

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
ГАЛОПЕРИДОЛ ДЕКАНОАТ
(HALOPERIDOL DECANOATE)

Загальна характеристика:

міжнародна назва: галоперидол;

основні фізико-хімічні властивості: жовтий або зеленувато-жовтий прозорий розчин, вільний від часток;

склад: 1 мл розчину містить галоперидолу 50 мг (у вигляді галоперидолу деканоату 70,52 мг);

допоміжні речовини: спирт бензиловий, олія кунжутна.

Форма випуску. Розчин для ін'єкцій.

Фармакотерапевтична група. Антипсихотичні засоби. Похідні бутирофенону.

Код АТС N05A D01.

Фармакологічні властивості. *Фармакодинаміка.* Галоперидол деканоат відноситься до нейролептиків - похідних бутирофенону. Галоперидол деканоат є ефіром галоперидолу і деканової кислоти. При внутрішньом'язовому введенні в ході повільного гідролізу відбувається вивільнення галоперидолу, який потім потрапляє в кровообіг. Галоперидол є вираженим антагоністом центральних дофамінових рецепторів і відноситься до сильних нейролептиків.

Галоперидол високоефективний при лікуванні галюцинацій і марення, завдяки безпосередній блокаді центральних дофамінових рецепторів (діє, ймовірно, на мезокортикальні і лімбічні структури). Галоперидол також впливає на базальні ганглії (нігростріарні вузли).

Чинить виражену заспокійливу дію при психомоторному збудженні, ефективний при манії та інших ажитаціях.

За рахунок впливу на лімбічну систему препарат володіє седативним ефектом, ефективний як додатковий засіб при хронічному болю.

Вплив на базальні ганглії викликає екстрапірамідні побічні реакції (дистонію, акатизію, паркінсонізм).

Виражена периферична антидофамінова активність супроводжується протинудотним і протиблювотним ефектами (діє через хеморецептор тригер зони), розслабленням гастроінтестинального сфінктера і підвищеним вивільненням пролактину (блокує пролактин інгібуючий фактор в аденогіпофізі).

У соціально замкнених хворих нормалізується соціальна поведінка.

Фармакокінетика. Концентрація галоперидолу в плазмі, що вивільняється з депо галоперидолу деканоату після внутрішньом'язової ін'єкції, досягає максимуму через 3-9 днів. Період напіввиведення становить близько 3 тижнів. При регулярному щомісячному введенні стадія насичення в плазмі досягається через 2-4 місяці. Фармакокінетика галоперидолу деканоату після внутрішньом'язового введення має дозозалежний характер. При дозах нижче 450 мг має місце пряма залежність між дозою і концентрацією галоперидолу в плазмі. Для досягнення терапевтичного ефекту необхідна концентрація галоперидолу в плазмі 4 - 20-25 мкг/л. Галоперидол легко проникає через гематоенцефалічний бар'єр. 92 % зв'язується з білками крові, виводиться каловими масами (60 %) і сечею (40 %), де приблизно 1 % у незмінному вигляді.

Показання для застосування. Хронічна шизофренія та інші психози, особливо, коли лікування галоперидолом швидкої дії було ефективним і є необхідність у застосуванні сильнодіючого нейролептика зі слабо вираженою седативною дією.

Порушення розумової діяльності та поведінки, що відбуваються з психомоторною ажитацією і вимагають тривалого лікування.

Спосіб застосування та дози. *Призначений тільки для дорослих! Допускаються тільки внутрішньом'язові ін'єкції! Забороняється вводити внутрішньовенно!*

Разову місячну дозу препарату рекомендується вводити глибоко в область сідничних м'язів. Не бажано вводити препарат в дозі, об'єм якої перевищує 3 мл, щоб уникнути неприємного відчуття розпирання в місці ін'єкції.

Дорослим: пацієнтам, що перебувають на тривалому лікуванні пероральними антипсихотичними засобами (головним чином, галоперидолом), можна рекомендувати перехід на депо-ін'єкції.

Дозу слід підбирати індивідуально. Підбір дози повинен проводитися при суворому нагляді лікаря за хворим. Початкову дозу вибирають із урахуванням симптоматики захворювання, її тяжкості, дози галоперидолу або інших нейролептиків, що призначалися в ході попереднього лікування.

На початку лікування кожні 4 тижні рекомендується призначати дози, які в 10-15 разів перевищують дози галоперидолу, який вводять перорально, що зазвичай становить для дорослих 25-75 мг (0,5-1,5 мл) галоперидолу деканоату. Максимальна початкова доза не повинна перевищувати 100 мг галоперидолу деканоату.

Залежно від ефекту, дозу можна підвищувати поступово, на 50 мг, до одержання оптимального ефекту. Як правило, підтримуюча доза відповідає 20-кратній добовій дозі галоперидолу, який вводять перорально. При поновленні симптомів основного захворювання в період підбору дози, лікування галоперидолом деканоатом можна доповнити галоперидолом, який приймають перорально.

Зазвичай ін'єкції вводять 1 раз в 4 тижні, однак, враховуючи значні індивідуальні розходження в ефективності, може знадобитися більш часте застосування препарату.

Літнім хворим і хворим на олігофренію рекомендується менша початкова доза, наприклад, по 12,5-25 мг галоперидолу деканоату 1 раз у 4 тижні. Надалі, залежно від отриманого ефекту, дозу можна збільшувати.

Побічна дія. Побічні дії, що розвиваються під час лікування галоперидолом деканоатом, обумовлені дією галоперидолу.

Як при будь-якій ін'єкції, у місці уколу можуть виникати місцеві реакції.

Екстрапірамідні симптоми: тремор, м'язова ригідність, слинотеча, брадикінезія, акатизія, гостра дистонія, окулогірний криз, ларингеальна дистонія.

У таких випадках можна застосовувати антихолінергічні препарати, однак в жодному разі, не з профілактичною метою, оскільки вони знижують ефективність галоперидолу деканоату.

Пізня дискінезія: подібно іншим антипсихотичним засобам, в окремих випадках тривале лікування галоперидолом деканоатом або припинення лікування ним може спричинити розвиток пізньої дискінезії. Синдром характеризується мимовільними ритмічними посмикуваннями м'язів язика, обличчя, рота або підборіддя, іноді постійного характеру. Поновлення терапії, підвищення дози, заміна препарату на інший антипсихотичний засіб можуть замаскувати синдром. При появі цих явищ лікування слід припинити якомога швидше.

Злоякісний нейролептичний синдром (ЗНС): подібно до інших антипсихотичних засобів галоперидол деканоат може спричинити розвиток цієї рідкісної ідіосинкразійної реакції, що характеризується гіпертермією, генералізованою ригідністю м'язів, вегетативною лабільністю і порушенням свідомості. Ранньою ознакою ЗНС часто є гіпертермія. При розвитку ЗНС лікування антипсихотичним засобом слід негайно припинити, встановити ретельне спостереження за станом хворого і проводити підтримуючу терапію.

Інші побічні явища з боку центральної нервової системи (ЦНС): іноді депресія, седативний ефект, ажитація, сонливість, безсоння, головний біль, затьмарення свідомості, запаморочення, епілептичні припадки типу grand mal, поновлення психотичних симптомів.

Шлунково-кишковий тракт: іноді нудота, блювання, зниження апетиту, диспепсія, зниження або підвищення маси тіла.

Ендокринна система: гіперпролактинемія (галакторея, гінекомастія, оліго- або аменорея), дуже рідко гіпоглікемія, зниження секреції антидіуретичного гормону.

Серцево-судинна система: в окремих випадках тахікардія, гіпотензія, зрідка - подовження інтервалу

QT і/або шлунокова аритмія (частіше при застосуванні високих доз і наявності схильності до порушень з боку серцево-судинної системи).

Інші: в окремих випадках невелика і найчастіше тимчасова лейкопенія; рідко агранулоцитоз, тромбоцитопенія (зазвичай при одночасному застосуванні інших лікарських засобів); в окремих випадках порушення печінкової функції, гепатит (найчастіше холестатичний); рідко реакції підвищеної чутливості (кропив'янка, висипи, анафілаксія і фотосенсибілізація); іноді запор, нечіткість зору, сухість у роті, затримка сечі, пріапізм, порушення ерекції, периферичні набряки, підвищене потовиділення, слинотеча, печія, порушення терморегуляції; у літніх пацієнтів можуть спостерігатися напади закритокутової глаукоми.

Протипоказання. Підвищена чутливість до будь-якого із компонентів препарату. Коматозний стан. Пригнічення діяльності центральної нервової системи, спричинене лікарськими засобами або алкоголем. Хвороба Паркінсона. Ураження базальних гангліїв. Дитячий вік.

Передозування. Можливість виникнення передозування при парентеральному введенні препарату тривалої дії *Галоперидолу деканоату* значно менша, ніж при застосуванні пероральної лікарської форми.

При підозрі на передозування *Галоперидолом деканоатом* слід враховувати пролонгований характер дії препарату.

Симптоми: розвиток відомих фармакологічних ефектів і побічних дій у більш вираженій формі.

Симптоми, що представляють найбільшу небезпеку: екстрапірамідні реакції, зниження артеріального тиску, седативний ефект. Екстрапірамідні реакції проявляються у вигляді м'язової ригідності і загального або локалізованого тремору. Частіше можливе підвищення артеріального тиску, ніж зниження його. У виняткових випадках - розвиток коматозного стану із пригніченням дихання і артеріальною гіпотензією, що переходить у шокоподібний стан. Можливе подовження інтервалу QT з розвитком шлуночкових аритмій.

Лікування: специфічного антидоту не існує. Прохідність дихальних шляхів хворого в комі забезпечують за допомогою орофарингеального або ендотрахеального зонда, при пригніченні дихання може знадобитися штучна вентиляція легенів. Проводять моніторинг життєво важливих функцій і ЕКГ до повної нормалізації її, лікування тяжких аритмій відповідними протиаритмічними засобами. При зниженому артеріальному тиску і недостатності кровообігу необхідні внутрішньовенне введення достатньої кількості рідини, плазми або концентрованого альбуміну, а також застосування вазопресорних засобів - допаміну або норадреналіну. Не слід застосовувати адреналін, тому що в результаті взаємодії з галоперидолом деканоатом він може спричинити екстремальну гіпотензію. При тяжких екстрапірамідних розладах необхідно застосовувати антипаркінсонічні засоби антихолінергічної дії (наприклад, 1-2 мг бензотропіну мезилату внутрішньовенно або внутрішньом'язово) протягом декількох тижнів (можливе поновлення симптомів після відміни цих препаратів!).

Особливості застосування. Спостерігали окремі випадки раптової смерті хворих з психіатричними розладами, які приймали антипсихотичні засоби. У випадку схильності до подовження інтервалу QT (синдром QT, гіпокаліємія, застосування ліків, що пролонгують QT) під час лікування галоперидолом деканоатом слід дотримуватися обережності у зв'язку з ризиком подовження QT.

Лікування слід починати із застосування перорального галоперидолу і лише потім переходити до ін'єкцій галоперидолу деканоату для виявлення непередбачуваних побічних реакцій.

У зв'язку з тим, що метаболізм препарату здійснюється в печінці, необхідно з обережністю застосовувати галоперидол при тяжкій печінковій патології. При тривалому лікуванні необхідний регулярний контроль функції печінки і картини крові.

В одиничних випадках галоперидол деканоат спричиняв судоми. Лікування хворих на епілепсію або хворих, у яких має місце підвищена схильність до судомних станів (наприклад, черепно-мозкова травма в анамнезі, синдром відміни при алкоголізмі), потребує обережності.

Тироксин підсилює токсичність галоперидолу деканоату. Лікування галоперидолом деканоатом хворих, які страждають на гіпертиреоз, припустимо лише при проведенні відповідного тиреостатичного лікування.

При одночасній наявності депресії і психозу або при домінуванні депресії галоперидол деканоат призначають разом з антидепресантами.

При одночасному проведенні антипаркінсонічної терапії, після закінчення лікування галоперидолом деканоатом, її слід продовжити ще на кілька тижнів, оскільки елімінація антипаркінсонічних засобів відбувається швидше.

Застосування під час вагітності та годування груддю. Дослідження, проведені із залученням великої кількості хворих, свідчать про те, що галоперидол деканоат не спричиняє істотного збільшення частоти пороків розвитку. В декількох окремих випадках уроджені пороки розвитку спостерігалися при застосуванні під час вагітності галоперидолу деканоату одночасно з іншими лікарськими засобами. Призначення галоперидолу деканоату під час вагітності можливе лише у випадку, якщо очікувані переваги однозначно перевищують можливий тератогенний ефект.

Галоперидол деканоат проникає в грудне молоко. При лікуванні галоперидолом деканоатом, користь від лікування повинна однозначно превалювати над можливою шкодою. У деяких випадках у грудних дітей спостерігали розвиток екстрапірамідних симптомів при прийманні препарату матір'ю, яка годує.

Вплив на здатність керувати автотранспортом або працювати зі складними механізмами. У початковому періоді лікування галоперидолом деканоатом забороняється керувати автомобілем і виконувати роботи, пов'язані з підвищеним ризиком травматизму. Надалі ступінь заборони визначається на підставі індивідуальної реакції хворого.

Під час лікування галоперидолом деканоатом забороняється вживати спиртні напої.

На початку лікування препаратом і особливо під час застосування високих доз, можлива поява седативного ефекту різного ступеня виразності зі зниженням уваги, що може посилюватися вживанням алкоголю.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами. Галоперидол деканоат, подібно до інших нейролептиків, підсилює центральний інгібуючий ефект депресантів (алкоголь, снодійні, заспокійливі, сильнодіючі анальгетики) на центральну нервову систему. Одночасне застосування з ними галоперидолу деканоату може призвести до пригнічення дихання.

Одночасне застосування разом з метилдопою може підсилити ефект її дії на центральну нервову систему. Галоперидол деканоат знижує антипаркінсонічну дію леводопи.

Галоперидол гальмує метаболізм трициклічних антидепресантів, підвищуючи їх концентрацію у плазмі із посиленням антихолінергічної дії та кардіоваскулярної токсичності.

У фармакокінетичних дослідженнях хінідин, буспірон, флуоксетин спричиняли невелике або помірне підвищення концентрації галоперидолу деканоату в плазмі; у таких випадках може знадобитися зниження дози галоперидолу деканоату.

Тривале застосування ензим-індукторів (карбамазепін, фенобарбітал, рифампіцин) значно знижує концентрацію галоперидолу деканоату в крові: може знадобитися збільшення дози галоперидолу деканоату, а після відміни ензим-індуктора - зниження дози галоперидолу.

У декількох випадках одночасне застосування галоперидолу деканоату з літєм супроводжувалося розвитком енцефалопатії, екстрапірамідних симптомів, пізньої дискінезії, злоякісного нейролептичного синдрому, стовбурових симптомів, гострого мозкового синдрому і коми. Більшість симптомів мало оборотний характер. Причина їхнього розвитку невідома. З появою подібних реакцій слід негайно припинити застосування галоперидолу.

Галоперидол може знижувати ефективність лікування антикоагулянтном феніндіоном.

Галоперидол може нівелювати дію епінефрину та інших симпатоміметиків, а також змінювати гіпотензивний ефект адреноблокаторів (наприклад, гуанетидину).

Умови та термін зберігання. Зберігати при температурі 15-30 °С, у захищеному від світла місці
Препарат зберігати в недоступному для дітей місці!

Термін придатності - 5 років.

Умови відпустку. За рецептом.

Упаковка. 1 мл (50 мг) розчину в ампулі; 5 ампул у картонній коробці.

Виробник. ВАТ «Гедеон Ріхтер».

Адреса. Н-1103, Будапешт, вул. Демреї, 19-21, Угорщина.