення постави, скутість суглобів, міальгія, м'язова слабкість, рабдоміоліз.

Інші: в'ялість, риніт, біль у спині, біль в шиї, збільшення маси тіла, набряки, гіперволемія, полідипсія, зниження температури тіла, спрага, нездужання, дискомфорт, озноб, відчуття холоду в кінцівках, синдром відміни препарату.

Передозування.

У загальному плані ознаки та симптоми передозування, що спостерігались, це відомі фармакологічні ефекти препарату в посиленій формі.

Симптоми.

Сонливість, надмірний седативний ефект, тахікардія; артеріальна гіпотензія, екстрапірамідні порушення; у поодиноких випадках - подовження інтервалу QT.

Лікування.

Рисперон не має специфічного антидоту, тому при передозуванні необхідно проводити симптоматичну та підтримуючу терапію: промивання шлунка (після інтубації, якщо пацієнт непритомний), призначення активованого вугілля разом з проносним засобом, забезпечення прохідності дихальних шляхів, постійний медичний нагляд та моніторинг функції серцево-судинної системи. При артеріальній гіпотензії і судинному колапсі слід проводити внутрішньовенні вливання та/або призначати симпатоміметичні препарати. У разі розвитку гострих екстрапірамідних симптомів слід призначати антихолінергічні препарати. Необхідно продовжувати постійне медичне спостереження і моніторинг до моменту, коли пацієнт одужає.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Вагітність.

Рисперон можна застосовувати при вагітності тільки у тому випадку, коли позитивний ефект виправдовує потенційний ризик для плода.

Годування груддю.

Жінкам, які застосовують Рисперон, не слід годувати груддю.

Діти. Досвід застосування препарату для лікування дітей до 15 років обмежений.

Особливості застосування.

У зв'язку з тим, що Рисперон є α -блокатором, при його застосуванні може виникати ортостатична гіпотензія, особливо на початку лікування у період підбору дози.

Рисперон слід застосовувати з обережністю у пацієнтів із захворюваннями серцево-судинної системи (серцева недостатність, інфаркт міокарда, порушення провідності), а також при зневодненні, гіповолемії та цереброваскулярних порушеннях; при цьому дозу препарату слід збільшувати поступово, згідно з рекомендаціями. При виникненні гіпотонії слід розглянути питання щодо зменшення дози.

При застосуванні препаратів із властивостями антагоністів дофамінових рецепторів відзначалось виникнення пізньої дискінезії, що характеризується мимовільними ритмічними рухами (переважно язика та/або обличчя). Є повідомлення про те, що виникнення екстрапірамідних симптомів є фактором ризику для розвитку пізньої дискінезії. Оскільки Рисперон значно меншою мірою провокує розвиток ЕПС, порівняно з класичними нейролептиками, ризик розвитку пізньої дискінезії у порівнянні з іншими нейролептиками значно менший. Якщо виникають ознаки та симптоми пізньої дискінезії, слід розглянути питання щодо відміни всіх антипсихотичних препаратів.

При застосуванні класичних нейролептиків описані випадки виникнення нейролептичного синдрому, що характеризується гіпертермією, ригідністю м'язів, нестабільністю вегетативних функцій, порушенням свідомості та підвищенням рівня креатинфосфокінази. У разі розвитку нейролептичного синдрому необхідно відмінити всі антипсихотичні препарати.

Слід також бути обережними при призначенні Рисперону пацієнтам з хворобою Паркінсона, оскільки теоретично це може викликати погіршення перебігу захворювання.

Відносно класичних нейролептиків відомо, що вони знижують поріг розвитку епілептичного нападу.

Рекомендується з обережністю застосовувати Рисперон у хворих на епілепсію.

Пацієнтам слід рекомендувати утримуватись від переїдання у зв'язку з можливістю збільшення маси тіла.

Препарат містить лактозу, тому пацієнтам із спадковою непереносимістю галактози застосовувати Рисперон не рекомендується.

Під час лікування препаратом можливе виникнення гіперглікемії або загострення існуючого цукрового діабету.

Рисперон, як і інші антипсихотичні засоби, слід з обережністю застосовувати пацієнтам із вродженим синдромом подовження інтервалу QT та при сумісній терапії препаратами, що подовжують інтервал QT.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами. У процесі лікування рекомендується утримуватись від виконання роботи, що потребує підвищеної концентрації уваги, швидких психічних та рухових реакцій.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

З урахуванням того, що Рисперон має вплив в першу чергу на центральну нервову систему, його слід з обережністю застосовувати одночасно з іншими препаратами центральної дії.

При одночасному застосуванні Рисперон зменшує ефект леводопи та інших агоністів дофаміну. При використанні карбамазепіну та інших індукторів печінкових ферментів можливе зниження концентрації активної антипсихотичної фракції рисперидону в плазмі крові. Тому при їх відміні дозу Рисперону необхідно переглянути і, за необхідності, знизити.

Флуоксетин, фенотіазини, трициклічні антидепресанти та деякі β -блокатори можуть підвищувати концентрацію рисперидону в плазмі. Флуоксетин може збільшити концентрацію рисперидону в плазмі. Це менш стосується антипсихотичної фракції.

При застосуванні Рисперону разом з іншими лікарськими засобами, які значною мірою зв'язуються з білками плазми, клінічно вираженого витіснення будь-якого препарату з білкової фракції плазми не спостерігається.

Топірамат помірно знижує біодоступність рисперидону, але не активну антипсихотичну фракцію. Однак клінічна значимість цієї взаємодії малоімовірна.

Фенотіазини, трициклічні антидепресанти та деякі β -адреноблокатори можуть підвищувати концентрацію рисперидону в плазмі.

Амітриптилін не впливає на фармакокінетику рисперидону або активну антипсихотичну фракцію.

Циметидин та ранітидин підвищують біодоступність рисперидону, але тільки мінімальну активну антипсихотичну фракцію.

Еритроміцин, інгібітори печінкових ферментів 3A4 не змінюють фармакокінетику рисперидону та активної антипсихотичної фракції.

Інгібітори холінергази, галантамін та донезепіл, не виявляють клінічно значущих ефектів на фармакокінетику рисперидону та активної антипсихотичної фракції.

Слід дотримуватись обережності при застосуванні препарату одночасно з лікарськими засобами, які подовжують інтервал QT.

Рисперон не виявляє клінічно значущих ефектів на фармакокінетику літію, вальпроату, дигоксину або топірамату.

Прийом їжі не впливає на абсорбцію препарату Рисперон.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Рисперидон – селективний антагоніст 5-HT₂-серотонінергічних та D₂-дофамінергічних рецепторів у центральній нервовій системі; він блокує також α_1 -адренергічні та, меншою мірою, гістамінові H₁- і α_1 -адренергічні рецептори, не виявляючи впливу на холінергічні рецептори. Хоча рисперидон є потужним D₂-антагоністом, що пов'язують з його ефективністю щодо продуктивної симптоматики шизофренії, він не спричиняє значного пригнічення моторної активності та, в порівнянні з класичними нейролептиками, меншою мірою індукує каталепсію. Збалансований центральний антагонізм до серотоніну і дофаміну зменшує схильність до екстрапірамідних побічних ефектів та розширює терапевтичний вплив препарату з охопленням негативних та афективних симптомів шизофренії.

Фармакокінетика. Після перорального прийому активний компонент препарату Рисперон – рисперидон повністю абсорбується та досягає максимальних концентрацій у плазмі протягом 1 - 2 годин. Прийом їжі не впливає на абсорбцію препарату. Рисперидон метаболізується через цитохром P-450 IID6 до 9-гідроксирисперидону, який має аналогічну рисперидону фармакологічну дію. Рисперидон та 9-гідроксирисперидон утворюють активну антипсихотичну фракцію. Іншим шляхом метаболізму рисперидону є N-дезалкілування.

При пероральному прийомі період напіввиведення рисперидону становить приблизно 3 години, період напіввиведення 9-гідроксирисперидону досягає 24 годин.

Рисперидон швидко розподіляється в організмі. Об'єм розподілу становить 1 - 2 л/кг.

Зв'язування рисперидону з білками плазми крові (альбуміном та α_1 -кислим глікопротеїном) складає 88 %, 9-гідроксирисперидону - 77 %.

Рівноважна концентрація рисперидону в плазмі крові у більшості пацієнтів досягається протягом 1 доби, 9-гідроксирисперидону - протягом 4 - 5 днів. Концентрації рисперидону в плазмі пропорціональні дозі препарату (в межах терапевтичних доз).

Через тиждень після початку прийому препарату 70 % дози виводиться з сечею, 14 % - з калом.

Сумарний вміст рисперидону та 9-гідроксирисперидону у сечі досягає 35 - 45 % від величини прийнятої дози препарату, іншу частину складають неактивні метаболіти.

У пацієнтів літнього віку, а також у пацієнтів з вираженими порушеннями функції нирок після одноразового прийому препарату відмічається вища, ніж звичайно, концентрація активної речовини та уповільнене її виведення.

У пацієнтів з вираженими порушеннями функції печінки концентрація рисперидону в плазмі крові не відрізняється від концентрації, що спостерігається у пацієнтів з нормальною функцією печінки.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості: таблетки круглої форми, з рискою, вкриті плівковою оболонкою жовтого кольору.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання. Зберігати у недоступному для дітей місці, в оригінальній упаковці, при температурі не вище 25 °С.

Упаковка. По 10 таблеток у блістері; по 2 блістери в пачці картонній.

Категорія відпуску. За рецептом.

Заявник. ТОВ «Дамона».

Виробник. ТОВ «Фарма Старт».

Місцезнаходження. Україна, 03124, м. Київ, бульв. І. Лепсе, 8.