

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА**1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ****HALOPERIDOL SOPHARMA 5 mg/ml** инжекционен разтвор**ХАЛОПЕРИДОЛ СОФАРМА 5 мг/мл** инжекционен разтвор**2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ**

В една ампула (1 мл) инжекционен разтвор се съдържа лекарствено вещество халоперидол (*haloperidol*) 5 мг.

За пълния списък на помощните вещества: виж т. 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Инжекционен разтвор

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ**4.1 Терапевтични показания**

Халоперидол е показан за лечение на психози от различен произход, протичащи с психомоторна възбуда.

- Остра и обострена хронична пизофрения, протичаща с богата психотична продукция – налудности, халюцинации; страхова възбуда; диссолутивни прояви – мисловна разкъсаност, неадекватно поведение.
- Други нешизофренни психози (особено параноидни).
- Маниен синдром.
- Ажитирана и налудна депресия с дисфоричен афект.
- Делир от различен произход, протичащ с остра психотична симптоматика - при травматични, възпалителни и органични увреждания на главния мозък, чернодробни, бъбречни, сърдечни и белодробни заболявания, инфекциозни заболявания с фебрилитет и бактериална интоксикация; отравяния (алкохол); недоимъчни състояния; хормонални нарушения.
- Като антиеметично средство при гадене и повръщане.

4.2 Дозировка и начин на приложение

Дозировката и продължителността на лечение се определят индивидуално според характера и тежестта на заболяването и поносимостта на пациента към

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО	
Приложение към разрешение за употреба № 11-15904/29.12.06	
309/19.12.2006	<i>Меню</i>



HALOPERIDOL SOPHARMA sol. inj. 5 mg/ml

продукта. Халоперидол трябва да се прилага в минимална доза, достатъчна за контрол на клиничните прояви. След овладяване на острата симптоматика се препоръчва лечението да продължи с перорално приложение.

Психози:

При остри психози халоперидол се прилага по 2-5 мг дълбоко мускулно. Ако е необходимо, дозата може да се повтори през 1-часови интервали или през 4-8-часови интервали, докато се постигне контрол на състоянието. Максималната дневна доза е 15-20 мг (3-4 ампули).

За бързо повлияване на остри психози халоперидол може да се приложи и бавно интравенозно, по 5 мг за минута. При необходимост дозата се повтаря след 30 минути. Алтернативно приложение: може да се разрежи в 30-50 мл инфузионен разтвор и се въвежда интравенозно под формата на инфузия за 30 минути.

Галене и повръщане:

По 1 ампула (5 мг) дълбоко мускулно. Дозата може да се приложи и в интравенозна инфузия.

Пациенти в напреднала възраст (над 65 г.)

При възрастни хора се препоръчва редуция на дозата поради забавеното метаболизиране на халоперидол и повишен риск от развитие на екстрапирамидна симптоматика. Лечението трябва да започне с половината от обичайната доза, последвана от постепенно титриране до постигане на оптимален ефект.

Деца

Парентерално приложение на халоперидол при деца не се препоръчва.

Прекратяване на терапията:

Прекратяването на лечението с халоперидол следва да се извършва с постепенно намаляване на дозите, тъй като рязкото му преустановяване може да доведе до повторна поява на психотична симптоматика.

4.3 Противопоказания

- Свръхчувствителност към активното или помощните вещества;
- Коматозни състояния, депресия на централната нервна система от употреба на алкохол и други депресанти, лезии на базалните ганглии;
- Болест на Паркинсон;



- Тежки сърдечно-съдови заболявания, удължен QT-интервал, анамнеза за пристъпи от вентрикуларна тахиаритмия или Torsades de pointe, брадикардия, AV-блок II-III степен, некоригирана хипокалиемия, съпътстващо лечение с продукти, удължаващи QT-интервала;
- Тежки чернодробни и бъбречни увреждания;
- Бременност и кърмене.

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

- Необходимостта от приложение на халоперидол трябва внимателно да се прецени при пациенти с повишен риск от поява на камерна тахиаритмия като: пациенти с налични сърдечни заболявания; фамилна анамнеза за внезапна смърт; пациенти с некоригирани електролитни нарушения; със субарахноидален кръвоизлив; при гладуване; злоупотреба с алкохол. Преди започване на лечение с халоперидол се препоръчва ЕКГ контрол при всички пациенти, особено тези с данни за нарушения в кардиологичния статус. При удължаване на QT-интервала по време на терапията се налага редукция на дозата; ако QT-интервалът надвиши 500 msec приложението на халоперидол се прекратява. Препоръчва се периодичен контрол на нивата на електролитите в кръвта, особено при пациенти, които са на лечение с диуретици.
- При шизофрения ефектът от антипсихотичното лечение може да настъпи по-късно. След спиране на терапията е възможно замъгляване на симптомите на заболяването за период от седмици до месеци. Подобно на другите антипсихотични продукти халоперидол не трябва да се прилага самостоятелно при състояния, при които преобладава депресивна симптоматика. В тези случаи се препоръчва едновременно лечение с антидепресанти.
- В редки случаи при рязко спиране на лечението с високи дози халоперидол са възможни гадене, повръщане, инсомния. Препоръчва се прекратяването на лечението да се извършва с постепенно намаляване на дозите, тъй като рязкото му преустановяване може да доведе до повторна поява на психотична симптоматика.
- Ако се налага съпътстващо лечение с антипаркинсонов продукт с по-кратък период на полуелиминиране, неговият прием трябва да продължи след спиране



HALOPERIDOL SOPHARMA sol. inj. 5 mg/ml

на лечението с халоперидол. Ако прилагането на двата продукта бъде преустановено едновременно е възможно развитие на екстрапирамидна симптоматика. При едновременно приложение на халоперидол с антихолинергични продукти се препоръчва контрол на вътреочното налягане, особено при пациенти с глаукома.

- Антиеметичният ефект на халоперидол може да затрудни диагнозата на заболявания, съпроводени с гадене и повръщане.
- При хипертиреозидизъм се усилва невротоксичността на антипсихотичните продукти. Препоръчва се строг контрол на тиреоидния статус при тези пациенти и приложението на халоперидол да се осъществява в комбинация с подходящо тиреостатично лечение.
- Халоперидол следва да се прилага с повишено внимание при следните състояния:
 - Нарушения във функциите на черния дроб и бъбреците поради забавен метаболизъм/екскреция на продукта.
 - Епилепсия и други рискови състояния за поява на гърчове (лечение на алкохолизъм, мозъчни увреждания), тъй като халоперидол понижава епилептичния праг и може да предизвика пристъпи на гърчове.
 - При пациенти в напреднала възраст халоперидол в отделни случаи може да предизвика екстремна седация.
- По време на лечение с халоперидол не се препоръчва употреба на алкохол или лекарства, съдържащи алкохол.

4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

- Халоперидол усилва потискането на централната нервна система, предизвикано от депресанти, като седативни продукти, сънотворни (барбитурати), общи анестетици, наркотични аналгетици, алкохол.
- Едновременното приложение с ензимни индуктори - карбамазепин, фенобарбитал, рифампицин може да понижи значително плазмената концентрация на халоперидол, което да наложи повишаване на дозата му. След



HALOPERIDOL SOPHARMA sol. inj. 5 mg/ml

спиране приема на тези лекарства е необходима корекция в дозировката на халоперидол.

- Възможно е увеличаване на плазмените нива на халоперидол при едновременната му употреба с хинидин, буспирон, флуоксетин, поради което се препоръчва редукция на дозата му в тези случаи.
- Халоперидол антагонизира ефекта на адреналин и други симпатомиметици и отслабва антихипертензивното действие на антиадренергични лекарства като гванетидин.
- Тъй като халоперидол понижава епилептичния праг и повишава риска от поява на гърчове, може да се наложи повишаване на дозата на едновременно прилаганите с него противоепилептични продукти.
- Халоперидол инхибира чернодробния метаболизъм на трицикличните антидепресанти, в резултат на което се повишават плазмените им концентрации и се засилва антидепресивният ефект и токсичността им (антихолинергични прояви и кардиотоксичност).
- Като блокер на допаминовите рецептори халоперидол антагонизира антипаркинсоновата активност на леводопа и действието на други допаминергични агонисти – амантадин, бромокриптин, лизурид, перголид, каберголин, прамипексол, апоморфин.
- Рискът от поява на вентрикуларни тахиаритмии се увеличава при едновременно приложение на халоперидол с лекарства, които удължават QT-интервала: антиаритмични клас Ia (хинидин, дизопирамид) и клас III (амиодарон, соталол, ибутилид, дофетилид), антихистаминови, противомаларийни или такива, които нарушават електролитния баланс (диуретици).
- При едновременно приложение с литиеви соли е възможно засилване на екстрапирамидните симптоми поради адитивен ефект върху допаминергичната блокада, а при използване на високи дози халоперидол – развитие на тежка интоксикация с главоболие, обърканост, дезориентация, нарушено равновесие, сънливост. Ако се налага едновременното използване на тези продукти, халоперидол трябва да се прилага в минимално ефективна доза, а литиевите



HALOPERIDOL SOPHARMA sol. inj. 5 mg/ml

концентрации да се мониторира. При поява на описаните симптоми, лечението с халоперидол следва да се преустанови незабавно.

- Халоперидол намалява терапевтичния ефект на пероралните антикоагуланти чрез ускоряване на метаболизма и последващо понижаване на плазмените им концентрации.

4.6 Бременност и кърмене

Бременност

Халоперидол преминава през плацентарната бариера. Продуктът е противопоказан по време на бременност, тъй като не е доказана неговата безопасност. Ако неговото приложение е крайно необходимо, той трябва да се използва краткотрайно в минимално ефективна доза. Има данни за фетотоксично и тератогенно действие на халоперидол.

Лактация

Халоперидол се екскретира в майчиното мляко. Не се препоръчва по време на лактация, тъй като може да предизвика екстрапирамидни симптоми у кърмачето. Ако приложението му е крайно необходимо, кърменето трябва да бъде преустановено по време на лечението.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Халоперидол предизвиква седация и влошава активното внимание, затова по време на терапия с него пациентът следва да се въздържа от шофиране и работа с машини.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Нарушения на кръвоносната и лимфната системи

Рядко се наблюдават промени в периферната кръв: лека преходна левкопения или левкоцитоза, агранулоцитоза, тенденция към моноцитоза, тромбоцитопения.

Нарушения на имунната система

Изключително рядко са наблюдавани реакции на свръхчувствителност, включително и анафилаксия.

Нарушения на ендокринната система

Халоперидол може да предизвика хиперпролактинемия, проявяваща се с галакторея, гинекомастия, олиго- или аменорея. Рядко



HALOPERIDOL SOPHARMA sol. inj. 5 mg/ml

хипогликемия, неадекватна секреция на антидиуретичен хормон, нарушения на ерекцията и еякулацията.

Нарушения на нервната система

Това са най-честите нежелани лекарствени реакции при приложение на халоперидол.

Екстрапирамидна симптоматика

Както всички невролептици халоперидол може да предизвика появата на екстрапирамидни симптоми: ригидност, тремор, хиперсаливация, брадикинезия, акатизия, остра дистония, окулогирни кризи, блефароспазъм, дизартрия, дисфагия, хипопнея до апнея при спазъм на дихателната мускулатура.

Тардивна дискинезия

При някои пациенти е възможно развитие на тардивна дискинезия при продължителна терапия или рязко спиране на лечението с халоперидол. Проявява се с неволеви, хореиформни движения на мускулите на главата, крайниците и тялото, които могат да са различни по интензивност, обем и честота на повтаряне. Най-често се засягат оралните мускули, което се проявява с дъвчене, примляскване, кривене на устните и на челостта. По-рядко се наблюдава извиване на шията, на тялото, внезапно свиване на мускулатурата на таза, движения на пръстите, респираторни нарушения.

Невролептичен малигнен синдром

Това е най-тежкото неврологично животозастрашаващо усложнение. Може да се разгърне по всяко време на лечението. Проявява се с кататонна скованост или дискинезии и възбуда, хиперпирексия, повишено артериално налягане, ускорен пулс, повишено потоотделяне. Лабораторно се установява левкоцитоза, повишаване на креатинфосфокиназа, чернодробните ензими, миоглобулинемия и миоглобулинурия. Смъртността е висока, особено ако не се диагностицира рано. Лечението включва незабавно спиране на халоперидол, мониториране на виталните показатели, корекция на електролитния и водния баланс; овладяване на фебрилитета.

Нарушения на автономната нервна система

Възможни са сухота в устата, както и хиперсаливация, замъглено зрение, задръжка на урина и хиперхидроза.



Други нежелани неврологични лекарствени реакции

По време на лечение с халоперидол рядко се съобщава за появата на следните симптоми: обърканост, епилептични припадъци, депресия, седация, повишена възбудимост, сънливост, инсомния, главоболие, световъртеж, обостряне на психотичната симптоматика.

Нарушения на окото

В отделни случаи по време на лечение с халоперидол е възможно развитие на катаракта, ретинопатия и зрителни смущения.

Сърдечни нарушения

Рядко могат да се появят тахикардия и хипотония, предимно при пациенти в напреднала възраст, които са по-чувствителни към седативния и хипотензивен ефект на продукта. Рядко са наблюдавани удължаване на QT-интервала, вентрикуларни тахиаритмии, случаи на внезапна смърт, най-често при прилагане на високи дози при рискови пациенти или бързо венозно приложение.

Респираторни нарушения

В отделни случаи е възможно да се появят ларингоспазъм и бронхоспазъм.

Стомашно-чревни нарушения

Гадене повръщане, загуба на апетит, запек и диспепсия са най-честите гастроинтестинални реакции при употреба на халоперидол.

Хепато-билиарни нарушения

Рядко се проявяват следните нежелани реакции: жълтеница, холестатичен хепатит, преходно нарушение на чернодробните функции.

Нарушения на кожата и подкожната тъкан

Рядко се съобщава за отоци, кожни обриви, уртикария, ексфолиативен дерматит, erythema multiforme, фотосенсибилизация.

4.9 Предозиране**Симптоми**

Предозирането с халоперидол се характеризира с тежки екстрапирамидни симптоми, хипотония, сънливост, в някои случаи и гърчове. Възможно е развитие на коматозно състояние с потискане на дишането и екстремна



HALOPERIDOL SOPHARMA sol. inj. 5 mg/ml

хипотония до шоково състояние. Съществува риск от поява на вентрикуларни тахиаритмии.

Лечение

Няма специфичен антидот. Лечението е симптоматично и поддържащо – кардио-респираторна реанимация, вливания, вазопресорни агенти – допамин, норадреналин, но не и адреналин. Препоръчва се ЕКГ-мониторирание, особено при поява на ритъмни нарушения. При развитие на тахиаритмия се прилагат антиаритмични продукти. При екстрапирамидна симптоматика е показано антипаркинсоново лечение с холинолитици.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

Фармакотерапевтична група: Психолептици, антипсихотици, бутирофенонови производни.

АТС код N05AD01.

5.1 Фармакодинамични свойства

Халоперидол е невролептик от групата на бутирофеноните със силно изразен антипсихотичен, седативен и анксиолитичен ефект. Блокира основно пост- и пресинаптичните D₂-допаминови рецептори в ЦНС. Оказва силен антиеметичен ефект.

5.2 Фармакокинетични свойства

Резорбция: След интрамускулно инжектиране достига максимална плазмена концентрация след 10 до 20 минути.

Разпределение: Свързва се в 90% с плазмените протеини. Бързо се разпределя в тъканите на организма. Премахва хемато-енцефалната и плацентарна бариери.

Метаболизъм: Активно се метаболизира в черния дроб главно чрез окислително дезалкилиране. Инхибира изоензим CYP2D6. Няма активни метаболити.

Елиминиране: При интрамускулно приложение елиминационният полуживот е около 21 часа, а при интравенозно – 14 часа. Излъчва се чрез урината и жлъчката. Екскретира се в майчиното мляко.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Изследванията за ембриотоксичност и тератогенност при бременни животни, третирани с халоперидол, показват повишаване на инцидентите от фетална резорбция и неонатална смърт в дози 2 до 20 пъти по-високи от терапевтичните.



HALOPERIDOL SOPHARMA sol. inj. 5 mg/ml

Вродена цепка на небцето се наблюдава в изследвания върху мишки, третиращи с доза 15 пъти по-висока от терапевтичната.

Няма данни за мутагенен потенциал на продукта.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ**6.1 Списък на помощните вещества**

Млечна киселина, вода за инжекции.

6.2 Несъвместимости

Не са известни.

6.3 Срок на годност

3 (три) години

6.4 Специални условия на съхранение

В оригиналната опаковка, на защитено от светлина място, при температура под 25°C.

Да не се замразява!

6.5 Данни за опаковката

Ампули от безцветно стъкло по 10 броя в блистер от твърдо ПВХ фолио; по 1 или 10 блистера в картонена кутия, заедно с листовка.

6.6 Специфични предпазни мерки при изхвърляне на използван лекарствен продукт или отпадъчни материали от него

Няма специални изисквания.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Софарма АД, България

1220 София, ул. Илиенско шосе 16

8. РЕГИСТРАЦИОНЕН НОМЕР - 20020051**9. ДАТА НА ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА:**

17.01.2002 г.

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА: 13. 12. 2006 г.