ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению лекарственного препарата

ГАЛОПЕРИДОЛ

Регистрационный номер: ЛСР-001489/09

Торговое название: Галоперидол

Международное непатентованное название: галоперидол

Лекарственная форма: таблетки.

Состав на одну таблетку.

таблетка 1,5 мг:

действующее вещество: галоперидол - 1,5 мг, вспомогательные вещества: лактозы моногидрат (сахар молочный) - 76,5 мг, крахмал кукурузный - 6,0 мг, повидон-К17 - 3,3 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 10,0 мг, магния стеарат - 0,7 мг, каолин прежелатинизированный - 2,0 мг.

таблетка 5 мг:

действующее вещество: галоперидол - 5,0 мг, вспомогательные вещества: лактозы моногидрат (сахар молочный) - 72,0 мг, крахмал кукурузный - 6,0 мг, повидон-К17 - 3,3 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 10,0 мг, магния стеарат - 0,7 мг, каолин прежелатинизированный - 2,0 мг.

Описание

Таблетки белого или белого со слабым желтоватым оттенком цвета, плоскоцилиндрической формы с риской и фаской.

Таблетки белого или белого со слабым желтоватым оттенком цвета, двояковыпуклой формы.

Фармакотерапевтическая группа: антипсихотическое средство (нейролептическое).

Код АТХ: N05AD01

Фармакологические свойства

Фармакодинамика. Антипсихотическое средство (нейролептик) производное бутирофенона. Обладает выраженным антипсихотическим действием, седативным эффектом (в небольших дозах оказывает активирующее действие) и выраженным противорвотным действием. Вызывает экстрапирамидные расстройства, практически не оказывает холиноблокирующего действия.

Седативное действие обусловлено блокадой альфа-адренорецепторов ретикулярной формации ствола головного мозга; противорвотное действие - блокадой дофаминовых D2-рецепторов триггерной зоны центра блуждающего нерва; гипотермическое действие и галакторея - блокадой дофаминовых рецепторов гипоталамуса. Длительный прием сопровождается изменением эндокринного статуса: в передней доле гипофиза увеличивается продукция пролактина и снижается - гонадотропных гормонов.

Фармакокинетика. Абсорбция при приеме внутрь - 60%. Время достижения максимальной концентрации (TCmax) при пероральном приеме - 3 ч. Объем распределения - 18 л/кг, связь с белками плазмы - 92%. Легко проходит через гематоэнцефалический барьер, включая гемоэнцефалический барьер (ГЭБ).

Метаболизируется в печени, имеет эффект "первого прохождения" через печень. В метаболизме препарата принимают участие изоферменты CYP2D6, CYP3A3, CYP3A4, CYP3A7. Является ингибитором CYP2D6. Активных метаболитов нет. Период полувыведения (T1/2) при пероральном приеме - 24 ч (12-37 ч).

Выводится с желчью и мочой после приема внутрь с желчью выводится 15%, с мочой - 40% (в том числе 1% - в неизмененном виде). Проникает в грудное молоко.

Показания к применению.

- Острые и хронические психозы, сопровождающиеся возбуждением, галлюцинаторными и бредовыми расстройствами, маниакальные состояния, психосоматические расстройства.
- Расстройства поведения, изменения личности (паранойяльные, шизоидные и другие), синдром Жиля де ла Туретта, как в детском возрасте, так и у взрослых.
- Тики, хорея Гентингтона.
- Длительно сохраняющаяся и устойчивая к терапии рвота, в том числе связанная с противоопухолевой терапией, и икота.

Противопоказания.

Гиперчувствительность, тяжелое угнетение функции центральной нервной системы (ЦНС) на фоне интоксикации психотропными, комы различного генеза, заболевания ЦНС, сопровождающиеся спазмами или экстрапирамидной симптоматикой (в том числе болезнь Паркинсона), беременность, период лактации, детский возраст (до 3 лет для данной лекарственной формы).

С осторожностью.

Декомпенсированные заболевания сердечно-сосудистой системы (ССС) (в том числе стенокардия, нарушения внутрисердечной проводимости, удлинение интервала Q-T или предрасположенность к этому - гипокалиемия, одновременное применение других лекарственных средств (ЛС), которые могут вызывать удлинение интервала Q-T), алкоголизм и наркомания, состояния в анамнезе, закрытоугольная глаукома, почечная или печеночная недостаточность, гипертрофия (в явлениях гипергликемии), легочно-сердечная и дыхательная недостаточность (в том числе при хронических обструктивных болезнях легких и острых инфекционных заболеваниях), гипертрофия предстательной железы с задержкой мочи, алкоголизм.

Применение при беременности и лактации.

Противопоказан.

Способ применения и дозы.

Внутрь, во время или после еды, запивая полным (240 мл) стаканом воды или молока, начальная доза для взрослых - 0,5 - 5 мг 2 - 3 раза в сутки. При необходимости дозу постепенно увеличивают до достижения желаемого терапевтического эффекта (в среднем - до 10-15 мг, при хронических формах шизофрении - до 20-30 мг). Максимальная доза - 100 мг/сут. Продолжительность лечения - 2 - 3 месяца. Снижают дозу медленно, поддерживающая доза - 5-10 мг/сут.

Пожилым или ослабленным пациентам в начале лечения назначают внутрь по 0,5 - 2 мг 2 - 3 раза в сутки.

При необходимости применения 0,5 мг препарата рекомендуется использовать таблетки с меньшей дозировкой.

Детям 3-12 лет (или массой тела 15-40 кг) при психотических расстройствах - внутрь 0,05 мг/кг/сут в 2-3 разделенных дозах; при необходимости с учетом переносимости дозу увеличивают на 0,5 мг 1 раз в течение 5-7 дней до общей дозы 0,15 мг/кг/сут. При непсихотических нарушениях поведения, болезни Туретта - внутрь, в начале 0,05 мг/кг/сут в 2-3 разделенных дозах, затем дозу увеличивают на 0,5 мг 1 раз в 5-7 дней до 0,075 мг/кг/сут. При тиках, рвоте - внутрь 0,025-0,05 мг/кг/сут. Для назначения препарата в детском возрасте предпочтительно использовать лекарственные формы для детей, позволяющие точно дозировать препарат.

При отсутствии эффекта в течение 1 месяца лечения продолжать не рекомендуется.

Побочное действие.

Со стороны нервной системы: головная боль, головокружение, бессонница или сонливость (различной степени выраженности), состояние беспокойства, тревога, психомоторное возбуждение, страх, апатия, эйфория, депрессия, эпилептические припадки, в редких случаях обострение психоза, в т.ч. галлюцинаций; экстрапирамидные расстройства: при длительной терапии - поздняя дискинезия (причмокивание и сокращение губ, надувание щек, быстрые, червообразные движения языка, неконтролируемые жевательные движения, неконтролируемые движения рук и ног), поздняя дистония (учащенное моргание или спазм век, необычное выражение лица или положение тела, неконтролируемые метаболизмы дергания шеи, туловища, рук и ног) и злокачественный нейролептический синдром (гипертермия, мышечная ригидность, нарушение сознания, учащенное дыхание, тахикардия, эрекция, повышение или снижение артериального давления (АД), повышенное потоотделение, недержание мочи, судорожные расстройства, угнетение сознания).

Со стороны сердечно-сосудистой системы: при использовании в высоких дозах - снижение АД, ортостатическая гипотензия, аритмия, тахикардия, изменения на ЭКГ (удлинение интервала Q-T, признаки трепетания и мерцания желудочков).

Со стороны дыхательной системы: при

применении в высоких дозах - снижение аппетита, сухость во рту, гиперсаливация, тошнота, рвота, диарея или запоры, нарушение функции печени, вплоть до развития желтухи.

Со стороны органов кроветворения: редко - временная лейкопения или лейкоцитоз, агранулоцитоз, эритроцитопения и тенденция к лейкоцитозу.

Со стороны мочеполовой системы: задержка мочи (при гиперплазии предстательной железы), периферические отеки, боли в грудных железах, гинекомастия, гиперпролактинемия, нарушение менструального цикла, снижение потенции, повышение либидо, приапизм.

Со стороны органов чувств: катаракта, ретинопатия, нечеткость зрения.

Аллергические реакции: макулопапулезные и эксфолиативные изменения кожи, фотосенсибилизация, редко - бронхоспазм, ларингоспазм.

Лабораторные показатели: гипонатриемия, гипер- или гипогликемия.

Прочие: аллергия, увеличение массы тела.

Передозировка.

Симптомы: угнетение сознания, миоклонус мышц, тремор, возбудимость, снижение АД, иногда - повышение АД. В тяжелых случаях - кататоническое состояние, угнетение дыхания, шок.

Лечение: при приеме внутрь - промывание желудка, активированный уголь.

При угнетении дыхания - ИВЛ. Для улучшения кровообращения внутривенно вводят плазму или раствор альбумина, норадреналин. Эпинефрин в этих случаях применять категорически запрещается! Для уменьшения экстрапирамидных симптомов - центральные холиноблокаторы и противопаркинсонические ЛС. Диализ неэффективен.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами.

Повышает выраженность угнетающего влияния на ЦНС этанола, трициклических антидепрессантов, опиоидных анальгетиков, барбитуратов и снотворных ЛС, средств для общей анестезии. Усиливает действие периферических М-холиноблокаторов и большинства гипотензивных средств (снижает действие гуанетидина вследствие истощения его из альфа-адренергических нейронов и подавления его захвата этими нейронами).

Тормозит метаболизм трициклических антидепрессантов и ингибиторов МАО, при этом увеличивается (важно) их седативный эффект и токсичность.

При одновременном применении с бутирофеноном снижает эпилептогенный порог и увеличивает риск возникновения больших эпилептических припадков.

Уменьшает эффект противосудорожных средств (снижение судорожного порога галоперидолом).

Ослабляет сосудосуживающее действие допамина, фенилэфрина, норадреналина, эфедрина и эпинефрина (блокада альфа-адреноцепторов галоперидолом, что может привести к извращению действия эпинефрина и к чрезмерному снижению АД).

Снижает эффект противопаркинсонических средств (антагонистическое влияние на дофаминергические структуры ЦНС).

Ингибирует (может повышать или снижать) эффект антикоагулянтов.

Уменьшает действие бромокриптина (может потребоваться коррекция дозы).

При применении с метилдопой увеличивает риск развития психических нарушений (в том числе дезориентацию в пространстве, замедление и затруднение процессов мышления).

Амфетамины снижают антипсихотическое действие галоперидола, который, в свою очередь уменьшает их психостимулирующий эффект (блокада галоперидолом альфа-адренорецепторов).

Антипсихотические, снотворные (гипнотики) и противоэпилептические ЛС могут усиливать миелоблокирующее влияние галоперидола и снижать его антипсихотическое действие (может потребоваться коррекция дозы).

Длительное назначение карбамазепина, барбитуратов и других индукторов микросомального окисления снижает концентрацию галоперидола в плазме.

В сочетании с препаратами лития (особенно в высоких дозах) возможно развитие энцефалопатии (может вызвать необратимую нейротоксичность), а также экстрапирамидной симптоматики.

При одновременном приеме 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 экстрапирамидных расстройств.

Употребление кофе или чая (особенно в больших количествах) снижает действие галоперидола.

Особые указания.

В течение терапии больным следует регулярно осуществлять контроль за ОХТ, формулой крови, "печеночными" пробами.

При развитии поздней дискинезии рекомендуется постепенное снижение дозы (вплоть до полной отмены препарата).

Необходимо соблюдать осторожность при выполнении любой физической работы, принятии горячей ванны (возможно развитие теплового удара, вследствие подавления чувствительности к периферической терморегуляции в жаркой среде).

Во время лечения не следует принимать "противопростудные" бензодиазепиновые ЛС (возможно усиление антихолинергических эффектов и риск возникновения теплового удара).

Следует защищать открытые участки кожи от избыточного солнечного излучения вследствие повышенного риска фотосенсибилизации.

Лечение прекращают постепенно во избежание развития синдрома "отмены".

Противорвотное действие может маскировать признаки лекарственной токсичности и затруднять диагностику состояний, первым симптомом которых является тошнота.

Отмечено, что дозы для детей 6 лет могут вызывать дополнительное улучшение при нарушениях поведения и тиках.

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

Форма выпуска

Таблетки 1,5 мг и 5 мг.

По 10, 50 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 10, 20, 30, 40, 50 или 100 таблеток в банки из полиэтилентерефталата для лекарственных средств или полипропиленовые для лекарственных средств, укупоренные крышками из полиэтилена высокого давления с контролем первого вскрытия или крышками полипропиленовыми с системой «пломбирование», или крышками из полиэтилена низкого давления с контролем первого вскрытия.

Одну банку или 1, 2, 3, 4, 5, 6, 8 или 10 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению помещают в пачку.

Условия хранения

В защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года. Не использовать после истечения срока годности.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Держатель регистрационного удостоверения и производитель

Держатель РУ: **ООО «Озон»**

Юридический адрес: 446351, Россия, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Песочная, д. 1

Производитель, ответственный за выпускающий контроль качества: **ООО «Озон»**, Россия, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6

Все претензии потребителей следует направлять представителю держателя регистрационного удостоверения:

ООО «Озон»

446351, Россия, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.

Тел.: +7987459991, +7987459992

E-mail: ozon@ozon-pharm.ru