CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

Sulpiryd Hasco, 50 mg, tabletki
Sulpiryd Hasco, 100 mg, tabletki
Sulpiryd Hasco, 200 mg, tabletki

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

1 tabletka zawiera 50 mg sulpirydu (*Sulpiridum*).
1 tabletka zawiera 100 mg sulpirydu (*Sulpiridum*).
1 tabletka zawiera 200 mg sulpirydu (*Sulpiridum*).

Substancja pomocnicza o znanym działaniu: laktoza jednowodna.

Jedna tabletka Sulpiryd Hasco, 50 mg zawiera 20 mg laktozy.
Jedna tabletka Sulpiryd Hasco, 100 mg zawiera 40 mg laktozy.
Jedna tabletka Sulpiryd Hasco, 200 mg zawiera 80 mg laktozy.

Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Tabletka

Sulpiryd Hasco, 50 mg, tabletki
Tabletki okrągłe, obustronnie wypukłe, o ściętych krawędziach, gładkie, białe.

Sulpiryd Hasco, 100 mg, tabletki
Tabletki owalne, obustronnie wypukłe, gładkie, białe.

Sulpiryd Hasco, 200 mg, tabletki
Tabletki owalne, obustronnie wypukłe, po jednej stronie powierzchnia jednolita, po drugiej stronie grawer „HL” („H” po jednej stronie podziałki, „L” po drugiej stronie podziałki), gładkie, białe.

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1 Wskazania do stosowania

Produkt leczniczy Sulpiryd Hasco jest przeznaczony do leczenia:
- ostrych i przewlekłych psychoz występujących w schizofrenii, zwłaszcza przebiegających z objawami upośledzonej aktywności;
- zaburzeń depresyjnych, jeżeli leczenie innymi lekami przeciwdepresyjnymi jest nieskuteczne lub niemożliwe do zastosowania.

4.2 Dawkowanie i sposób podawania

Dawkowanie

Schizofrenia
Dawka początkowa wynosi od 400 mg do 800 mg na dobę i podawana jest w dwóch dawkach podzielonych (rano i wczesnym wieczorem), w zależności od objawów.

Pacjentom, u których przeważają objawy pozytywne (zaburzenia myślenia, omamy, urojenia, bezsensowne działania) zaleca się większe dawki: początkowo wynoszące co najmniej 400 mg dwa razy na dobę, a w razie potrzeby - większe. Maksymalna dawka dobowa wynosi 1200 mg. Tylko w przypadkach zaburzeń opornych na leczenie lekarz psychiatra może zwiększyć dawkę dobową do 1600 mg, podawaną w dawkach podzielonych.
U pacjentów, u których przeważają objawy negatywne (przygnębienie, zubożenie mowy - małomówność, brak reaktywności, apatia, a także depresja) zaleca się mniejsze dawki. Dawka początkowa wynosi 400 mg 2 razy na dobę, a zmniejszenie dawki do 200 mg 2 razy na dobę zwiększa działanie pobudzające sulpirydu. Pacjenci z objawami mieszanymi (pozytywnymi i negatywnymi, bez dominacji jednych z nich) reagują zwykle właściwie na dawki od 400 mg do 600 mg podane 2 razy na dobę.

Zaburzenia depresyjne
Zwykle zaleca się stosowanie dawki początkowej od 50 mg do 150 mg na dobę. Następnie dawkę zwiększa się do 150 mg - 300 mg na dobę.

Pacjenci w podeszłym wieku
U osób w wieku podeszłym zazwyczaj stosowane są zwykle zalecane dawki sulpirydu. W przypadku zaburzenia czynność nerek dawkę sulpirydu należy zmniejszyć (patrz poniżej).

Pacjenci z zaburzeniami czynności nerek
W przypadkach zaburzenia czynności wydalniczej nerek, dawkowanie sulpirydu należy odpowiednio dostosować do stopnia wydolności nerek zmniejszając dawkę dobową lub wydłużając odstęp czasu między poszczególnymi podaniami. Proponowane szczegółowe zalecenia korekty dawkowania w niewydolności nerek podano poniżej:

Klirens kreatyniny	**Dawka sulpirydu w porównaniu do standardowo zalecanej**	**Proponowane zwiększenie odstępów pomiędzy kolejnymi podaniami zalecanych dawek sulpirydu**
30 do 60 mL/min.	70 %	1,5 krotne
10 do 30 mL/min.	50 %	2 krotne
mniej niż 10 mL/min.	34 %	3 krotne

Pacjenci z zaburzeniami czynności wątroby
Sulpiryd jest wydalany z organizmu głównie przez nerki, ale nie można absolutnie wykluczyć, że w przypadkach zaburzenia czynności wątroby dawkowanie sulpirydu może również wymagać dostosowania do stopnia wydolności wątroby. Podczas podawania sulpirydu należy monitorować stan wątroby wykonując rutynowe badania laboratoryjne.

Dzieci i młodzież
Ze względu na brak wystarczających danych klinicznych nie zaleca się stosowania sulpirydu u dzieci i młodzieży poniżej 14. roku życia.

Sposób podawania
Podanie doustne.

Sulpiryd należy podawać w dawkach podzielonych.
Tabletki należy przyjmować co najmniej na godzinę przed posiłkiem lub dwie godziny po posiłku.
Nie stosować sulpirydu jednocześnie ani przed upływem 2 godzin od podania leków zobojętniających lub zawierających sukralfat.

Sulpirydu nie należy podawać w późnych godzinach wieczornych (po godzinie 16^{00}), ze względu na możliwość wystąpienia zaburzeń snu.

4.3 Przeciwwskazania

Nadwrażliwość na substancję czynną (sulpiryd) lub na inne pochodne benzamidów, albo na którąkolwiek substancję pomocniczą wymienioną w punkcie 6.1.

Nie należy stosować leku w przypadku:
− rozpoznania lub podejrzenia guza chromochłonnego (*phaeochromocytoma*);
− ostrej porfirii;
− guzów związanych z nadmiernym wydzielaniem prolaktyny (np. gruczolak przysadki, rak piersi);
− jednoczesnego stosowania lewodopy;
− w okresie karmienia piersią (patrz punkt 4.6 Wpływ na płodność, ciążę i laktację);
− dzieci i młodzieży poniżej 14. roku życia.

4.4 Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

U niektórych pacjentów podawanie wysokich dawek sulpirydu wywoływało pobudzenie ruchowe. W fazie agresji lub pobudzenia małe dawki sulpirydu mogą nasilić objawy. Należy zachować ostrożność w razie wystąpienia hipomanii.

U pacjentów u których występują zachowania agresywne albo pobudzenie z towarzyszącą impulsywnością, sulpiryd może być stosowany razem z innym produktem uspokajającym.

Należy zachować szczególną ostrożność stosując sulpiryd u pacjentów z chorobą Parkinsona.
U niewielkiego odsetka pacjentów mogą wystąpić zaburzenia pozapiramidowe i niepokój ruchowy (akatyzja). Może być konieczne zmniejszenie dawki sulpirydu lub zastosowanie leków przeciw parkinsonizmowi.

Podobnie jak w przypadku innych neuroleptyków, należy wziąć pod uwagę możliwość wystąpienia tzw. złośliwego zespołu neuroleptycznego (wzrost temperatury ciała, sztywność mięśni, niestabilność układu autonomicznego, zaburzenia świadomości, zwiększone stężenie kinazy kreatynowej - CPK), który może stanowić zagrożenie życia. W takim przypadku należy przerwać podawanie wszystkich leków przeciwpsychotycznych włącznie z sulpirydem (patrz punkt 4.8 Działania niepożądane).

W razie wystąpienia nieuzasadnionego wzrostu temperatury ciała należy przerwać podawanie sulpirydu do czasu wyjaśnienia przyczyny gorączki.

Pacjenci w podeszłym wieku mogą być bardziej podatni na wystąpienie niedociśnienia, nadmiernego uspokojenia oraz objawów pozapiramidowych. U tych pacjentów sulpiryd, podobnie jak inne neuroleptyki należy stosować ze szczególną ostrożnością.

Po przerwaniu podawania produktów przeciwpsychotycznych opisywano występowanie ostrych objawów odstawienia (nudności, wymioty, wzmożone pocenie się i bezsenność). W takich przypadkach może dochodzić również do nawrotów choroby i wystąpienia ruchów mimowolnych (akatyzja, dystonia, dyskineza). Dlatego zaleca się stopniowe zmniejszanie dawki sulpirydu przed zaprzestaniem jego stosowania.

Neuroleptyki mogą obniżać próg drgawkowy. Po zastosowaniu sulpirydu odnotowano przypadki wystąpienia drgawek u pacjentów, u których nie występowały one wcześniej. Podczas stosowania sulpirydu należy zachować ostrożność u pacjentów z niestabilną padaczką, a szczególnie uważnie kontrolować pacjentów, u których podczas wywiadu lekarskiego stwierdzono występowanie napadów padaczkowych. Nie należy zmieniać dawkowania leków przeciwpadaczkowych u pacjentów wymagających jednoczesnego zastosowania sulpirydu.

Sulpiryd nie wykazuje działania przeciwcholinergicznego.

Tak jak w przypadku wszystkich substancji, dla których nerki stanowią główną drogę eliminacji, podczas stosowania sulpirydu należy zastosować środki ostrożności zazwyczaj stosowane w przypadku

niewydolności nerek. Dawkowanie sulpirydu należy odpowiednio dostosować do stopnia wydolności nerek (patrz punkt 4.2 dawkowanie i sposób podawania – Pacjenci z zaburzeniami czynności nerek).

Wydłużenie odcinka QT
Sulpiryd może powodować wydłużenie odcinka QT w zapisie EKG. Takie działanie zwiększa ryzyko wystąpienia ciężkich niemiarowości komorowych, takich jak *torsade de pointes*, zwiększane jest przez uprzednio występującą bradykardię, hipokaliemię, wrodzone lub nabyte wydłużenie odcinka QT (patrz punkt 4.8 Działania niepożądane).
Przed rozpoczęciem podawania sulpirydu i zależnie od stanu klinicznego pacjenta zaleca się monitorowanie czynników, które mogą predysponować do występowania tego rodzaju zaburzeń rytmu:
− bradykardii (poniżej 55 uderzeń serca na minutę);
− hipokaliemii (którą należy wyrównać);
− wrodzonego wydłużenia odcinka QT;
− stosowania leków, w przypadku których może wystąpić bradykardia (poniżej 55 uderzeń serca na minutę), hipokalemia, zmniejszenie przewodnictwa wewnątrzsercowego, albo wydłużenie odcinka QT (patrz punkt 4.5 Interakcje z innymi produktami leczniczymi i inne rodzaje interakcji).
Należy zachować ostrożność podczas stosowania sulpirydu u pacjentów, u których występują wymienione powyżej czynniki oraz zaburzenia sercowo-naczyniowe predysponujące do wydłużenia odcinka QT.

Należy unikać stosowania sulpirydu z innymi neuroleptykami.

Jeżeli u pacjenta z chorobą Parkinsona leczenie neuroleptyczne jest bezwzględnie konieczne, sulpiryd może być stosowany, ale z ostrożnością.

Monitorowanie leczenia sulpirydem powinno być wnikliwe w następujących przypadkach:
- u pacjentów z padaczką z powodu możliwości obniżenia progu drgawkowego;
- u pacjentów w podeszłym wieku z wysoką wrażliwością na niedociśnienie ortostatyczne, sedację i efekty pozapiramidowe.

Podczas stosowania leków przeciwpsychotycznych zgłaszano przypadki występowania zakrzepów żylnych. U pacjentów otrzymujących produkty przeciwpsychotyczne często występują wrodzone czynniki ryzyka rozwoju zakrzepicy żył. Przed rozpoczęciem leczenia powinny zostać zidentyfikowane wszystkie czynniki ryzyka sprzyjające rozwojowi choroby w celu podjęcia działań zapobiegawczych.

Zwiększona śmiertelność u osób w podeszłym wieku, u których występuje demencja (otępienie).
Wyniki dwóch badań wskazują, że u osób w podeszłym wieku u których występuje otępienie a równocześnie otrzymujących leki przeciwpsychotyczne, występuje niewielkie zwiększenie ryzyka śmierci w porównaniu do grupy kontrolnej osób nieleczonych. Brak wystarczających danych pozwalających precyzyjnie określić rząd wielkości ryzyka wystąpienia takiego działania, a powód zwiększonego ryzyka nie jest znany.

Sulpirydu nie stosuje się w celu leczenia zaburzeń związanych z otępieniem.

Podczas stosowania sulpirydu należy unikać spożywania napojów alkoholowych, jak również przyjmowania leków zawierających alkohol (patrz punkt 4.5 Interakcje z innymi produktami leczniczymi i inne rodzaje interakcji).

Udar
Podczas randomizowanych badań klinicznych z użyciem placebo, prowadzonych z udziałem pacjentów w podeszłym wieku u których występowała demencja, leczonych nietypowymi lekami przeciwpsychotycznymi, obserwowano 3-krotne zwiększenie ryzyka wystąpienia zdarzeń naczyniowo-mózgowych. Nie jest znany mechanizm powstawania tego ryzyka. Nie można wykluczyć zwiększenia takiego ryzyka związanego ze stosowaniem innych produktów przeciwpsychotycznych u innych populacji pacjentów. Sulpiryd należy stosować z ostrożnością u pacjentów z ryzykiem udaru.

Produkt leczniczy zawiera laktozę. Produkt nie powinien być stosowany u pacjentów z rzadko występującą dziedziczną nietolerancją galaktozy, brakiem laktazy lub zespołem złego wchłaniania glukozy-galaktozy.

4.5 Interakcje z innymi produktami leczniczymi i inne rodzaje interakcji

Przeciwwskazane jest stosowanie sulpirydu wraz z lewodopą (wzajemny antagonizm działania między lewodopą i neuroleptykami).

Należy unikać stosowania sulpirydu łącznie z lekami, które mogą wywołać *torsade de pointes* (patrz punkt 4.4 Ostrzeżenia specjalne i środki ostrożności dotyczące stosowania) tj.:
- lekami wywołującymi bradykardię (beta-blokery, blokery kanału wapniowego jak np. diltiazem i werapamil, klonidyna, guanfacyna, produkty lecznicze działające podobnie do naparstnicy);
- lekami wywołującymi zaburzenia równowagi elektrolitowej (jak np. diuretyki wywołujące hipokaliemię, pobudzające motorykę leki przeczyszczające, dożylnie podana amfoterycyna B, glikokortykoidy, tetrakozaktydy) - ze względu na ryzyko wystąpienia hipokaliemi wymagającej wyrównania;
- lekami przeciwarytmicznymi (klasy Ia jak np. chinidyna, dizopiramid, oraz klasy III jak np. amiodaron, sotalol);
- innymi lekami jak pimozyd, sultopryd, haloperidol; metadon, trójpierścieniowymi lekami przeciwdepresyjnymi, halofantryna; lit, cyzapryd, beprydyl, tiorydazyna, dożylnie podawana winkamina, pentamidyna, dożylnie podawana erytromycyna, sparfloksacyna, pochodne imipraminy.

Alkohol nasila działania uspokajające sulpirydu tak jak wszystkich neuroleptyków. Należy unikać wszelkich napojów alkoholowych i leków zawierających alkohol (patrz punkt 4.4 Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania).

Należy zachować ostrożność podczas jednoczesnego stosowania sulpirydu razem z innymi produktami wpływającymi depresyjnie na OUN ze względu na możliwość pogłębienia takiego działania, a w szczególności z:
- opioidami (stosowanymi jako analgetyki, leki przeciwkaszlowe lub leczenie substytucyjne);
- lekami przeciwbólowymi;
- neuroleptykami;
- barbituranami i lekami działającymi podobnie do barbituranów;
- benzodiazepinami;
- anksjolitykami i lekami nasennymi innymi niż benzodiazepiny;
- lekami przeciwdepresyjnymi wpływającymi uspokajająco (amitryptylina, doksepina, mianseryna, mirtazapina, trimipramina);
- wpływającymi uspokajająco lekami przeciwhistaminowe (blokujące receptor H_1);
- lekami przeciwnadciśnieniowymi działającymi ośrodkowo (baklofen, talidomid, pizotifen) ze względu na możliwe obniżenie ciśnienia krwi i nasilenie niedociśnienia ortostatycznego (efekt addytywny);
- lekami zobojętniającymi sok żołądkowy i sukralfatem (ze względu na zmniejszenie wchłaniania sulpirydu, dlatego sulpiryd należy podawać 2 godziny przed zastosowaniem tych leków);
- klonidyną i pochodnymi klonidyny.

Sulpiryd może zmniejszać skuteczność ropinirolu.

Stosowanie litu łącznie z sulpirydem zwiększa ryzyko wystąpienia efektów pozapiramidowych.

4.6 Wpływ na płodność, ciążę i laktację

Ciąża
Nie należy stosować sulpirydu podczas ciąży.

Sulpiryd przenika przez łożysko.
Dane na temat stosowania sulpirydu u ciężarnych kobiet oraz skutków podawania u samic zwierząt są niewystarczające do dokonania pełnej oceny bezpieczeństwa stosowania w okresie ciąży.

Podczas badań przeprowadzonych na zwierzętach nie stwierdzono szkodliwego działania sulpirydu w odniesieniu do rozwoju zarodka lub płodu, porodu i rozwoju pourodzeniowego. U noworodków matek długotrwale przyjmujących wysokie dawki neuroleptyków zgłoszono kilka przypadków wystąpienia objawów pozapiramidowych. Noworodki narażone w czasie trzeciego trymestru trwania ciąży na działanie

produktów przeciwpsychotycznych (w tym amisulprydu o budowie zbliżonej do sulpirydu) zaliczane są do grupy podwyższonego ryzyka wystąpienia przypadków działań niepożądanych, w tym zaburzeń pozapiramidowych i (lub) objawów odstawienia, które mogą zmieniać się w zależności od ciężkości przebiegu oraz czasu trwania porodu, który ma nastąpić. Obserwowano pobudzenie, wzmożone napięcie lub obniżone napięcie mięśni, drżenie, senność, zespół zaburzeń oddechowych lub zaburzenia związane z karmieniem. Dlatego stan zdrowia takich noworodków powinien być uważnie monitorowany.

Karmienie piersią
Nie należy stosować sulpirydu u kobiet karmiących piersią.

Sulpiryd przenika do mleka ludzkiego w ilości wystarczającej do wywołania działania farmakologicznego u dziecka.

4.7 Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwania maszyn

Pacjenci, w szczególności którzy prowadzą pojazdy i obsługują maszyny, powinni być ostrzeżeni o możliwości wystąpienia senności związanej ze stosowaniem tego leku.

4.8 Działania niepożądane

Poniżej zestawiono częstość wytypowania przypadków działań niepożądanych w oparciu o klasyfikację według układów i narządów zgodnie z terminologią MedDRA w grupach zdefiniowanych następująco: bardzo często (≥1/10), często (≥1/100 do <1/10), niezbyt często (≥1/1 000 do <1/100), rzadko (≥1/10 000 do <1/1 000), bardzo rzadko (<1/10 000), częstość nieznana (częstość nie może być określona na podstawie dostępnych danych).

Zaburzenia serca
Pojedyncze przypadki: *torsade de pointes.*

Zaburzenia endokrynologiczne
Częstość nieznana: hiperprolaktynemia, brak menstruacji, ginekomastia, oziębłość płciowa i impotencja.

Zaburzenia wątroby i dróg żółciowych
Bardzo rzadko: zwiększenie aktywności enzymów wątrobowych.

Zaburzenia układu nerwowego
Często: uspokojenie, senność.
Rzadko: objawy pozapiramidowe i ostra dyskineza, późna dyskineza (rytmiczne mimowolne ruchy przede wszystkim języka i (lub) mięśni twarzy) obserwowana, podobnie jak w przypadku innych neuroleptyków, po długotrwałym leczeniu. Antycholinergiczne leki przeciw parkinsonizmowi są w takich przypadkach nieskuteczne i mogą nawet nasilić objawy, złośliwy zespół neuroleptyczny (patrz punkt 4.4 Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania).

Zaburzenia układu rozrodczego i piersi
Częstość nieznana: mlekotok (poza okresem karmienia), brak miesiączki, ginekomastia.

Zaburzenia oka
Rzadko: rotacyjne ruchy gałki ocznej.

Zaburzenia naczyniowe
Częstość nieznana: niedociśnienie ortostatyczne.
W trakcie stosowania leków przeciwpsychotycznych odnotowano przypadki wystąpienia zakrzepów żylnych, w tym przypadki zakrzepicy żył głębokich.

Zaburzenia żołądka i jelit
Częstość nieznana: nadmierne ślinienie się.

Zaburzenia mięśniowo-szkieletowe i tkanki łącznej
Rzadko: spastyczny kręcz szyi, szczękościsk.

Ciąża, połóg i okres okołoporodowy
Noworodkowy zespół odstawienny (patrz punkt 4.6 „Wpływ na płodność, ciążę i laktację").

Badania diagnostyczne
Pojedyncze przypadki: wydłużenie odcinka QT.

Zaburzenia ogólne i stany w miejscu podania
Częstość nieznana: złośliwy zespół neuroleptyczny, który może zagrażać życiu (jak w przypadku wszystkich neuroleptyków, patrz punkt 4.4 Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania), zwiększenie masy ciała.

Zaburzenia skóry i tkanki podskórnej
Bardzo rzadko: wysypka plamkowo-grudkowa.

Zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych
Po dopuszczeniu produktu leczniczego do obrotu istotne jest zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych. Umożliwia to nieprzerwane monitorowanie stosunku korzyści do ryzyka stosowania produktu leczniczego. Osoby należące do fachowego personelu medycznego powinny zgłaszać wszelkie podejrzewane działania niepożądane za pośrednictwem Departamentu Monitorowania Niepożądanych Działań Produktów Leczniczych Urzędu Rejestracji Produktów Leczniczych, Wyrobów Medycznych i Produktów Biobójczych:
Al. Jerozolimskie 181C, 02-222 Warszawa
Tel.: + 48 22 49 21 301
Faks: + 48 22 49 21 309
Strona internetowa: https://smz.ezdrowie.gov.pl
Działania niepożądane można również zgłaszać podmiotowi odpowiedzialnemu.

4.9 Przedawkowanie

Objawy przedawkowania
Dane z piśmiennictwa na temat przedawkowania sulpirydu są niepełne. Kliniczne objawy zatrucia różnią się w zależności od wielkości przyjętej dawki np. u pacjentów mogą wystąpić objawy pozapiramidowe lub śpiączka. Po podaniu 1 do 3 g sulpirydu objawami przedawkowania były: niepokój ruchowy, zaburzenie świadomości oraz (rzadko) objawy pozapiramidowe. Po przyjęciu wyższych dawek od 3 do 7 g sulpirydu obserwowano: nadmierne pobudzenie, splątanie, objawy pozapiramidowe, a po przyjęciu ponad 7 g dodatkowo śpiączkę i obniżenie ciśnienia krwi.
Wielkość jednorazowej dawki wywołującej objawy toksyczne waha się od 1 g do 16 g sulpirydu, chociaż dane z piśmiennictwa wskazują brak zgonu po przyjęciu nawet tak wysokiej dawki sulpirydu jak 16 g.

Leczenie przedawkowania
Jak w przypadku zatrucia innymi lekami przyjętymi doustnie zaleca się wykonanie płukania żołądka i podanie węgla aktywowanego i produktów przeczyszczających w celu ograniczenia wchłaniania przyjętej dawki.
Nie jest znana żadna specyficzna odtrutka.
Zalecane jest prowadzenie leczenia objawowego i reanimacji, przy skrupulatnym i ciągłym monitorowaniu oddychania i czynności układu krążenia aż do chwili, gdy nastąpi wystarczająca poprawa stanu pacjenta.
W razie konieczności można podać leki przeciw parkinsonizmowi.
Sulpiryd jest tylko częściowo usuwany na drodze hemodializy.

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

5.1 Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: Leki przeciwpsychotyczne, pochodne benzamidowe; kod ATC: N05AL01.

Mechanizm działania
Sulpiryd należy do grupy benzamidów różniących się znacznie od fenotiazyn, butyrofenonów i tioksantyn. Posiada niektóre właściwości wspólne z klasycznymi neuroleptykami, jest antagonistą receptorów dopaminowych D_2 w OUN, jednak podany w dawkach terapeutycznych nie wykazuje wpływu kataleptycznego, nie ingeruje w zależny od dopaminy układ cyklazy adenylowej, nie wpływa na przemiany noradrenaliny i serotoniny (5HT), nieznacząco ingeruje w aktywność antycholinesterazy, nie wpływa na receptory muskarynowe i receptory kwasu gamma-aminomasłowego (GABA).

Działanie farmakodynamiczne
Sulpiryd wykazuje dwutorowe działanie: przeciwdepresyjne oraz przeciwpsychotyczne.
W niskich dawkach sulpiryd wywołuje działanie antydepresyjne, poprawę nastroju obserwuje się u pacjentów po kilkunastu dniach podawania sulpirydu. Zastosowanie sulpirydu w dawkach wyższych (300 do 600 mg na dobę) powoduje ustąpienie ostrych objawów schizofrenicznych. Efekty uspokojenia, skutki zablokowania receptorów alfa-adrenergicznych oraz objawy pozapiramidowe są słabiej zaznaczone po podaniu sulpirydu niż w przypadku zastosowania klasycznych neuroleptyków typu fenotiazyn. Efekt terapeutyczny sulpirydu w leczeniu schizofrenii obserwuje się po 8 do 12 tygodniach stosowania.
Sulpiryd jako antagonista receptorów dopaminowych D_2 pobudza wydzielanie prolaktyny. Ponadto poprawia przepływ krwi i wydzielanie śluzu przez błony śluzowe żołądka i dwunastnicy oraz działa przeciwwymiotnie.

5.2 Właściwości farmakokinetyczne

Wchłanianie
Sulpiryd powoli wchłania się z przewodu pokarmowego. Obecność pokarmu zmniejsza absorpcję o około 30%. Dostępność biologiczna leku jest mała (27-34%) i jest osobniczo zmienna.

Dystrybucja
Lek jest szybko dystrybuowany w tkankach; w niewielkim stopniu przenika przez barierę krew-mózg. Maksymalne stężenie w osoczu osiąga po 3-6 godzinach po podaniu doustnym.
Sulpiryd słabo wiąże się z białkami osocza krwi (nie więcej niż w ok. 40%), a objętość dystrybucji określono na 1 do 2,7 L/kg mc. Okres półtrwania w osoczu wynosi około 8-9 godzin, u pacjentów z ciężką niewydolnością nerek wydłużony jest do 20-26 godzin po podaniu dożylnym. Całkowity klirens sulpirydu u zdrowych osobników wynosi około 7,5 L/godz.

Metabolizm
U ludzi zaledwie 5 % dawki podlega przemianom metabolicznym.

Eliminacja
Około 95 % dawki sulpirydu wydalane jest w postaci niezmienionej (przez nerki wraz z moczem, bardzo małe ilości wraz z kałem). Około 80 % dawki sulpirydu jest usuwane z organizmu podczas pierwszych 24 godzin od podania. W niewielkiej ilości sulpiryd przechodzi do mleka.

5.3 Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

Ekspozycja na sulpiryd zwiększa wydzielanie prolaktyny, co przyczyniało się do zwiększenia ryzyka występowania guzów sutka podczas badań kancerogenności wykonanych na zwierzętach doświadczalnych. Hiperprolaktynemia u ludzi może powodować pogorszenie rokowania stanu zdrowia pacjentów w przypadkach istniejących guzów sutka. Istnienie takiej pełnej zależności w odniesieniu do ludzi nie zostało jednak potwierdzone.

Wyniki badania kancerogenności sulpirydu uzyskane na szczurach rasy Wistar nie wskazują na zależne od wielkości dawki zwiększenie częstości występowania nowotworów wywodzących się z komórek wysp trzustkowych, można jednak wykluczyć bezpośredni wpływ stymulujący na podziały komórek wysp trzustkowych. Stwierdzona korelacja ekspozycji na sulpiryd z wzrostem częstości występowania nowotworów u szczurów jest gatunkowo-specyficzną cechą odnosząca się do tego gatunku zwierząt

laboratoryjnych. Podczas podobnych eksperymentów wykonanych u szczurów innej rasy oraz u myszy nie wykryto zwiększonej częstości występowania nowotworów trzustki. Zgodnie z obecnym stanem wiedzy znaczenia tych danych dla zdrowia ludzi uznaje się za nieistotne.

Dane na temat embriotoksyczności sulpirydu są niepełne. U płodów szczurzych eksponowanych na sulpiryd w ostatnim trymestrze trwania ciąży zaobserwowano wzrost stężenia prolaktyny i masy ciała.
Brak wystarczających danych pozwalających na ocenę możliwych skutków wpływu podawania sulpirydu na rozwój noworodków po prenatalnej i poporodowej ekspozycji potomstwa.

Podczas długoterminowych badań prowadzonych na zwierzętach laboratoryjnych z zastosowaniem leków neuroleptycznych (z sulpirydem włącznie), stwierdzono zwiększenie liczby przypadków występowania guzów gruczołów wydzielania wewnętrznego (niektóre z nich były złośliwe) u niektórych, ale nie u wszystkich gatunków badanych szczurów i myszy. Brak takich danych w odniesieniu do ludzi. Nie określono związku między stosowaniem leku neuroleptycznego, a występowaniem guzów u ludzi. Jednak przed zastosowaniem neuroleptyków u pacjentów z rozwijającym się procesem nowotworowym lub chorobą nowotworową w wywiadzie, należy rozważyć stosunek korzyści terapeutycznej do ryzyka.

6. DANE FARMACEUTYCZNE

6.1 Wykaz substancji pomocniczych

Skrobia żelowana, kukurydziana
Laktoza jednowodna
Powidon K 30
Celuloza mikrokrystaliczna
Magnezu stearynian

6.2 Niezgodności farmaceutyczne

Nie dotyczy.

6.3 Okres ważności

4 lata

6.4 Specjalne środki ostrożności podczas przechowywania

Przechowywać w temperaturze poniżej 25°C.

6.5 Rodzaj i zawartość opakowania

Sulpiryd Hasco, 50 mg, tabletki
Blistry PVC/PVDC/Aluminium w tekturowym pudełku.
24 tabletki w opakowaniu
30 tabletek w opakowaniu
60 tabletek w opakowaniu
120 tabletek w opakowaniu

Sulpiryd Hasco, 100 mg, tabletki
Blistry PVC/PVDC/Aluminium w tekturowym pudełku.
24 tabletki w opakowaniu
30 tabletek w opakowaniu
60 tabletek w opakowaniu
120 tabletek w opakowaniu

Sulpiryd Hasco, 200 mg, tabletki
Blistry PVC/PVDC/Aluminium w tekturowym pudełku.
12 tabletek w opakowaniu
30 tabletek w opakowaniu
60 tabletek w opakowaniu
120 tabletek w opakowaniu

Nie wszystkie wielkości opakowań muszą znajdować się w obrocie.

6.6 Specjalne środki ostrożności dotyczące usuwania

Bez specjalnych wymagań.

Wszelkie niewykorzystane resztki produktu leczniczego lub jego odpady należy usunąć zgodnie z lokalnymi przepisami.

7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

„PRZEDSIĘBIORSTWO PRODUKCJI FARMACEUTYCZNEJ HASCO-LEK” S.A.
ul. Żmigrodzka 242 E
51-131 Wrocław
Tel. + 48 (71) 352 95 22
Faks +48 (71) 352 76 36

8. NUMERY POZWOLEŃ NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Sulpiryd Hasco, 50 mg, tabletki	Pozwolenie nr 24865
Sulpiryd Hasco, 100 mg, tabletki	Pozwolenie nr 24866
Sulpiryd Hasco, 200 mg, tabletki	Pozwolenie nr 24867

9. DATA WYDANIA PIERWSZEGO POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU I DATA PRZEDŁUŻENIA POZWOLENIA

Data wydania pierwszego pozwolenia na dopuszczenie do obrotu: 17.08.2018
Data ostatniego przedłużenia pozwolenia:

10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO