Инструкция по применению
Галоперидол-Рихтер таблетки 5 мг 50 шт

Характеристики

Форма выпуска: Таблетки
Страна: Венгрия
Производитель: Гедеон Рихтер
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Галоперидол
Количество в упаковке: 50
Дозировка действующего вещества: 5 мг



Описание

Таблетки Галоперидол-Рихтер - антипсихотическое средство (нейролептик), производное бутирофенона. Обладает выраженным антипсихотическим действием, блокирует постсинаптические допаминовые рецепторы в мезолимбических и мезокортикальных структурах головного мозга. Высокая антипсихотическая активность сочетается с умеренным седативным эффектом (в небольших дозах оказывает активирующее действие) и выраженным противорвотным действием. Не обладает антигистаминергической или антихолинергической активностью.

Действующее вещество

Галоперидол

Состав

Действующее вещество: галоперидол. Вспомогательные вещества: картофельный крахмал, коллоидный диоксид кремния, желатин, стеарат магния, тальк, кукурузный крахмал, моногидрат лактозы.

Форма выпуска

Таблетки

Фармакокинетика

Всасывание. При приеме внутрь всасывается путем пассивной диффузии, в неионизированной форме, главным образом, из тонкого кишечника. Биодоступность - 60-70%. При пероральном применении Cmax в крови достигаются через 2-6 ч, при в /м - через 20 мин. Терапевтический эффект наступает при плазменной концентрации 20-25 мг/л. Распределение. Галоперидол на 90% связывается с белками плазмы, 10% представляют собой свободную фракцию. Vd в равновесном состоянии - 7.9±2.5 л/кг. Отношение концентрации в эритроцитах к концентрации в плазме 1:12. Концентрация галоперидола в тканях выше, чем в крови, препарат имеет тенденцию к кумуляции в тканях. Легко проходит через гистогематические барьеры, включая плацентарный и ГЭБ. Проникает в грудное молоко. Метаболизм. Подвергается эффекту "первого прохождения" через печень. Метаболизируется в печени путем окислительного N-дезалкилирования и глюкуронирования. В метаболизме препарата принимают участие изоферменты CYP2D6, CYP3A3, CYP3A5, CYP3A7. Является ингибитором CYP2D6. Активных метаболитов нет. Выведение. T1/2 из плазмы крови при приеме внутрь - 24 ч (12-37 ч), после в/м введения - 21 ч (17-25 ч), после в/в - 14 ч (10-19 ч). Выводится в виде метаболитов с калом - 60 % (в т.ч. с желчью - 15%), с мочой - 40% (в т.ч. 1% - в неизмененном виде).

Показания

Острые и хронические психозы, сопровождающиеся возбуждением, галлюцинаторными и бредовыми расстройствами, маниакальные состояния, психосоматические расстройства, расстройства поведения, изменения личности (параноидные, шизоидные и другие), синдром Жиля де ля Туретта, как в детском возрасте, так и у взрослых, тики, хорея Геттингтона, длительно сохраняющаяся и неподдающаяся терапии рвота, в т.ч. связанная с противоопухолевой терапией, и икота, премедикация перед оперативным вмешательством.

Способ применения и дозы

Принимают внутрь, во время или после еды, запивая полным (240 мл) стаканом воды или молока. Доза зависит от клинической реакции больного. Чаще всего это означает постепенное повышение дозы в острой фазе заболевания, в случае поддерживающих доз - постепенное снижение дозы, чтобы обеспечить наименьшую эффективную дозу. Высокие дозы применяют лишь в случаях неэффективности меньших доз. Ниже предлагаются средние дозы. Начальная суточная доза для взрослых составляет 1.5-5 мг, разделенная на 2-3 приема. При необходимости дозу постепенно увеличивают на 1.5-3 мг (в резистентных случаях до 5 мг) до достижения необходимого терапевтического эффекта. Максимальная суточная доза - 100 мг. В среднем терапевтическая доза составляет 10-15 мг/сутки, при хронических формах шизофрении - 20-40 мг/сутки, в случае необходимости дозу можно увеличить до 50-60 мг/сутки. Максимальная доза – 100 мг/сутки. В среднем продолжительность курса лечения - 2-3 мес. Поддерживающие дозы (вне обострения) - от 0.5-0.75 мг до 5 мг /сутки (дозу снижают постепенно). При острых психозах - разовая доза 1.5-5 мг (до 10 мг) в таблетках, как правило, через каждые 4-8 часа. Суточная доза при пероральном применении препарата - не более 100 мг. Поддерживающая терапия: внтурь - от 0.5 мг до 20 мг/сутки. Применяется минимальная доза, способная поддержать ремиссию. При непсихотических нарушениях поведения, синдроме Жиля де ля Туретта - внутрь, вначале 0.05 мг/кг/сутки в 2-3 приема, затем дозу постепенно увеличивают 1 раз каждые 5-7 дней до общей дозы 0.075 мг/кг/сутки. При детском аутизме - внутрь 0.025-0.05 мг/кг/сутки. При тиках, хорее Гентингтона - внутрь 0.025-0.05 мг/кг/сутки. При отсутствии эффекта в течение 1 месяца лечение продолжать не рекомендуется. При длительно сохраняющейся и устойчивой к терапии рвоте - по 1.5-2 мг 2 раза /сутки. Пожилым или ослабленным пациентам назначают 1/3-1/2 обычной дозы для взрослых, дозу увеличивают не чаще, чем каждые 2-3 дня. Детям с массой тела 60 кг и более при психотических расстройствах - внутрь 0.05 мг/кг/сутки в 2-3 приема, при необходимости с учетом переносимости дозу постепенно увеличивают 1 раз каждые 5-7 дней до общей дозы 0.15 мг/кг/сутки.

Противопоказания

Тяжелое токсическое угнетение функции ЦНС, вызванное ксенобиотиками, комы различного генеза, заболевания ЦНС, сопровождающиеся пирамидными и экстрапирамидными расстройствами (болезнь Паркинсона), беременность, период лактации, дети с массой тела до 60 кг, дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция, повышенная чувствительность к производным бутирофенона, повышенная чувствительность к компонентам препарата.

Применение при беременности и кормлении грудью

Галоперидол-Рихтер противопоказан к применению при беременности и в период лактации.

Побочные действия

Со стороны нервной системы: головная боль, головокружение, бессонница или сонливость (различной степени выраженности), тревога, акатизия, эйфория, депрессия, судорожные расстройства, экстрапирамидные расстройства, при длительном лечении - поздняя дискинезия (причмокивание и сморщивание губ, надувание щек, быстрые и червеобразные движения языка, неконтролируемые жевательные движения, неконтролируемые движения рук и ног), поздняя дистония (учащенное моргание или спазмы век, необычное выражение лица или положение тела, неконтролируемые изгибающиеся движения шеи, туловища, рук и ног) и злокачественный нейролептический синдром (гипертермия, мышечная ригидность, затрудненное или учащенное дыхание, тахикардия, аритмия, повышение или снижение АД, повышенное потоотделение, недержание мочи, судорожные расстройства, угнетение сознания). Со стороны сердечно-сосудистой системы: при применении в высоких дозах - снижение АД, ортостатическая гипотензия, аритмии (желудочковые аритмии типа "пируэт"), изменения на ЭКГ (удлинение интервала QT, признаки трепетания и мерцания желудочков), случаи внезапной смерти. Со стороны пищеварительной системы: при применении в высоких дозах - снижение аппетита, сухость во рту, гипосаливация, тошнота, рвота, диарея или запоры, нарушение функции печени, вплоть до развития желтухи. Со стороны системы кроветворения: транзиторная лейкопения или лейкоцитоз, агранулоцитоз, эритропения и тенденция к моноцитозу. Со стороны мочевыделительной системы: задержка мочи (например, при гиперплазии предстательной железы), периферические отеки. Со стороны половой системы и молочной железы: боли в грудных железах, гинекомастия, гиперпролактинемия, нарушение менструального цикла, снижение потенции, повышение либидо, приапизм. Со стороны органа зрения: катаракта, ретинопатия, нечеткость зрения. Со стороны обмена веществ: гипонатриемия, гипер- или гипогликемия. Дерматологические реакции: макуло-папулезные и акнеобразные изменения кожи, фотосенсибилизация. Аллергические реакции: бронхоспазм, ларингоспазм. Прочие: алопеция, увеличение массы тела, тепловой удар.

Передозировка

При передозировке препарата возможно появление острых нейролептических реакций. Симптомы: ригидность мышц, тремор, сонливость, снижение, иногда повышение АД, в тяжелых случаях - коматозное состояние, угнетение дыхания, шок, удлинение интервала QT на ЭКГ, аритмия. Особо должно настораживать повышение температуры тела, которое может быть одним из симптомов злокачественного нейролептического синдрома. В тяжелых случаях передозировки могут наблюдаться различные формы нарушения сознания, вплоть до комы, судорожные реакции. Лечение: при приеме внутрь - промывание желудка, активированный уголь. При угнетении дыхания может потребоваться ИВЛ. При снижении АД и коллапсе - для поддержания кровообращения в/в вводят плазму или концентрированный альбумин, допамин или норэпинефрин. Эпинефрин в этих случаях применять категорически запрещается, т.к. его введение может спровоцировать выраженную гипотензию. Для купирования экстрапирамидных симптомов - центральные м-холиноблокаторы и противопаркинсонические лекарственные средства. В/в вводят диазепам, раствор декстрозы, ноотропы, витамины группы В и С. Диализ неэффективен. Специфического антидота нет.

Взаимодействие с другими препаратами

Повышает выраженность угнетающего влияния на ЦНС этанола, трициклических антидепрессантов, наркотических анальгетиков, барбитуратов и снотворных препаратов, средств для общей анестезии. Усиливает действие периферических м-холиноблокаторов и большинства гипотензивных средств (снижает действие гуанетидина вследствие вытеснения его из #-адренергических нейронов и подавления его захвата этими нейронами). Тормозит метаболизм трициклических антидепрессантов и ингибиторов МАО, при этом увеличивается (взаимно) их седативный эффект и токсичность. При одновременном применении с бупропионом снижает порог судорожной готовности и увеличивает риск возникновения больших эпилептических припадков. Уменьшает эффект противосудорожных средств (снижение судорожного порога галоперидолом). Ослабляет сосудосуживающее действие допамина, фенилэфрина, норэпинефрина, эфедрина и эпинефрина (блокада #-адренорецепторов галоперидолом, что может привести к извращению действия эпинефрина и к парадоксальному снижению АД). Снижает эффект противопаркинсонических средств (блокада допаминовых рецепторов в ЦНС). Изменяет (может повышать или снижать) эффект антикоагулянтов. Уменьшает действие бромокриптина (может потребоваться корректировка дозы). При применении с метилдопой увеличивает риск развития психических нарушений (в т.ч. дезориентацию в пространстве, замедление и затруднение процессов мышления). Амфетамины снижают антипсихотическое действие галоперидола, который в свою очередь уменьшает их психостимулирующий эффект (блокада галоперидолом #-адренорецепторов). М-холиноблокаторы, блокаторы гистаминовых Н1-рецепторов 1 поколения и противопаркинсонические средства могут усиливать м-холиноблокирующее влияние галоперидола и снижать его антипсихотическое действие (может потребоваться коррекция дозы). Длительное применение карбамазепина, барбитуратов и других индукторов микросомальных ферментов печени снижает концентрацию галоперидола в плазме. В сочетании с препаратами лития (особенно в высоких дозах) возможно развитие энцефалопатии (может вызвать необратимую нейроинтоксикацию) и усиление экстрапирамидной симптоматики. При одновременном применении с флуоксетином возрастает риск развития побочных эффектов со стороны ЦНС, особенно экстрапирамидных реакций. При одновременном применении с препаратами, вызывающими экстрапирамидные реакции, повышает частоту и тяжесть эстрапирамидных расстройств. Употребление крепкого чая или кофе (особенно в больших количествах) снижает действие галоперидола.

Особые указания

Парентеральное введение должно проводиться под строгим контролем врача, особенно у пациентов пожилого и детского возраста. По достижении терапевтического эффекта следует перейти на пероральную форму лечения. Назначение антипсихотических препаратов (в т.ч. галоперидола) для лечения психотических расстройств, связанных с деменцией у пожилых пациентов, вызывает риск смерти. В течение 10-недельного плацебо-контролируемого клинического исследования смертность в группе пациентов, получавших антипсихотические препараты, составила около 4.5%, по сравнению с частотой около 2.6% в группе плацебо. Большинство смертельных случаев имели сердечно-сосудистые (например, сердечная недостаточность, внезапная смерть) и/или инфекционные (например, пневмонии) причины. Наблюдательные клинические исследования показали, что терапия традиционными нейролептиками может увеличить смертность. Во время лечения следует регулярно осуществлять мониторинг ЭКГ, формулы крови, печеночных проб. Поскольку галоперидол может вызывать удлинение интервала QT, следует соблюдать осторожность при наличии риска пролонгирования интервала QT (синдром удлиненного интервала QT, гипокалиемия, применение препаратов, вызывающих удлинение интервала QT), особенно при парентеральном введении. В связи с тем, что галоперидол метаболизируется в печени, важно проявлять осторожность при назначении препарата пациентам с нарушением функции печени. Известны случаи развития судорог, вызванных галоперидолом. Больным эпилепсией и больным, в состояниях, предрасполагающих к развитию судорожного синдрома (алкоголизм, травма головного мозга в анамнезе), препарат следует назначать с особой осторожностью. Для купирования экстрапирамидных расстройств назначают противопаркинсонические средства (циклодол), ноотропы, витамины, их применение продолжают и после отмены галоперидола, если они выводятся из организма быстрее, чем галоперидол, во избежание усиления экстрапирамидных симптомов. При развитии поздней дискинезии не следует резко отменять препарат, рекомендуется постепенное снижение дозы. Лечение прекращают постепенно во избежание возникновения синдрома отмены. Необходимо соблюдать осторожность при выполнении тяжелой физической работы, приеме горячей ванны (возможно развитие теплового удара вследствие подавления центральной и периферической терморегуляции в гипоталамусе). Во время лечения не следует принимать "противопростудные" безрецептурные препараты (возможно усиление м-холиноблокирующих эффектов и риска возникновения теплового удара). Следует защищать открытые участки кожи от избыточного солнечного излучения вследствие повышенного риска фотосенсибилизации. Противорвотное действие может маскировать признаки лекарственной токсичности и затруднять диагностику состояний, первым симптомом которых является тошнота. Во время лечения препаратом употребление алкоголя не рекомендуется.Влияние на способность к

вождению автотранспорта и управлению механизмами: во время применения препарата запрещается управлять транспортными средствами и заниматься другими видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.