

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ
РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

СУЛЬПИРИД



Регистрационный номер:

Торговое название: СУЛЬПИРИД

Международное непатентованное название (МНН): сульпирид

Лекарственная форма: раствор для приема внутрь

Состав:

В 5 мл раствора содержится:

Действующее вещество: Сульпирид 200 мг

Вспомогательные вещества: метилпарагидроксибензоат 6,0 мг, пропилпарагидроксибензоат 1,5 мг, пропиленгликоль 103,6 мг, лимонной кислоты моногидрат 50,0 мг, жидкий мальтитол 3073,5 мг, ароматизатор лимон (L573) 4,555 мг, ароматизатор анис (L559) 4,18 мг, вода очищенная до 5 мл.

Описание: бесцветный или со слегка желтоватым оттенком прозрачный раствор с характерным запахом лимона или аниса.

Фармакотерапевтическая группа: антипсихотическое (нейролептическое) средство.

Код АТХ – N05AL01.

Фармакологические свойства:

Сульпирид - атипичный нейролептик из группы замещенных бензамидов.

Фармакодинамика

Сульпирид обладает умеренной нейролептической активностью в сочетании со стимулирующим и тимоаналептическим (антидепрессивным) действием.

Нейролептический эффект связан с антидофаминергическим действием. В центральной нервной системе сульпирид блокирует преимущественно

дофаминергические рецепторы лимбической системы, а на неостриатную систему воздействует незначительно, он обладает антипсихотическим действием и вызывает незначительное число побочных явлений. Периферическое действие сульпирида основывается на угнетении пресинаптических рецепторов. С повышением количества дофамина в центральной нервной системе связывают улучшение настроения, с уменьшением - развитие симптомов депрессии.

Антипсихотическое действие сульпирида проявляется в дозах более 600 мг в сутки, в дозах до 600 мг в сутки преобладает стимулирующее и антидепрессивное действие.

Сульпирид не оказывает значительного воздействия на адренергические, холинергические, серотониновые, гистаминовые и рецепторы гамма-аминомасляной кислоты (GABA рецепторы).

В небольших дозах сульпирид может применяться как вспомогательное средство при лечении психосоматических заболеваний, в частности, он эффективен в купировании негативных психических симптомов язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки. При синдроме раздраженной толстой кишки сульпирид снижает интенсивность абдоминальных болей и приводит к улучшению клинического состояния пациента.

Низкие дозы сульпирида (50-300 мг в сутки) эффективны при головокружениях, независимо от этиологии. Сульпирид стимулирует секрецию пролактина и обладает центральным антиэметическим эффектом (угнетение рвотного центра).

Фармакокинетика

После перорального применения максимальные концентрации в плазме достигаются через 3 – 6 часов. Биодоступность сульпирида при приеме внутрь составляет 25 – 35 %. Связывание сульпирида с белками плазмы составляет менее 40 %.

Сульпирид в организме человека не подвергается метаболизму и выводится практически в неизменном виде через почки (около 95 %). Период полувыведения составляет 6-8 часов.

Сульпирид выделяется с грудным молоком.

Показания к применению

В качестве монотерапии или в сочетании с другими психотропными препаратами.

- острая и хроническая шизофрения;
- острые делириозные состояния;
- депрессии различной этиологии;
- невротические расстройства;
- головокружение различной этиологии (вертебро-базиллярная недостаточность, вестибулярный неврит, болезнь Меньера, состояние после черепно-мозговой травмы, средний отит);
- вспомогательная терапия при язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки и синдроме раздраженной толстой кишки.

Противопоказания

- острое отравление алкоголем, снотворными средствами, анальгетиками;
- повышенная чувствительность к сульпириду или к любому из компонентов препарата;
- феохромоцитоме;
- эпилепсия;
- гиперпролактинемия;
- пациенты в состоянии аффекта и агрессии, у которых существует опасность провокации симптомов;
- острая порфирия;
- пролактинзависимые опухоли (например, пролактиномы гипофиза, рак молочной железы);

- одновременный прием с леводопой;
- период грудного вскармливания;
- дети до 14 лет.

Меры предосторожности при применении

Необходимо соблюдать меры предосторожности при назначении сульпирида пациентам:

- с гипертензией, тяжелыми заболеваниями органов дыхания, миастения гравис и гиперплазией предстательной железы;
- имеющих в анамнезе (в том числе, семейном) закрытоугольную глаукому;
- пожилого возраста (повышенный риск возникновения ортостатической гипотензии, седации, экстрапирамидных расстройств);
- с агрессивным поведением или ажитацией с импульсивностью (может потребоваться одновременное применение седативных препаратов);
- с болезнью Паркинсона;
- с факторами риска развития венозных тромбозных осложнений;
- предрасположенным к развитию нарушений сердечного ритма (в связи с тем, что сульпирид может вызывать удлинение интервала QT и увеличивать риск развития тяжелых желудочковых нарушений ритма, таких как развитие желудочковой тахикардии типа «пируэт»): с брадикардией менее 55 ударов в мин; с электролитными нарушениями, в частности с гипокалиемией; с врожденным удлинением интервала QT; одновременно получающим препараты, способные вызывать выраженную брадикардию (менее 55 ударов в мин), гипокалиемию, уменьшение внутрисердечной проводимости или удлинение интервала QT;
- со злокачественным нейролептическим синдромом в анамнезе;
- с эпилепсией или судорожными припадками в анамнезе (риск снижения порога судорожной готовности);
- с нарушением функции почек (требуется коррекция режима дозирования);

- с желтухой в анамнезе или с печеночной недостаточностью (риск возникновения комы);
- пожилого возраста с деменцией;
- с факторами риска возникновения инсульта;
- с экстрапирамидными нарушениями;
- принимающим допаминэргические препараты;
- детского возраста (эффективность и безопасность у данной категории пациентов изучены недостаточно).

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Не рекомендуется назначение сульпирида беременным, за исключением случаев, когда врач, оценив соотношение пользы и риска для беременной и плода, принимает решение о том, что применение препарата необходимо.

В период лечения препаратом необходимо прекратить грудное вскармливание.

Способ применения и дозы

Внутрь. Перед употреблением взбалтывать!

Не рекомендуется принимать препарат во второй половине дня (после 16 часов) в связи с повышением уровня бодрствования.

Максимальная суточная доза для взрослых составляет 1600 мг сульпирида.

Острая и хроническая шизофрения, острый делириозный психоз: начальные дозы сульпирида зависят от клинической картины заболевания и составляют 600 – 1200 мг сульпирида в сутки, разделенные на несколько приемов, поддерживающие дозы – 300-800 мг в сутки.

Депрессия: от 150-200 мг до 600 мг в сутки, разделенные на несколько приемов.

Головокружение: 150-200 мг в сутки, в тяжелых состояниях дозу можно увеличить до 300-400 мг в сутки. Продолжительность лечения должна быть не менее 14 дней.

Вспомогательная терапия при язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки, синдроме раздраженной толстой кишки: 100-300 мг сульпирида в сутки, в один или два приёма.

Дозы у пациентов с нарушением функции почек: в связи с тем, что сульпирид выводится из организма преимущественно через почки, рекомендуется уменьшить дозу сульпирида и/или увеличить интервал между введением отдельных доз препарата.

Дозы для лиц преклонного возраста: для лиц преклонного возраста начальная доза сульпирида должна составлять $\frac{1}{4}$ - $\frac{1}{2}$ дозы для взрослых.

Дозы для детей: стандартная доза сульпирида для детей старше 14 лет составляет 3-5 мг/кг массы тела.

Побочные действия

Побочные эффекты приведены ниже по убыванию частоты возникновения согласно рекомендациям Всемирной Организации Здравоохранения: очень часто ($\geq 10\%$); часто ($\geq 1\%$ и $< 10\%$); нечасто ($\geq 0,1\%$ и $< 1\%$); редко ($\geq 0,01\%$ и $< 0,1\%$); очень редко ($< 0,01\%$); частота неизвестна (частота не может быть оценена по доступным данным).

Препарат обычно хорошо переносится. Нежелательные явления, развивающиеся в результате приема сульпирида, подобны нежелательным явлениям, вызываемым другими нейролептиками, но частота их развития, в основном, меньше.

Нарушения со стороны нервной системы: часто: седативный эффект, сонливость, бессонница, головокружение, головная боль, тремор, нечасто: экстрапирамидные расстройства (эти симптомы обычно обратимы после назначения противопаркинсонических препаратов), паркинсонизм, акатизия; мышечный гипертонус, дискинезия, мышечная дистония; редко: оральный автоматизм, афазия, окулогирный криз, депрессия, кататония, при применении в малых дозах возможны психомоторное возбуждение, тревожность, раздражительность, расстройство сна; частота неизвестна:

злокачественный нейролептический синдром, спутанность сознания, гипокинезия, поздняя дискинезия (как и приеме всех нейролептиков, после их применения в течение более 3-х месяцев; при этом прием противопаркинсонических препаратов неэффективен или может спровоцировать усиление симптомов), судороги.

Нарушения со стороны сердечно-сосудистой системы: нечасто: повышение или снижение артериального давления, ортостатическая гипотензия; *редко:* желудочковые нарушения ритма, фибрилляция желудочков, желудочковая тахикардия; *частота неизвестна:* удлинение интервала QT, желудочковая тахикардия типа «пируэт», венозные тромбоэмболические осложнения, включая тромбоэмболию легочной артерии и тромбоз глубоких вен, иногда летальные; остановка сердца, внезапная смерть.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: нечасто: сухость во рту, запор, гиперсаливация, послабляющий эффект или диарея (могут быть вызваны входящим в состав мальтитолом).

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей: часто: повышение активности «печеночных» ферментов; *редко:* желтуха, гепатит.

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы: частота неизвестна: нейтропения, агранулоцитоз, гемолитическая анемия, тромбоцитопеническая пурпура, лейкемия.

Нарушения со стороны обмена веществ и питания: частота неизвестна: гипергликемия.

Нарушения со стороны эндокринной системы: часто: гиперпролактинемия.

Нарушения со стороны половых органов и молочных желез: часто: болезненность молочных желез, галакторея; *нечасто:* увеличение молочных желез, аменорея, олигоменорея, эякуляторная дисфункция, импотенция, снижение или повышение либидо; *частота неизвестна:* гинекомастия.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: нечасто: заложенность носа.

Нарушения со стороны кожи и подкожной клетчатки: часто: макулезно-папулезная сыпь, контактная чувствительность, эксфолиативный дерматит, крапивница; *нечасто:* пигментация кожи, фоточувствительность, кожная сыпь.

Нарушения со стороны органа зрения: частота неизвестна: нечеткое зрение, помутнение роговицы и хрусталика, отложение пигмента в глазах.

Нарушения со стороны мочевыделительной системы: частота неизвестна: затрудненное мочеиспускание.

Общие расстройства: часто: увеличение массы тела, *нечасто:* утомляемость.

Беременность, послеродовые и перинатальные состояния: частота неизвестна: «синдром отмены» у новорожденных.

Если любые из указанных в инструкции побочных эффектов усугубляются, или Вы заметили любые другие побочные эффекты не указанные в инструкции, **сообщите об этом врачу.**

Передозировка

При передозировке сульпирида отсутствуют специфические симптомы. При передозировке сульпирида могут наблюдаться: помутнение зрения, артериальная гипертензия, седативный эффект, тошнота, экстрапирамидные симптомы, сухость во рту, рвота, повышенное потоотделение и гинекомастия, развитие НЗС. В связи с отсутствием специфического антидота следует применять симптоматическую и поддерживающую терапию.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

Противопоказанные комбинации

С леводопой

Взаимный антагонизм эффектов леводопы и нейролептиков.

С агонистами дофаминовых рецепторов

Взаимный антагонизм амантодина, бромокриптина, каберголина, лизурида, прамипексола и ропинирола с сульпиридом. Одновременное применение может также привести к обострению психотических симптомов, ухудшению течения болезни Паркинсона.

Нерекомендуемые комбинации

С этанолом

Этанол усиливает седативный эффект нейролептиков. Следует избегать приема алкогольных напитков и лекарственных препаратов, содержащих этанол.

С препаратами, способными удлинять интервал QT или вызывающими электролитный дисбаланс

Если у пациента нельзя избежать одновременного применения этих препаратов с сульпиридом, следует проводить тщательное наблюдение, включающее контроль электролитного состава крови и ЭКГ-мониторинг.

С препаратами, способными вызывать развитие желудочковой тахикардии типа «пируэт»:

- препараты, вызывающие брадикардию, такие как бета-блокаторы; блокаторы кальциевых каналов (верапамил, дилтиазем); клонидин, сердечные гликозиды.
- препараты, вызывающие гипокалиемию: диуретики, снижающие концентрацию калия в крови; слабительные, стимулирующие перистальтику кишечника; амфотерицин В при внутривенном применении; глюкокортикостероиды; тетракозактиды.
- антиаритмические препараты IA класса, такие как хинидин, дизопирамид.
- антиаритмические препараты IIIA класса, такие как амиодарон, соталол.
- другие препараты, такие как пимозид, галоперидол, метадон, производные имипрамина, препараты лития, цизаприд, тиоридазин, вводимый внутривенно эритромицин, галофантрин, пентамидин.

Взаимодействие, которое следует принимать во внимание

С анестетиками

Гипотензивный эффект анестетиков может усиливаться при совместном применении с сульпиридом.

С анальгетиками

Усиление седативного и гипотензивного эффектов при совместном применении опиоидных анальгетиков с сульпиридом.

С антидепрессантами

Возможность возникновения экстрапирамидных симптомов, включая паркинсоноподобные симптомы или дистонию у пациентов, принимающих одновременно флуоксетин и сульпирид. Увеличение риска возникновения желудочковых аритмий при совместном применении сульпирида с трициклическими антидепрессантами.

С антиэпилептическими препаратами

Сульпирид снижает судорожный порог.

С антигипертензивными препаратами

Усиление гипотензивного действия при совместном применении с сульпиридом.

С препаратами, угнетающими функцию ЦНС

Возможно усиление седативного эффекта блокаторов H_1 -гистаминовых рецепторов, бензодиазепинов и других анксиолитиков.

С антацидами и сукральфатом

Биодоступность сульпирида снижается при одновременном применении с антацидами или сукральфатом. Сульпирид следует принимать, как минимум, за два часа до приема этих препаратов.

С препаратами лития

Риск возникновения экстрапирамидных побочных реакций.

С симпатомиметиками

Антагонизм при совместном применении с сульпиридом, приводящий к тяжелой гипотензии.

Особые указания

Злокачественный нейролептический синдром

Злокачественный нейролептический синдром (ЗНС), являющийся потенциально летальным осложнением, характеризуется гипертермией, ригидностью мышц, дисфункцией вегетативной нервной системы, нарушением сознания, повышением уровня креатинфосфокиназы в плазме крови. В случае появления гипертермии, которая является одним из элементов ЗНС, препарат необходимо отменить.

Алкоголь

Пациент должен быть предупрежден о недопустимости употребления алкоголя в период лечения сульпиридом.

Пациенты пожилого возраста с деменцией

У пациентов пожилого возраста с деменцией, при лечении антипсихотическими препаратами наблюдалось повышение риска наступления смерти. Причины и степень увеличения смертности не известны.

Экстрапирамидный синдром

При возникновении экстрапирамидных реакций может потребоваться снижение дозы сульпирида или назначение противопаркинсонических препаратов.

Пациенты с эпилепсией

В связи с тем, что нейролептики могут понижать эпилептогенный порог, при назначении сульпирида пациентам с эпилепсией, последние должны находиться под строгим медицинским наблюдением. Доза противосудорожных препаратов не изменяется.

Инсульт

В рандомизированных клинических исследованиях, проведенных у пациентов пожилого возраста с деменцией, наблюдалось 3-кратное увеличение риска развития цереброваскулярных осложнений при назначении атипичных нейролептиков. Механизм этого риска неизвестен. Нельзя исключить увеличения такого риска при приеме других нейролептиков или в

других популяциях пациентов, поэтому сульпирид следует с осторожностью назначать пациентам с факторами риска развития инсульта.

Венозные тромбоэмболические осложнения

При применении антипсихотических препаратов наблюдались случаи венозных тромбоэмболических осложнений, иногда летальных. Поэтому сульпирид следует применять с осторожностью у пациентов с факторами риска развития венозных тромбоэмболических осложнений.

Удлинение интервала QT

Сульпирид может вызывать удлинение интервала QT. Этот эффект увеличивает риск развития тяжелых желудочковых аритмий, таких как желудочковая тахикардия типа «пируэт». Перед применением, если позволяет состояние пациента, необходимо исключить наличие факторов, предрасполагающих к развитию этих тяжелых нарушений ритма (брадикардия менее 55 ударов в мин, электролитные нарушения, в частности гипокалиемия, врожденное удлинение интервала QT, одновременное применение препаратов, удлиняющих интервал QT). Пациентам с вышеперечисленными факторами риска при необходимости назначения сульпирида следует соблюдать осторожность.

Пациенты с болезнью Паркинсона, принимающие агонисты дофаминовых рецепторов

Кроме исключительных случаев, сульпирид не должен применяться у пациентов с болезнью Паркинсона. Пациенты, получающие агонисты дофаминовых рецепторов, требуют тщательного наблюдения для выявления ухудшения течения паркинсонизма и психического состояния.

Пациенты с нарушением функции почек

Необходимо снижение дозы и ее титрование маленькими порциями.

Фотосенсибилизация

Препарат в высоких дозах может вызывать фотосенсибилизацию. Рекомендуется избегать воздействия прямых солнечных лучей во время применения препарата.

Лейкопения, нейтропения и агранулоцитоз

На фоне терапии нейролептиками, в том числе сульпиридом, отмечались лейкопения, нейтропения и агранулоцитоз. Развитие необъяснимых инфекций или повышение температуры тела могут являться признаками нарушений со стороны крови, что требует немедленного выполнения гематологических исследований.

Другие нейролептики

Следует избегать одновременного назначения с другими нейролептиками.

Вспомогательные вещества

Препарат содержит мальтитол, поэтому его нельзя назначать пациентам с наследственной непереносимостью фруктозы.

Кроме того препарат содержит консерванты (парабены), которые могут стать причиной аллергических реакций (в том числе отсроченных).

Синдром отмены

Резкое прекращение приема препарата может вызывать синдром отмены.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения следует воздерживаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания и быстрых психомоторных реакций.

Форма выпуска

Раствор для приема внутрь (200 мг/5 мл).

По 150 мл препарата во флакон оранжевого стекла тип III, укупоренный навинчивающейся крышкой из полиэтилена высокой плотности с внутренней частью из полипропилена высокой плотности с прокладкой из вспененного полиэтилена высокой плотности, кольцом первого вскрытия и защитой от детей. По 1 флакону вместе с инструкцией по применению в картонную пачку.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25°C.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года

Препарат нельзя применять после истечения срока годности, указанного на этикетке флакона.

После вскрытия срок хранения 3 месяца.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Производитель

Роземонт Фармасьютикалз Лтд., Роземонт Хаус, Йоркдэйл Индастрил Парк,
Брэйтвэйт стрит, Лиидс, LS11 9XE, Великобритания

Rosemont Pharmaceuticals Ltd., Rosemont House, Yorkdale Industrial Park,
Braithwaite Street, Leeds, LS11 9XE, United Kingdom

Адрес для претензий в России

ООО «СВИЧ»

191040, Санкт-Петербург, ул. Пушкинская 12/2 – 21; тел./факс: (812)572-22-76

Представитель фирмы

Генеральный директор ООО «СВИЧ»



Савин А.А.