

ИНСТРУКЦИЯ
по применению лекарственного препарата для медицинского применения
Рисполент® (Rispolent®)

Регистрационный номер –

Торговое название: Рисполент®

Международное непатентованное название: рисперидон

Химическая формула: 3[2-[4-(6-фтор-1,2-бензизоксазол-3-ил)пиперидин-1-ил]этил]-2-метил-6,7,8,9-тетрагидро-4Н-пиридо[1,2-а]пиrimидин-4-он

Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Состав

Таблетка 1 мг – каждая таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит:

Действующее вещество: рисперидон 1 мг.

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат – 131 мг, кукурузный крахмал – 44 мг, гипромеллоза 2910 15 мПа·с – 2 мг, натрия лаурилсульфат – 0,4 мг, микрокристаллическая целлюлоза – 20 мг, магния стеарат – 1 мг, кремния диоксид коллоидный – 0,6 мг.

Оболочка: гипромеллоза 2910 5 мПа·с – 4 мг, пропиленгликоль – 1 мг.

Таблетка 2 мг – каждая таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит:

Действующее вещество: рисперидон 2 мг.

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат – 130 мг, кукурузный крахмал – 44 мг, гипромеллоза 2910 15 мПа·с – 2 мг, натрия лаурилсульфат – 0,4 мг, микрокристаллическая целлюлоза – 20 мг, магния стеарат – 1 мг, кремния диоксид коллоидный – 0,6 мг.

Оболочка: гипромеллоза 2910 5 мПа·с – 4 мг, пропиленгликоль – 1 мг, тальк – 1,2 мг, титана диоксид – 2 мг, краситель солнечный закат желтый (Е110) – 0,05 мг.

Таблетка 3 мг – каждая таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит:

Действующее вещество: рисперидон 3 мг.

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат – 195 мг, кукурузный крахмал – 66 мг, гипромеллоза 2910 15 мПа·с – 3 мг, натрия лаурилсульфат – 0,6 мг, микрокристаллическая целлюлоза – 30 мг, магния стеарат – 1,5 мг, кремния диоксид коллоидный – 0,9 мг.

Оболочка: гипромеллоза 2910 5 мПа·с – 5,2 мг, пропиленгликоль – 1,3 мг, тальк – 1,56 мг, титана диоксид – 2,6 мг, краситель хинолиновый желтый (Е104) – 0,052 мг.

Таблетка 4 мг – каждая таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит:

Действующее вещество: рисперидон 4 мг.

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат – 260 мг, кукурузный крахмал – 88 мг, гипромеллоза 2910 15 мПа·с – 4 мг, натрия лаурилсульфат – 0,8 мг, микрокристаллическая целлюлоза – 40 мг, магния стеарат – 2 мг, кремния диоксид коллоидный – 1,2 мг.

Оболочка: гипромеллоза 2910 5 мПа·с – 6,8 мг, пропиленгликоль – 1,7 мг, тальк – 2,04 мг, титана диоксид – 3,4 мг, краситель хинолиновый желтый (Е104) – 0,068 мг, индигокармин (Е132) – 0,068 мг.

Описание

Таблетки 1 мг – Белые, продолговатые, двояковыпуклые таблетки с риской, покрытые пленочной оболочкой, с надписями «Ris» и «1» на одной стороне.

Таблетки 2 мг – Светло-оранжевые, продолговатые, двояковыпуклые таблетки с риской, покрытые пленочной оболочкой, с надписями «Ris» и «2» на одной стороне.

Таблетки 3 мг – Желтые, продолговатые, двояковыпуклые таблетки с риской, покрытые пленочной оболочкой, с надписями «Ris» и «3» на одной стороне.

Таблетки 4 мг – Зеленые, продолговатые, двояковыпуклые таблетки с риской, покрытые пленочной оболочкой, с надписями «Ris» и «4» на одной стороне.

Фармакотерапевтическая группа: прочие антипсихотические препараты

Код ATХ: N05AX08

Фармакодинамика

Рисполепт® (рисперидон) – антипсихотическое средство, производное бензизоксазола, оказывает также седативное, противорвотное и гипотермическое действие.

Рисперидон – это селективныйmonoаминергическийантагонист, обладает высоким аффинитетом к серотонинергическим 5-HT₂ и дофаминергическим D₂-рецепторам. Рисперидон связывается также с α₁-адренергическими рецепторами и, несколько слабее, с H₁-гистаминергическими и α₂-адренергическими рецепторами. Рисперидон не обладает тропностью к холинергическим рецепторам. *Антипсихотическое действие* обусловлено блокадой D₂-дофаминергических рецепторов мезолимбической и мезокортикальной системы. *Седативное действие* обусловлено блокадой адrenomинорецепторов ретикулярной формации ствола головного мозга; *противорвотное действие* – блокадой дофаминовых D₂-рецепторов триггерной зоны рвотного центра; *гипотермическое действие* – блокадой дофаминовых рецепторов гипоталамуса.

Рисперидон снижает продуктивную симптоматику шизофрении (бред, галлюцинации), агрессивность, автоматизм, он вызывает меньшее подавление двигательной активности и в меньшей степени индуцирует каталепсию, чем типичные нейролептики. Сбалансированный центральный антидепрессант к серотонину и дофамину может уменьшать склонность к экстрапирамидным побочным действиям и расширять терапевтическое воздействие препарата с охватом негативных и аффективных симптомов шизофрении.

Фармакокинетика

Рисперидон после перорального приема полностью абсорбируется, достигая максимальных концентраций в плазме через 1–2 часа. Пища не оказывает влияния на абсорбцию рисперидона, поэтому его можно назначать независимо от приема пищи.

Рисперидон быстро распределяется в организме. Объем распределения составляет 1–2 л/кг. В плазме рисперидон связывается с альбумином и альфа₁-кислым гликопротеином. Рисперидон на 88% связывается белками плазмы, 9-гидроксирисперидон – на 77%.

Равновесная концентрация рисперидона в организме у большинства пациентов достигается в течение 1 дня. Равновесная концентрация 9-гидроксирисперидона достигается через 4–5 дней. Концентрации рисперидона в плазме пропорциональны дозе препарата (в пределах терапевтических доз).

Рисперидон метаболизируется изоферментом CYP2D6 до 9-гидроксирисперидона, который обладает аналогичным рисперидону фармакологическим действием. Рисперидон и 9-гидроксирисперидон составляют активную антипсихотическую фракцию. Другим путем метаболизма рисперидона является N-дезалкилирование.

После перорального приема у больных с психозом рисперидон выводится из организма с периодом полувыведения (T_{1/2}) около 3 часов. T_{1/2} 9-гидроксирисперидона и активной антипсихотической фракции составляют 24 часа.

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.

Исследование однократного приема препарата выявило более высокую концентрацию в плазме и более медленное выведение у пожилых и у пациентов с почечной недостаточностью. Концентрации рисперидона в плазме у пациентов с печеночной недостаточностью были нормальными.

Показания

Купирование острых приступов и длительная поддерживающая терапия:

- острой и хронической шизофрении у взрослых и детей от 13 лет;
- аффективных расстройств при различных психических заболеваниях у взрослых и детей от 10 лет;
- поведенческих расстройств у пациентов с деменцией при проявлении симптомов агрессивности (вспышки гнева, физическое насилие), нарушениях деятельности (возбуждение, бред) или психотических симптомах;
- расстройств поведения в случаях, если агрессивное или деструктивное поведение (импульсивность и аутоагgression) является ведущим в клинической картине болезни.

Для стабилизации настроения при лечении маний при биполярных расстройствах – в качестве средства вспомогательной терапии у взрослых и детей от 10 лет.

Лечение аутизма у детей от 5 лет и подростков.

Противопоказания

- индивидуальная повышенная чувствительность к рисперидону или любому другому ингредиенту этого препарата
- детский возраст до 5 лет (опыт применения недостаточен).

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 (см. раздел «Способ применения и дозы»);
- состояния, предрасполагающие к развитию тахикардии типа «шируэт» (брadiкардия, нарушение электролитного баланса, сопутствующий прием лекарственных средств, удлиняющих интервал QT);
- опухоль мозга, кишечная непроходимость, случаи острой передозировки лекарств, синдром Рейе (противоротный эффект рисперидона может маскировать симптомы этих состояний);
- беременность и период лактации.

✓ Применение при беременности и лактации

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. В случае если

женщина принимала антипсихотические препараты (включая Рисполент®) в третьем триместре беременности, у новорожденных существует риск возникновения экстрапирамидных расстройств и/или синдрома отмены различной степени тяжести. Эти симптомы могут включать ажитацию, гипертонию, гипотонию, трепет, сонливость, респираторные нарушения и нарушение вскармливания. Препарат Рисполент® можно применять во время беременности только в тех случаях, когда потенциальная польза для женщины перевешивает возможный риск для плода.

Поскольку рисперидон и 9-гидроксирисперидон проникают в грудное молоко, женщинам, применяющим Рисполент®, не следует кормить грудью.

Способ применения и дозы

Внутрь, независимо от приема пищи.

1. Шизофрения

Взрослые. Рисполент® может назначаться один или два раза в сутки.

Начальная доза препарата Рисполент® – 2 мг в сутки. На второй день дозу следует увеличить до 4 мг в сутки. С этого момента дозу можно либо сохранить на прежнем уровне, либо индивидуально скорректировать при необходимости. Обычно оптимальной дозой является 4–6 мг в сутки. В ряде случаев может быть оправдано более медленное повышение дозы и более низкие начальная и поддерживающая дозы.

Дозы выше 10 мг в сутки не показали более высокой эффективности по сравнению с меньшими дозами и могут вызвать появление экстрапирамидных симптомов. В связи с тем, что безопасность доз выше 16 мг в сутки не изучалась, дозы выше этого уровня применять нельзя. К терапии препаратом Рисполент® можно добавить бензодиазепины, если требуется дополнительный седативный эффект.

Пожилые пациенты. Рекомендуется начальная доза 0,5 мг на прием дважды в сутки. Дозу можно индивидуально увеличить по 0,5 мг дважды в сутки до 1–2 мг дважды в сутки. При необходимости применения дозы 0,5 мг рекомендуется применять препарат Рисполент®, раствор для приема внутрь.

Подростки старше 13 лет. Рекомендуется начальная доза 0,5 мг на прием один раз в сутки утром или вечером. При необходимости дозу можно увеличить не менее чем через 24 часа на 0,5–1 мг в день до рекомендуемой дозы 3 мг в сутки при хорошей переносимости. Безопасность доз выше 6 мг в сутки не изучалась.

Пациентам, у которых наблюдается устойчивая сонливость, рекомендуется принимать половину суточной дозы 2 раза в сутки.

При необходимости применения дозы 0,5 мг рекомендуется применять препарат Рисполент®, раствор для приема внутрь.

Сведения по применению препарата для лечения шизофрении у детей до 13 лет отсутствуют.

2. Поведенческие расстройства у больных с деменцией

Рекомендуется начальная доза по 0,25 мг на прием дважды в день. Дозу при необходимости можно индивидуально увеличивать по 0,25 мг 2 раза в сутки, не чаще чем через день. Для большинства пациентов оптимальной дозой является 0,5 мг дважды в день. Однако некоторым пациентам показан прием по 1 мг 2 раза в день.

По достижении оптимальной дозы может быть рекомендован прием препарата один раз в день.

При необходимости применения доз 0,25 мг или 0,5 мг рекомендуется применять препарат Рисполент®, раствор для приема внутрь.

3. Биполярные расстройства при маниаке

Взрослые. Рекомендованная начальная доза препарата – 2 или 3 мг в день за один прием. При необходимости эта доза может быть повышена не менее чем через 24 часа на 1 мг в день. Для большинства пациентов оптимальной дозой является 1–6 мг в сутки.

Подростки и дети старше 10 лет. Рекомендуется начальная доза 0,5 мг на прием один раз в сутки утром или вечером. При необходимости дозу можно увеличить не менее чем через 24 часа на 0,5–1 мг в день до рекомендуемой дозы 2,5 мг в сутки при хорошей переносимости. Для большинства пациентов оптимальной дозой является 0,5–6 мг в день.

При необходимости применения дозы 0,5 мг рекомендуется применять препарат Рисполент®, раствор для приема внутрь.

Безопасность доз выше 6 мг в сутки не изучалась.

Пациентам, у которых наблюдается устойчивая сонливость, рекомендуется принимать половину суточной дозы 2 раза в сутки.

Сведения по применению препарата для лечения биполярных расстройств у детей до 10 лет отсутствуют.

4. Расстройства поведения

Пациенты с массой тела 50 кг и более - рекомендованная начальная доза препарата – 0,5 мг один раз в день. При необходимости эта доза может быть повышенна на 0,5 мг в день, не чаще чем через день. Для большинства пациентов оптимальной дозой является доза 1 мг в день. Однако для некоторых пациентов предпочтительней прием по 0,5 мг в день, тогда как некоторым требуется увеличение дозы до 1,5 мг в день. При необходимости применения дозы 0,5 мг рекомендуется применять препарат Рисполент®, раствор для приема внутрь.

Пациенты с массой тела менее 50 кг – рекомендованная начальная доза препарата – 0,25 мг один раз в день. При необходимости эта доза может быть повышенна на 0,25 мг в день, не чаще чем через день. Для большинства пациентов оптимальной дозой является доза 0,5 мг в день. Однако для некоторых пациентов предпочтительней прием по 0,25 мг в день, тогда как некоторым требуется увеличение дозы до 0,75 мг в день. При необходимости применения доз 0,25 мг или 0,5 мг рекомендуется применять препарат Рисполент®, раствор для приема внутрь.

Длительный прием препарата Рисполент® у подростков должен проводиться под постоянным контролем врача.

Применение у детей младше 5 лет не изучалось.

5. Аутизм у детей и подростков

Дозировка Рисполент® должна подбираться индивидуально.

Рекомендованная начальная доза препарата – 0,25 мг в сутки для пациентов с массой тела менее 20 кг и 0,5 мг в сутки для пациентов с массой тела 20 кг и более. На четвертый день приема доза может быть увеличена на 0,25 мг для пациентов с массой тела менее 20 кг и на 0,5 мг в сутки для пациентов с массой тела 20 кг и более.

Данная доза должна применяться примерно до 14 дня лечения, когда необходимо провести оценку эффективности. Дальнейшее увеличение дозы проводится только в случае отсутствия эффективности. Дозу можно увеличивать с интервалами в 2 недели и более на 0,25 мг для пациентов с массой тела менее 20 кг и на 0,5 мг в сутки для пациентов с массой тела 20 кг и более.

В клинических исследованиях максимальная суточная доза не превышала 1,5 мг для пациентов с массой тела менее 20 кг и 2,5 мг в сутки для пациентов с массой тела 20 кг и более, и 3,5 мг для пациентов с массой тела более 45 кг.

Дозы Рисполент® при лечении аутизма у детей (мг в сутки)

Масса тела	Дни 1-3	Дни 4 – 14+	Увеличение дозы (если необходимо)	Рекомендуемая доза
Менее 20 кг	0,25 мг	0,5 мг	+0,25 мг через 2 недели и более	0,5 мг- 1,5 мг
20 кг и более	0,5 мг	1,0 мг	+0,5 мг через 2 недели и более	1,0 мг – 2,5 мг*

*для пациентов, весящих более 45 кг, могут потребоваться более высокие дозы, максимальная изученная доза – 3,5 мг в сутки.

При необходимости применения доз 0,25 мг или 0,5 мг рекомендуется применять препарат Рисполент®, раствор для приема внутрь.

Рисполент® может назначаться 1 или 2 раза в сутки.

Пациентам, у которых наблюдается устойчивая сонливость, рекомендуется принимать суточную дозу 1 раз перед сном или 2 раза в сутки.

Если наблюдается стабильная эффективность может быть принято решение постепенно снизить дозу для достижения оптимального баланса эффективности и безопасности.

Применение у детей младше 5 лет не изучалось.

Заболевания печени и почек.

У пациентов с заболеваниями почек снижена способность выведения активной антипсихотической фракции по сравнению с другими пациентами. У пациентов с заболеваниями печени наблюдается повышенная концентрация свободной фракции рисперидона в плазме крови.

Начальная и поддерживающая доза в соответствии с показаниями должна быть уменьшена в 2 раза, увеличение дозы у пациентов с заболеваниями печени и почек должно проводиться медленнее.

При необходимости применения доз 0,25 мг или 0,5 мг рекомендуется применять препарат Рисполент®, раствор для приема внутрь.

Рисполент® следует назначать с осторожностью у данной категории больных.

Побочное действие

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

Инфекции:

очень часто – у пожилых пациентов с деменцией – инфекции мочевыводящих путей;
часто – назофарингит, инфекции верхних дыхательных путей, синусит, инфекции мочевыводящих путей, у пожилых пациентов с деменцией – пневмония, флегмона, у детей – ринит, гриппоподобные заболевания;

нечасто – инфекции уха, вирусные инфекции, фарингит, тонзиллит, бронхит, инфекции глаз, локализованные инфекции, цистит, онихомикоз, акродерматит, бронхопневмония, инфекции дыхательных путей, трахеобронхит.

Гематологические нарушения и нарушения лимфатической системы:

часто – анемия;

нечасто – гранулоцитопения, нейтропения;

очень редко – тромбоцитопения, агранулоцитоз.

Со стороны иммунной системы:

нечасто – гиперчувствительность;

очень редко – анафилактический шок.

Со стороны эндокринной системы:

нечасто – гиперпролактинемия, диабетическая кома;

очень редко – нарушение секреции антидиуретического гормона.

Нарушения метаболизма и питания:

часто – у пожилых пациентов с деменцией – снижение аппетита, у детей – увеличение аппетита;
нечасто – полидипсия, анорексия;
редко – диабетический кетоацидоз, сахарный диабет, гипогликемия, водная интоксикация.

Психические нарушения:

очень часто – бессонница;
часто – беспокойство, нервозность, у пожилых пациентов с деменцией – спутанность сознания, у детей – вялость;
нечасто – возбуждение, уплощение аффекта, нарушения сна, ослабление либido, анергия;
очень редко – мании.

Со стороны нервной системы:

очень часто – паркинсонизм (включая экстрапирамидные расстройства, синдром «зубчатого колеса», акинезию, брадикинезию, гипокинезию, мышечную ригидность), у детей – сонливость, головные боли, седативное действие;
часто – акатизия (в т.ч. беспокойство), сонливость, головокружение, седация, трепет, дистония (включая мышечные спазмы, непроизвольные мышечные сокращения, контрактуру мышц, непроизвольные движения глазных яблок, паралич языка), легаргия, постуральное головокружение, дискинезия (включая подергивания мышц, хорею и хореоатетоз), обморок, у пожилых пациентов с деменцией – подавленное состояние, у детей – дизартрия, нарушение внимания, нарушение походки;
нечасто – отсутствие реакции на раздражители, нарушение координации, потеря сознания, нарушение речи, гипестезия, нарушение движений, поздняя дискинезия, ишемия мозга, цереброваскулярные нарушения, злокачественный нейролептический синдром, ритмичное кивание головой.

Офтальмологические нарушения:

часто – нарушение остроты зрения, у пожилых пациентов с деменцией – конъюнктивит;
нечасто – гиперемия конъюнктивы, нарушение зрения, непроизвольные вращения глазных яблок, отек век, периорбитальный отек, образование корки на краях век, сухость глаз, усиленное слезотечение, светобоязнь, повышение внутриглазного давления.

Со стороны уха и лабиринта:

часто – боль в ухе;
нечасто – шум в ушах.

Со стороны сердечно-сосудистой системы:

часто – тахикардия, ортостатическая гипотензия, снижение артериального давления, у пожилых пациентов с деменцией – преходящая ишемическая атака, инфаркт миокарда, инсульт, у детей – ощущение сердцебиения;
нечасто – синусовая брадикардия, синусовая тахикардия, ощущение сердцебиения, атриовентрикулярная блокада I степени, блокада правой и левой ножек пучка Гиса, атриовентрикулярная блокада, «приливы» крови;
очень редко – фибрилляция предсердий.

Респираторные, торакальные нарушения и нарушения со стороны средостения:

часто – заложенность носа, одышка, носовое кровотечение, заложенность пазух носа, у пожилых пациентов с деменцией – кашель, ринорея, у детей – кашель, ринорея, боль в области гортани и глотки, застой в легких;

нечасто – свистящее дыхание, аспирационная пневмония, дисфония, продуктивный кашель, закупорка дыхательных путей, влажные хрипы, нарушение дыхания, отек носа, гипервентиляция;
очень редко – синдром апноэ во сне.

Со стороны желудочно-кишечного тракта:

часто – тошнота, запор, диспепсия, рвота, диарея, слюнотечение, сухость во рту, дискомфорт в желудке, боли в области живота, у пожилых пациентов с деменцией – дисфагия, фекалома;
нечасто – энкопрез, гастрит, отек губ, хейлит, антиализм, дисгевзия;
очень редко – непроходимость кишечника, панкреатит.

Гепатобилиарные нарушения:

очень редко – желтуха.

Со стороны кожи и подкожных тканей:

часто – сыпь, сухость кожи, перхоть, себорейный дерматит, гиперкератоз, у пожилых пациентов с деменцией – эритема, у детей – зуд, акне;
нечасто – нарушение пигментации кожи, эритематозные высыпания, папулезные высыпания, генерализованная сыпь, макулопапулезная сыпь;
очень редко – отек Квинке, алопеция.

Со стороны костно-мышечной системы и соединительной ткани:

часто – боли в спине, артralгия, боли в конечностях, у пожилых пациентов с деменцией – нарушения походки, опухание суставов, у детей – миалгия, боли в шее;
нечасто – мышечные боли в груди, скованность в суставах, мышечная слабость, рабдомиолиз.

Со стороны почек и мочевыводящих путей:

часто – недержание мочи, у детей – энурез, поллакиурия;
нечасто – боль при мочеиспускании;
очень редко – задержка мочевыделения.

Со стороны репродуктивной системы и молочных желез:

часто – отсутствие эякуляции, у детей – галакторея;
нечасто – нарушение менструаций, аменорея, гинекомастия, выделения из влагалища, эректильная дисфункция, нарушение эякуляции, увеличение груди, сексуальная дисфункция, ретроградная эякуляция;
очень редко – приапизм.

Влияние на течение беременности, послеродовые и перинатальные состояния:

очень редко – синдром отмены у новорожденных.

Общие нарушения:

часто – усталость, астения, лихорадка, боли в области грудной клетки, у пожилых пациентов с деменцией – периферический отек, у детей – медлительность, дискомфорт в области грудной клетки;
нечасто – жажда, гриппоподобное состояние, отеки, плохое самочувствие, отек лица, общий отек, озноб, похолодание конечностей, синдром «отмены»;
очень редко – гипотермия.

Нарушения лабораторных и инструментальных показателей:

часто – увеличение активности креатинфосфокиназы, учащение сердечного ритма, у пожилых пациентов с деменцией – повышение температуры тела, у детей – увеличение массы тела, увеличение концентрации пролактина;

нечасто – увеличение активности аланинаминотрансферазы, нарушение ЭКГ, увеличение количества эозинофилов в крови, увеличение активности аспартатаминотрансферазы, увеличение количества лейкоцитов в крови, увеличение концентрации глюкозы в крови, уменьшение концентрации гемоглобина, уменьшение гематокрита, снижение артериального давления, увеличение активности трансамина, увеличение уровня холестерина в крови, увеличение уровня триглицеридов в крови;

очень редко – удлинение интервала QT на электрокардиограмме.

Ниже дополнительно перечислены побочные действия, наблюдаемые при применении внутримышечной формы рисперидона – Рисполент Конста®;

Инфекции: инфекции нижних дыхательных путей, гастроэнтерит, подкожный абсцесс;

Нарушения метаболизма и питания: гипергликемия;

Психические нарушения: депрессия, расстройства засыпания;

Со стороны нервной системы: парестезия, судороги;

Со стороны глаз: блефароспазм;

Со стороны уха и лабиринта: вертиго;

Со стороны сердца: брадикардия;

Сосудистые нарушения: повышение артериального давления;

Со стороны желудочно-кишечного тракта: зубная боль, спазм языка;

Со стороны кожи и подкожных тканей: экзема;

Со стороны костно-мышечной системы и соединительной ткани: боли в ягодицах;

Со стороны репродуктивной системы и молочных желез: задержка менструации, задержка эякуляции, олигоменорея, дискомфорт в области молочных желез;

Общие нарушения: боли, нарушения походки;

Нарушения лабораторных показателей: уменьшение массы тела, увеличение активности гамма-глутамилтрансферазы, увеличение микросомальных ферментов печени, обнаружение глюкозы в моче.

Передозировка

Симптомы: сонливость, седация, тахикардия, снижение артериального давления, экстрапирамидные симптомы. Наблюдалось удлинение интервала QT и судороги. Двунаправленная желудочковая тахикардия отмечалась в совместном приеме повышенной дозы рисперидона и пароксетина.

В случае передозировки должна быть рассмотрена возможность передозировки от приема нескольких препаратов.

Лечение. Следует добиться и поддерживать свободную проходимость дыхательных путей для обеспечения адекватного поступления кислорода и вентиляции, сделать промывание желудка (после интубации, если больной без сознания) и назначить активированный уголь вместе со слабительным. Следует немедленно начать мониторирование ЭКГ для выявления возможных аритмий.

Специфического антидота не существует, должна проводиться соответствующая симптоматическая терапия. Снижение артериального давления и коллапс следует устранять внутривенными инфузиями жидкости и/или симпатомиметическими препаратами. В случае развития острых экстрапирамидных симптомов следует назначить м-холиноблокаторы (например, тригексифенидил). Постоянное медицинское наблюдение и мониторирование следует продолжать до исчезновения симптомов интоксикации.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

С учетом того, что Рисполент[®] оказывает воздействие в первую очередь на центральную нервную систему, его следует применять с осторожностью в сочетании с другими препаратами центрального действия и с алкоголем.

Рисполент[®] уменьшает эффективность леводопы и других агонистов дофаминовых рецепторов. Следует соблюдать осторожность при совместном применении препарата Рисполент[®] с препаратами, увеличивающими интервал QT.

Клизапин снижает клиренс рисперидона.

При применении карbamазепина отмечалось снижение концентрации активной антипсихотической фракции рисперидона в плазме. Аналогичные эффекты могут наблюдаться при применении других индукторов микросомальных ферментов печени. При назначении и после отмены карbamазепина или других индукторов печеночных ферментов следует скорректировать дозу препарата Рисполент[®].

Флуоксетин и пароксетин, ингибиторы печеночных ферментов, 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 Рисполент[®].

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

Производные фенотиазина, трициклические антидепрессанты и некоторые β-адреноблокаторы могут повышать концентрации рисперидона в плазме, однако это не влияет на концентрацию активной антипсихотической фракции. Амитриптилин не влияет на фармакокинетику рисперидона и активной антипсихотической фракции. Циметидин и ранитидин увеличивают биодоступность рисперидона, но в минимальной степени влияют на концентрацию активной антипсихотической фракции. Эритромицин, ингибитор микросомальных ферментов печени, не влияет на фармакокинетику рисперидона и активной антипсихотической фракции. Ингибиторы холинэстеразы (галантамин и донепезил), не оказывают клинически значимого действия на фармакокинетику рисперидона и активной антипсихотической фракции.

При применении препарата Рисполент[®] вместе с другими препаратами, в высокой степени связывающимися с белками плазмы, клинически выраженного вытеснения какого-либо препарата из белковой фракции плазмы не наблюдается.

Гипотензивные лекарственные средства усиливают степень снижения артериального давления на фоне рисперидона.

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

Прием пищи не влияет на абсорбцию рисперидона.

Особые указания

Переход от терапии другими антипсихотическими препаратами. При шизофрении в начале лечения препаратом Рисполент[®] рекомендуется постепенно отменить предыдущую терапию, если это клинически оправдано. При этом если пациенты переводятся с терапии депо формами антипсихотических препаратов, то терапию препаратом Рисполент[®] рекомендуется начинать вместо следующей запланированной инъекции. Периодически следует оценивать необходимость в продолжении текущей терапии противопаркинсоническими препаратами.

Применение у пожилых пациентов с деменцией. У пожилых пациентов с деменцией при лечении атипичными антипсихотическими средствами наблюдается повышенная смертность по сравнению с плацебо в исследованиях атипичных антипсихотических средств, включая рисперидон. При применении 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).

Для пожилых пациентов с деменцией, принимающих пероральные формы рисперидона,

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 75–96 лет) и группой, принимавшей только фуросемид (3,1%, средний возраст 80 лет, диапазон 67–90 лет). 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, дегидратация является общим фактором риска смертности и должна тщательно контролироваться у пожилых пациентов с деменцией.

У пожилых пациентов с деменцией наблюдалось увеличение нарушений мозгового кровообращения, в том числе смертельные случаи у пациентов (средний возраст 85 лет, диапазон 73–97 лет) при применении рисперидона по сравнению с плацебо.

Ортостатическая гипотензия. В связи с α-блокирующим действием рисперидона может возникать ортостатическая гипотензия, особенно в период начального подбора дозы. Клинически значимое снижение артериального давления наблюдается при совместном назначении рисперидона с антигипертензивными препаратами. При возникновении снижения артериального давления следует рассмотреть вопрос о снижении дозы. У пациентов с заболеваниями сердечно-сосудистой системы, а также при обезвоживании, гиповолемии или цереброваскулярных нарушениях, дозу следует увеличивать постепенно, согласно рекомендациям.

Имеются сообщения о том, что возникновение экстрапирамидных симптомов является фактором риска для развития поздней дискинезии. Рисполент® реже вызывает появление экстрапирамидных симптомов, чем классические нейролептики. Если возникают признаки и симптомы поздней дискинезии, следует рассмотреть вопрос об отмене всех антипсихотических препаратов.

В случае развития злокачественного нейролептического синдрома, характеризующегося гипертермией, мышечной ригидностью, нестабильностью автономных функций, нарушениями сознания и повышением активности креатинфосфокиназы (также может наблюдаться миоглобинурия (рабдомиолиз) и острая почечная недостаточность) необходимо отменить все антипсихотические препараты, включая Рисполент®.

Назначение антипсихотических препаратов, включая Рисполент®, пациентам с болезнью Паркинсона или деменцией с тельцами Леви должно проводиться с осторожностью, т.к. у обеих групп пациентов повышен риск развития злокачественного нейролептического синдрома и увеличена чувствительность к антипсихотическим препаратам (включая притупление болевой чувствительности, спутанность сознания, постуральную нестабильность с частыми падениями и экстрапирамидные симптомы).

При лечении препаратом Рисполент® наблюдалась 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 распространностью уровня сахарного диабета в общей популяции. Учитывая эти факторы, взаимосвязь между применением атипичных антипсихотических препаратов и развитием побочных действий, связанных с гипергликемией, не полностью установлена. У всех пациентов необходимо проводить клинический контроль на наличие симптомов гипергликемии и сахарного диабета.

При лечении препаратом Рисполент® наблюдалось значительное увеличение массы тела. Необходимо проводить контроль массы тела пациентов при терапии препаратом Рисполент®. Как и для других антипсихотических средств, следует соблюдать осторожность при назначении Рисполент® пациентам с сердечными аритмиями в анамнезе, пациентам с врожденным

удлинением интервала QT и при совместном применении с препаратами, увеличивающими интервал QT.

Известна способность типичных нейролептиков снижать порог судорожной готовности. Следует с осторожностью назначать Рисполент® пациентам с эпилепсией.

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

Рисполент® может оказывать воздействие на деятельность, требующую быстрой реакции: больным следует рекомендовать не водить автомобиль и не работать с техникой до выяснения их индивидуальной чувствительности к препарату.

Формы выпуска

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой 1 мг, 2 мг, 3 мг и 4 мг

По 10 таблеток помещают в блистер из трехслойной прозрачной фольги (ПВХ/ПЭНП/ПВДХ) и фольги алюминиевой. По 2 или 6 блистеров вместе с инструкцией по применению помещают в картонную коробку.

Условия хранения

При температуре от 15 до 30 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года. Не применять после истечения срока годности.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Производство, первичная упаковка, вторичная упаковка и выпускающий контроль:
Янссен-Силај С.п.А., Италия, Колоньо-Монцезе, Милан, ул. М. Буонаротти, д. 23.

Владелец регистрационного удостоверения, организация, принимающая претензии:
ООО «Джонсон & Джонсон»
121614, Россия, Москва, ул. Крылатская, 17/2

Контактные телефоны:

Тел.: (495) 755-83-57

Факс: (495) 755-83-58