

ГАЛОПЕРИДОЛ

1. Галоперидол.
2. Апо-Галоперидол, Галоперидол, Галоперидол деканоат, Галоперидол форте, Галоперидол – Акри, Галоперидол – Ра-тиофарм, Галоперидола – РОС, Сенорм.
3. Средства, влияющие на центральную нервную систему (Антипсихотические средства).
4. Устраняет стойкие изменения личности, бред, галлюцинации, мании, усиливает интерес к окружающему. Эффективен у пациентов, резистентных к другим нейролептическим средствам. Оказывает некоторое активирующее действие.
5. Уровень убедительности доказательств А. Эффективен при лечении маниакальных состояний, для купирования психомоторного возбуждения различного генеза. Доказан эффект при лечении шизофрении в отношении коррекции поведения. При деменции применение галоперидола не продемонстрировало эффекта в отношении коррекции поведенческих нарушений. Новые нейролептики – локсапин, пимозид, оланзапин, кветиапин, рисперидон, сульпирид, тиоридазин по эффективности не уступают галоперидолу, и имеют менее выраженный профиль побочных эффектов.
6. Цена за 1 таблетку (5 мг) от 0,29 до 0,95 руб.[1]; 0,29 руб.[2]; 8,12 руб.[3].
7. Блокирует постсинаптические дофаминергические рецепторы, расположенные в мезолимбической системе (антипсихотическое действие), гипоталамусе (гипотермический эффект и галакторея), триггерной зоне рвотного центра, экстрапирамидной системе; угнетает центральные α -адренергические рецепторы. Тормозит высвобождение медиаторов, снижая проницаемость пресинаптических мембран, нарушает обратный нейрональный захват и депонирование. Влияет на вегетативные функции (снижает тонус полых органов, моторику и секрецию желудочно-кишечного тракта, устраняет спазмы сосудов) при заболеваниях, сопровождающихся возбуждением, беспокойством, страхом смерти. Длительный прием сопровождается изменением эндокринного статуса, в передней доле гипофиза увеличивается продукция пролактина и снижается - гонадотропных гормонов. При приеме внутрь всасывается около 70%. Связывание с белками плазмы крови - 92%. Интенсивно распределяется в ткани, т.к. легко проходит гистогематические барьеры, включая гематоэнцефалический барьер. Метаболизируется в печени, подвергается печеночной рециркуляции. После перорального приема концентрация в плазме ниже, чем после в/м введения, из-за "первого прохождения" через печень и к тому же может варьировать в широких пределах. Строгой взаимосвязи между концентрацией в плазме и эффектами не установлено. $T_{1/2}$ составляет 13-40 ч. Выводится с мочой, желчью и фекалиями, проникает в грудное молоко. После в/м введения пролонгированной лекарственной формы (галоперидола деканоата) происходит медленная и постоянная абсорбция галоперидола за счет либерации из депо. Концентрация его в плазме постепенно растет, достигая пика через 6 дней после инъекции, и затем снижается с $T_{1/2}$ в течение 3 недель. Равновесная плазменная концентрация достигается после 3-4 инъекций.
8. Психомоторное возбуждение различного генеза (мания, деменция, олигофрения, психопатия, острая и хроническая шизофрения, хронический алкоголизм), бред и галлюцинации (параноидальные состояния, острый психоз), синдром Туретта, хорея Гентингтона, неукротимая рвота, психосоматические нарушения, расстройства поведения в пожилом и детском возрасте, заикание, длительно сохраняющиеся и устойчивые к терапии рвота и икота.
9. Гиперчувствительность (в т.ч. и к другим производным бутирофенона, кунжутному маслу), заболевания центральной нервной системы, сопровождающиеся пирамидной и экстрапирамидной симптоматикой (за исключением синдрома Туретта, хореи Гентингтона), депрессия, истерия, кома, беременность, вскармливание грудью, возраст до 3 лет (для парентерального введения).
10. Уменьшение психомоторного возбуждения, купирование бреда, галлюцинаций, агрессивного поведения, купирование рвоты.
11. При острых психозах взрослым - 5-10 мг в/м или в/в с возможным одно- или двукратным повторным введением через 30-40 мин (максимальная суточная доза - 30-40 мг). При остром алкогольном психозе - в/в 5-10 мг (повторяя при необходимости), в случае алкогольного делирия - в/в 10-20 мг со скоростью 5-10 мг/мин. Таблетки и раствор для приема внутрь взрослым назначают в средней суточной дозе 2,25 - 18 мг, увеличивая ее до получения устойчивого терапевтического эффекта, с последующим переходом к более низкой, поддерживающей дозе. При лечении психозов у детей до 5 лет начинают с 2 капель раствора для приема внутрь 2 раза в сутки, у детей старше 5 лет - 5 капель 2 раза в сутки с возможным увеличением дозы до достижения эффекта. При отсутствии клинического улучшения в течение 1 мес продолжать терапию не рекомендуется. DDD=8 мг (перорально, парентерально).
12. **Симптомы:** выраженные экстрапирамидные нарушения, артериальная гипотензия, сонливость, заторможенность, в тяжелых случаях - коматозное состояние, угнетение дыхания, шок.
Лечение: специфического антидота нет. Возможно промывание желудка, последующее назначение активированного угля (если передозировка связана с приемом внутрь). При угнетении дыхания – искусственная вентиляция легких, при выраженном снижении артериального давления - введение плазмозамещающих жидкостей, плазмы, норадrenalина (но не адреналина!), для уменьшения выраженности экстрапирамидных расстройств - центральные холиноблокаторы и противопаркинсонические средства.
13. Отмена терапии должна быть постепенной и контролируемой со стороны врача.
При развитии поздней дискинезии рекомендуется постепенное снижение дозы (вплоть до полной отмены).
14. Противопоказано при беременности.
Категория влияния на плод – C (FDA)
(http://www.drugbank.ca/drugBank/drugStructureFile/drug_files/fda_labels/DB00502.pdf
<http://www.fda.gov/cder/foi/label/2007/015923s078,018701s053lbl.pdf>).
На время лечения следует прекратить грудное вскармливание.
15. Головная боль, бессонница, или сонливость (особенно в начале лечения), возбуждение, беспокойство, тревога, страх, эйфория или депрессия, летаргия, приступы эпилепсии, экзальтация психоза и галлюцинации. При более длительном применении - экстрапирамидные нарушения (повышение мышечного тонуса, тремор, акинезия), в т.ч. поздняя дистония и злокачественный нейролептический синдром, сопровождаемый гипертермией, мышечной ригидностью, потерей сознания. При использовании в высоких дозах - гипосаливация, тошнота, рвота, запор или диарея, артериальная гипотензия, тахикардия, аритмия, изменения ЭКГ, иногда - нарушения функции печени вплоть до развития желтухи, макулопапулезные и акнеобразные изменения кожи; редко - нарушения зрения (в т.ч. остроты), катаракта, ретинопатия, ларингоспазм, бронхоспазм, боль в грудных железах, гинекомастия, нарушение менструального цикла, импотенция, повышение либидо, задержка мочи, приапизм, потливость, алопеция, временная лейкопения или лейкоцитоз, эритроцитопения, гиперпролактинемия, гипер- и гипогликемия, гипонатриемия, фотосенсибилизация.
16. Усиливает эффект антигипертензивных препаратов, опиоидных анальгетиков, антидепрессантов, барбитуратов, алкоголя, ослабляет - непрямых антикоагулянтов. Тормозит метаболизм трициклических антидепрессантов (растет их уровень в плазме) и увеличивает токсичность. При длительном назначении карбамазепина уровень галоперидола в плазме падает (необходимо повысить дозу). В сочетании с литием может вызвать синдром, подобный энцефалопатии.

17. Не применяется.

18. Во время терапии пациентам необходимо воздержаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания, быстрых психических и двигательных реакций. Самостоятельная отмена терапии не допустима. В период лечения исключается прием алкоголя.

19. Пациент должен дать согласие на лечение возможных осложнений.

20. Таблетки 1, 2, 5, 10 мг; раствор для инъекций (ампулы) 5 мг/мл; таблетки 1,5 мг (блистеры); капли для приема внутрь (флаконы) 2 мг/мл – 10, 30, 100 мл; раствор для инъекций масляный (ампулы) 50 мг/мл; таблетки (упаковки ячейковые контурные) 0,25, 1,5, 5 мг; раствор для внутримышечного введения (ампулы) 0,5% - 1 мл.

Фирмы: Apotex Inc., Канада; Gedeon Richter Ltd., Венгрия; Polfa, Warsaw Pharmaceutical Works, Польша; Zdravije Pharmaceutical and Chemical Works, Югославия; Hemofarm D.D., Югославия; Weimer Pharma GmbH, Германия; Мосхимфармпрепараты ФГУП им. Н.А. Семашко, Россия; Ratiopharm GmbH, Германия; Sun Pharmaceutical Industries Ltd., Индия.

21. Список Б. Препарат следует хранить при комнатной температуре. Срок годности 2 года.

Хранить в недоступном для детей месте.