Сердолект



Код АТХ:

- N05AE03

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Сертиндол

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые оболочкой бледно-желтого цвета, овальные, двояковыпуклые, с символом "S4" на одной стороне.

	1 таб.
сертиндол	4 мг

Вспомогательные вещества: крахмал кукурузный, лактозы моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая, гипролоза, магния стеарат, натрия кроскармеллоза.

Состав оболочки: гипромеллоза, макрогол 400, титана диоксид (E171), железа оксид желтый (E172).

10 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые оболочкой бледно-желто-коричневатого цвета, овальные, двояковыпуклые, с символом "S12" на одной стороне.

	1 таб.
сертиндол	12 мг

Вспомогательные вещества: крахмал кукурузный, лактозы моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая, гипролоза, магния стеарат, натрия кроскармеллоза.

Состав оболочки: гипромеллоза, макрогол 400, титана диоксид (E171), железа оксид желтый (E172), железа оксид красный (E172).

14 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые оболочкой коричневато-розового цвета, овальные, двояковыпуклые, с символом "S16" на одной стороне.

	1 таб.
сертиндол	16 мг

Вспомогательные вещества: крахмал кукурузный, лактозы моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая, гипролоза, магния стеарат, натрия кроскармеллоза.

Состав оболочки: гипромеллоза, макрогол 400, титана диоксид (E171), железа оксид красный (E172).

14 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые оболочкой бледно-розового цвета, овальные, двояковыпуклые, с символом "S20" на одной стороне.

	1 таб.
сертиндол	20 мг

Вспомогательные вещества: крахмал кукурузный, лактозы моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая, гипролоза, магния стеарат, натрия кроскармеллоза.

Состав оболочки: гипромеллоза, макрогол 400, титана диоксид (E171), железа оксид желтый (E172), железа оксид красный (E172), железа оксид черный (E172).

14 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Нейротропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Атипичный нейролептик, производное фенилиндола. Селективно воздействует на лимбические структуры. Обладает антипсихотическим действием. Нейрофармакологический профиль сертиндола обусловлен селективной блокадой мезолимбических допаминергических нейронов и сбалансированным ингибирующим действием на центральные допаминовые D_2-рецепторы и серотониновые 5-HT_2-рецепторы, а также на α_1-адренорецепторы.

Антипсихотические препараты увеличивают уровень пролактина в сыворотке крови из-за блокады допаминовых рецепторов. У пациентов, принимающих Сердолект при краткосрочной терапии и во время длительного лечения (1 год), уровень пролактина оставался в пределах нормы.

Сертиндол не влияет на м-холинорецепторы и гистаминовые H_1-рецепторы, что подтверждается отсутствием антихолинергического и седативного эффектов, которые связаны с воздействием на эти рецепторы.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема препарата внутрь сертиндол хорошо абсорбируется из кишечника, при этом C_{max} достигается через 10 ч. Прием одновременно с пищей не влияет на процесс абсорбции.

Распределение

Связывание с белками плазмы составляет 99.5%. Кажущийся V_d - около 20 л/кг. Проникает через ГЭБ и плацентарный барьер.

Метаболизм

Метаболизируется в печени при участии изоферментов CYP2D6 и CYP3A. Метаболиты препарата не обладают нейролептической активностью.

Выведение

$T_{1/2}$ составляет около 3 дней. Сертиндол и его метаболиты выводятся преимущественно с калом и частично с мочой.

Показания к применению:

— шизофрения.

Не рекомендуется назначать в экстренных ситуациях для купирования острых психотических расстройств.

Относится к болезням:

- Шизофрения

Противопоказания:

— некорректируемые гипокалиемия или гипомагниемия;

— выраженные сердечно-сосудистые заболевания (в т.ч. в анамнезе);

— застойная сердечная недостаточность;

— гипертрофия миокарда;

— аритмии;

— брадикардия (менее 50 уд./мин);

— врожденный синдром удлиненного интервала QT (в т.ч. в семейном анамнезе);

— приобретенный удлиненный интервал QT (более 450 мсек у мужчин и 470 мсек у женщин);

— одновременное применение препаратов, удлиняющих интервал QT, включая антиаритмики класса IA и III (хинидин, соталол, амиодарон, дофетилид), некоторые антипсихотики (тиоридазин), некоторые антибиотики из группы макролидов (эритромицин), некоторые антибиотики хинолонового ряда (гатифлоксацин), некоторые антигистаминные средства (терфенадин, астемизол), а также цизаприд, препараты лития;

— одновременное применение препаратов, ингибирующих изоферменты CYP3A, включая противогрибковые средства из группы азолов (итраконазол, кетоконазол), некоторые антибиотики из группы макролидов (эритромицин, кларитромицин), ингибиторы ВИЧ-протеазы (индинавир), некоторые блокаторы кальциевых каналов (верапамил, дилтиазем), циметидин;

— выраженная печеночная недостаточность;

— беременность;

— лактация (грудное вскармливание);

— детский и подростковый возраст до 18 лет (безопасность и эффективность не установлены);

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь 1 раз/сут, независимо от приема пищи.

Начальная доза составляет 4 мг/сут. Суточную дозу увеличивают на 4 мг каждые 4-5 дней до достижения оптимальной дозы в интервале от 12 мг/сут до 20 мг/сут. В исключительных случаях (из-за риска удлинения интервала QT с увеличением дозы) возможно применение препарата в максимальной дозе - 24 мг/сут.

Пациентам пожилого возраста до назначения Сердолекта необходимо провести тщательное обследование сердечно-сосудистой системы. Повышение дозы препарата следует проводить медленно, применяя более низкие дозы.

У **пациентов с почечной недостаточностью** коррекции режима дозирования не требуется. Гемодиализ не влияет на фармакокинетику препарата.

У **пациентов с легкой или умеренной печеночной недостаточностью** следует более медленно повышать дозу и

применять препарат в более низких дозах.

Если *при повторном назначении* Сердолекта с момента прекращения приема прошло менее недели, то постепенное повышение дозы не обязательно (возможно назначение препарата в прежней дозе). В остальных случаях повышение дозы до оптимальной следует проводить постепенно, методом титрования, при этом перед титрованием обязательно проведение ЭКГ-исследования.

При *переходе с приема внутрь другого нейролептика* лечение Сердолектом можно начинать с рекомендуемого постепенного наращивания дозы одновременно с отменой предыдущего препарата. При *переходе на прием Сердолекта после применения нейролептиков в депо-форме* первый прием Сердолекта назначают вместо следующей инъекции депо-формы.

Побочное действие:

Со стороны дыхательной системы: ринит, затруднение носового дыхания, одышка.

Со стороны ЦНС: головокружение, парестезии; редко - синкопальные состояния, судороги, двигательные нарушения (включая позднюю дискинезию); в отдельных случаях - ЗНС. Экстрапирамидные расстройства на фоне приема сертиндола возникают с той же частотой, что и при использовании плацебо.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: постуральная гипотензия (носит транзиторный характер и возникает в начале терапии), периферические отеки, удлинение интервала QT; редко - пароксизмальная желудочковая тахикардия (в т.ч. аритмия типа "пируэт").

Со стороны мочевыделительной системы: иногда - лейкоцитурия, гематурия.

Прочие: иногда - сухость во рту, увеличение массы тела, уменьшение объема эякулята; редко - гипергликемия.

Передозировка:

Симптомы: сонливость, невнятная речь, тахикардия, снижение АД, транзиторное удлинение интервала QT. Возможно развитие пароксизмальной желудочковой тахикардии (аритмии типа "пируэт"), особенно при совместном применении сертиндола с препаратами, которые могут вызывать этот вид побочного действия.

Лечение: следует отменить препарат, установить в/в катетер, провести промывание желудка, прием активированного угля и слабительных средств; необходимо принять меры для поддержания проходимости дыхательных путей и адекватной оксигенации. Специфического антидота нет и препарат не может быть выведен путем диализа. Поэтому должна быть назначена поддерживающая терапия. Необходимо немедленно начать мониторирование ЭКГ и контроль основных соматических показателей. При удлинении интервала QT контроль ЭКГ проводится до нормализации этого показателя, при этом следует учесть $T_{1/2}$ сертиндола (от 2 до 4 дней).

При коррекции снижения АД и проявлений сосудистого коллапса в/в введение растворов допамина или эпинефрина следует проводить с осторожностью, т.к. стимуляция β-адренорецепторов с одновременным антагонистическим влиянием сертиндола на α_1-адренорецепторы может привести к выраженному снижению АД. При применении антиаритмиков следует учитывать, что хинидин, прокаинамид, дизопирамид могут вызывать удлинение интервала QT.

При развитии тяжелых экстрапирамидных нарушений следует назначать антихолинергические препараты.

Пациент должен находиться под постоянным медицинским наблюдением до полного выздоровления.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Безопасность применения Сердолекта при беременности и в период лактации не изучена.

Назначение при беременности противопоказано.

При необходимости применения Сердолекта в период лактации следует прекратить грудное вскармливание.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Риск удлинения интервала QT увеличивается при сопутствующем применении препаратов, удлиняющих интервал QT или ингибирующих метаболизм сертиндола (данные комбинации противопоказаны).

При совместном применении сертиндола с лекарственными средствами, ингибирующими CYP2D6 (флуоксетин,

пароксетин, хинидин), возможно повышение концентрации сертиндола в плазме крови (может потребоваться снижение его дозы, а также проведение ЭКГ-обследования до и после изменения дозы этих препаратов).

Сертиндол и его метаболиты могут оказывать слабое ингибирующее действие на CYP2D6, который участвует в метаболизме бета-адреноблокаторов, антиаритмиков, некоторых антигипертензивных средств, многих антипсихотических средств и антидепрессантов.

Одновременное применение сертиндола и антибиотиков группы макролидов (эритромицин) и блокаторов кальциевых каналов (дилтиазем, верапамил) может привести к незначительному увеличению (<25%) концентрации сертиндола в плазме. Степень увеличения может быть выше у пациентов со слабой активностью CYP2D6. Установить в плановом порядке этих пациентов достаточно сложно, поэтому одновременное применение сертиндола и препаратов, ингибирующих CYP3A противопоказано, т.к. это может привести к значительному повышению концентрации сертиндола в плазме крови.

При одновременном применении с карбамазепином, фенитоином, фенобарбиталом и рифампицином возможно значительное усиление метаболизма сертиндола, что приводит к существенному снижению концентрации нейролептика в плазме крови. В таких случаях снижение антипсихотической активности сертиндола может потребовать повышения его дозы.

Особые указания и меры предосторожности:

Вследствие мер предосторожности, связанных с увеличением QT интервала и мониторингом ЭКГ Сердолект следует назначать только в случаях, когда уже имеется непереносимость по крайней мере одного другого антипсихотика.

Опасность удлинения интервала QT возрастает при приеме сертиндола в более высоких дозах (20-24 мг/сут). Удлинение интервала QT, возникающее при применении ряда препаратов, может приводить к развитию пароксизмальной желудочковой тахикардии и внезапной смерти.

Контроль АД необходим в период подбора дозы и в начале периода поддерживающей терапии.

Мониторирование ЭКГ следует проводить до начала лечения и в процессе терапии: при достижении равновесного состояния (примерно через 3 недели от начала терапии) или суточной дозы 16 мг, а также через 3 мес после начала лечения. В течение поддерживающей терапии ЭКГ исследование необходимо проводить каждые 3 мес. ЭКГ исследование следует проводить до и после повышения дозы сертиндола или при присоединении/повышении дозы препарата, который может вызвать повышение концентрации сертиндола в плазме крови.

При удлинении интервала QT свыше 500 мсек сертиндол необходимо отменить. При появлении у пациента сердцебиения, судорог, обмороков или других симптомов, указывающих на возможность развития аритмии, необходимо немедленно обследовать пациента (включая ЭКГ). ЭКГ исследование предпочтительно проводить в утреннее время.

У пациентов с повышенным риском развития электролитных нарушений перед началом терапии Сердолектом следует определить концентрацию калия и магния в сыворотке крови. Гипокалиемию и гипомагниемию следует скорректировать до начала применения сертиндола. Рекомендуют проведение регулярного контроля концентрации калия в сыворотке крови у пациентов с рвотой и диареей, при применении калийвыводящих диуретиков и при других электролитных нарушениях.

Антипсихотические средства могут ингибировать эффекты допаминовых агонистов. Сердолект следует с осторожностью применять у пациентов с болезнью Паркинсона.

При незначительной или умеренной степени нарушения функции печени необходимо тщательное наблюдение за состоянием больного; рекомендуется более медленное увеличение дозы и меньшая поддерживающая доза.

С осторожностью следует назначать Сердолект пациентам с судорожными припадками в анамнезе.

Длительное применение антипсихотических средств (особенно в высоких дозах) повышает риск развития поздней дискинезии. При появлении симптомов поздней дискинезии на фоне применения Сердолекта следует снизить дозу препарата или совсем отменить его.

При развитии ЗНС необходима немедленная отмена препарата.

При резкой отмене антипсихотиков могут возникать тошнота, рвота, повышенное потоотделение, бессонница. Также возможно возвращение психотических симптомов и появление непроизвольных двигательных расстройств (акатизия, дистония, дискинезия). Необходима постепенная отмена препарата.

Таблетки содержат моногидрат лактозы. Не следует назначать препарат пациентам с наследственной непереносимостью галактозы, недостатком лактазы или нарушением абсорбции глюкозы и галактозы.

Использование в педиатрии

Безопасность и эффективность применения препарата у **детей и подростков в возрасте до 18 лет** не изучались,

назначение Сердолекта этой категории пациентов противопоказано.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Хотя Сердолект не обладает седативным действием, пациентам не рекомендуется заниматься потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания, до тех пор, пока не будет установлена индивидуальная реакция на препарат.

При нарушениях функции почек

При **нарушениях функции почек** коррекции режима дозирования препарата не требуется. Гемодиализ не влияет на фармакокинетику препарата.

При нарушениях функции печени

Препарат противопоказан при выраженной печеночной недостаточности. **Пациентам** с **нарушениями функции печени легкой или средней степени тяжести** препарат назначают в более низких начальных дозах, используется более медленное наращивание дозы.

Применение в пожилом возрасте

Пациентам пожилого возраста до назначения Сердолекта необходимо провести тщательное обследование сердечно-сосудистой системы. Повышение дозы препарата следует проводить медленно, применяя более низкие дозы.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет.

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить в защищенном от света, недоступном для детей месте при температуре не выше 25°С.

Срок годности:

5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Serdolekt