

SÚHRN CHARAKTERISTICKÝCH VLASTNOSTÍ LIEKU

1. NÁZOV LIEKU

Betamaks 50 mg tablety
Betamaks 100 mg tablety
Beamaks 200 mg tablety

2. KVALITATÍVNE A KVANTITATÍVNE ZLOŽENIE

Jedna tableta obsahuje 50 mg, 100 mg alebo 200 mg sulpiridu (*sulpiridum*).

Pomocná látka so známym účinkom:

Jedna tableta s obsahom 50 mg liečiva obsahuje 5,5 mg monohydrátu laktózy.
Jedna tableta s obsahom 100 mg liečiva obsahuje 11,0 mg monohydrátu laktózy.
Jedna tableta s obsahom 200 mg liečiva obsahuje 22,0 mg monohydrátu laktózy.

Úplný zoznam pomocných látok, pozri časť 6.1.

3. LIEKOVÁ FORMA

Tableta.

50 mg: biele alebo takmer biele okrúhle ploché tablety so skosenými hranami. Rozmery tablety: priemer približne 6,0 mm, výška 2,1 mm.

100 mg: biele alebo takmer biele okrúhle ploché tablety so skosenými hranami. Rozmery tablety: priemer približne 7,0 mm, výška 3,1 mm.

200 mg: biele alebo takmer biele okrúhle ploché tablety so skosenými hranami a ryhou na jednej strane. Rozmery tablety: priemer približne 10,0 mm, výška 3,1 mm. Tableta sa môže rozdeliť na rovnaké dávky.

4. KLINICKÉ ÚDAJE

4.1 Terapeutické indikácie

- Liečba depresívnych porúch so psychotickými príznakmi, keď liečba antidepresívami bola neúspešná, a na liečbu iných závažných foriem depresie rezistentných na antidepresíva.
- Liečba akútnych a chronických foriem schizofrénie.

Liek je určený na liečbu dospelých.

4.2 Dávkovanie a spôsob podávania

Dávkovanie

Pokyny pre dávkovanie

Veľkosť dávky a trvanie liečby sa má upraviť podľa individuálnej reakcie pacienta a podľa typu a závažnosti nežiaducich účinkov.

Liečba deficitnej schizofrénie

Liečba sa začína dávkou 200 mg sulpiridu denne rozdelenou do 2 jednotlivých dávok. Zvyčajná denná dávka je 200-600 mg rozdelená do 2 až 4 jednotlivých dávok.

Liečba produktívnej schizofrénie

Liečba sa začína dávkou 300 mg sulpiridu denne rozdelenou do 3 jednotlivých dávok. Zvyčajná denná dávka je 300-600 mg rozdelená do 2 až 4 jednotlivých dávok.

Všeobecne sa nemá prekročiť denná dávka 1000 mg sulpiridu rozdelená do viacerých dávok.

Schizofrénia rezistentná na liečbu

Maximálnu dennú dávku 1600 mg sulpiridu je možné podať iba v jednotlivých prípadoch a iba na predpis lekára-psihiatra.

Akútne chorobné stavy môžu vyžadovať úvodnú liečbu parenterálnym sulpiridom. Na trhu nie je k dispozícii žiadna parenterálna lieková forma Betamaksu.

Liečba depresie s psychotickými príznakmi a depresie rezistentnej na liečbu

Liečba sa začína dávkou 50 až 150 mg/deň rozdelenou do 3 jednotlivých dávok. Udržiavacia dávka je 150 až 300 mg/deň.

Vyššie denné dávky zvyčajne nie sú potrebné, môžu sa však použiť v individuálnych prípadoch podľa posúdenia lekára.

Akútne chorobné stavy môžu vyžadovať úvodnú liečbu parenterálnym sulpiridom. Na trhu nie je k dispozícii žiadna parenterálna lieková forma Betamaksu.

Pediatrická populácia

Bezpečnosť a účinnosť Betamaksu u detí neboli stanovené. Nie sú k dispozícii žiadne údaje.

Starší pacienti

Starší pacienti dostávajú polovicu z vyššie uvedených dávok pre dospelých.

Pacienti s poruchou funkcie obličiek

Pacienti s poruchou funkcie obličiek majú dostávať nižšie denné dávky v závislosti od závažnosti renálnej insuficiencie. Je potrebné dodržiavať nasledujúci pokyny pre dávkovanie:

- klírens kreatinínu 30-60 ml/min: 50 % dennej dávky;
- klírens kreatinínu 10-30 ml/min: 30 % dennej dávky;
- klírens kreatinínu nižší ako 10 ml/min: 20 % dennej dávky.

Spôsob podávania

Perorálne podanie.

Tableta sa má prehltnúť celá s dostatočným množstvom vody.

4.3 Kontraindikácie

- Precitlivenosť na liečivo alebo na ktorúkoľvek z pomocných látok uvedených v časti 6.1.
- Prípady akútnej intoxikácie alkoholom, hypnotikami, (opioïdnými) analgetikami a psychotropnými látkami.
- Prípady manických psychóz.
- Organický psychosyndróm: ochorenie mozgu na organickej báze, ktoré zvyčajne spôsobuje agitáciu, najmä u staršej populácie.
- Parkinsonova choroba.
- V kombinácii s levodopou (pozri časť 4.5).
- Záchvaty (napr. epilepsia).
- Nádory nadobličiek (feochromocytóm).
- Hyperprolaktinémia.
- Prolaktín-dependentné nádorové ochorenie, napr. prolaktinóm hypofýzy ako aj všetky karcinómy prsníka.

4.4 Osobitné upozornenia a opatrenia pri používaní

Upozornenia

Predĺženie QT

Sulpirid môže vyvolať predĺženie QT (pozri časť 4.8). Je známe, tento účinok môže potenciovat' riziko vážnych ventrikulárnych arytmií ako je *torsade de pointes*.

Pred podaním, a ak je to s prihliadnutím na klinický stav pacienta možné, je vhodné sledovať faktory, ktoré by mohli podporiť výskyt týchto porúch rytmu, ako napríklad:

- bradykardia menej ako 55 úderov za minútu,
- elektrolytová nerovnováha, najmä hypokaliémia,
- vrodené predĺženie QT,
- súbežná liečba liekmi, ktoré môžu spôsobiť výraznú bradykardiu (< 55 úderov za minútu),
- hypokaliémia,
- znížené intrakardiálne vedenie
- alebo predĺženie QT (pozri časť 4.5).

Je potrebné predchádzať súbežnej liečbe s inými neuroleptikami (pozri časť 4.5).

Mozgová príhoda

V randomizovaných placebo kontrolovaných klinických štúdiách, vykonaných u starších pacientov s demenciou a liečených určitými atypickými antipsychotickými liekmi, bolo pozorované strojnásobenie rizika mŕtvice. Mechanizmus tohto zvýšenia rizika nie je známy. Zvýšenie rizika pre iné antipsychotiká alebo u iných skupín pacientov nie je možné vylúčiť.

Sulpirid sa musí používať s opatrnosťou u pacientov s rizikovými faktormi pre vznik mozgovej príhody.

Neuroleptický malígny syndróm

Neuroleptický malígny syndróm (NMS) je potenciálne fatálny komplex symptómov spojený s antipsychotikami. Klinickými prejavmi NMS sú hyperpyrexia, svalová rigidita, poruchy vedomia a príznaky autonómnej nestability (nepravdivý pulz alebo krvný tlak, tachykardia, diaforéza a srdcová arytmia). Medzi ďalšie príznaky patrí zvýšená hladina kreatínfosfokinázy, myoglobinúria (rabdomyolýza) a akútne zlyhanie obličiek. Ak sa u pacienta objavia známky a príznaky svedčiace o NMS alebo sa u neho vyskytne nevysvetliteľná vysoká horúčka bez iných klinických prejavov NMS, musia sa vysadiť všetky antipsychotiká vrátane sulpiridu a musí sa zahájiť vhodná podporná liečba a starostlivé sledovanie.

Akútna porfýria

V prípade akútnej porfýrie je treba sa vyhnúť použitiu sulpiridu.

Pediatrická populácia

Účinnosť a bezpečnosť Betamaksu u detí neboli preukázané. Preto sa jeho použitie u tejto skupiny pacientov neodporúča.

Zvýšená úmrtnosť u starších pacientov s demenciou

U starších pacientov s psychózou súvisiacou s demenciou, ktorí sú liečení antipsychotikami, existuje zvýšené riziko smrti. Analýzy výsledkov sedemnástich placebo kontrolovaných skúšaní (stredná doba trvania 10 týždňov), s veľkým podielom pacientov užívajúcich atypické antipsychotické lieky, ukázali u pacientov liečených liekom riziko úmrtia 1,6 až 1,7-násobné riziko úmrtia u pacientov užívajúcich placebo. Počas typického kontrolovaného 10-týždňového skúšania bola miera úmrtnosti u pacientov liečených liekom približne 4,5 % v porovnaní s mierou približne 2,6 % v skupine s placebo. Hoci príčiny smrti v klinických skúšaní s atypickými antipsychotikami boli rôzne, väčšina úmrtí sa zdala byť buď kardiovaskulárneho charakteru (napr. zlyhanie srdca, náhla smrť) alebo infekčnej povahy (napr. pneumónia). Observačné štúdie naznačujú, že rovnako ako liečba atypickými antipsychotikami, môže liečba konvenčnými atipsychotikami viesť k zvýšeniu úmrtnosti. Nie je zrejmé, do akej miery možno nálezy zvýšenej mortality v observačných štúdiách pripísať antipsychotikám alebo iným charakteristikám pacientov.

Údaje z dvoch veľkých observačných štúdií preukázali, že staršie osoby s demenciou, ktoré sú liečené konvenčnými antipsychotikami, majú malé zvýšené riziko úmrtia v porovnaní s tými, ktorí nie sú liečení. Nie sú k dispozícii dostatočné údaje na spoľahlivý odhad presnej miery rizika, a príčina zvýšeného rizika nie je známa. Sulpirid nie je schválený na liečbu porúch správania spojených s demenciou.

Venózna tromboembólia

Pre antipsychotiká boli hlásené prípady venózne tromboembólie (VTE). Pretože u pacientov liečených antipsychotikami sa často vyskytujú získané rizikové faktory pre VTE, majú sa pred a počas liečby sulpiridom zistiť všetky možné rizikové faktory pre VTE a majú sa prijať preventívne opatrenia.

Rakovina prsníka

Sulpirid môže zvyšovať hladiny prolaktínu. Preto je potrebná opatrnosť a pacienti s rakovinou prsníka v osobnej alebo rodinnej anamnéze majú byť počas liečby sulpiridom starostlivo sledovaní.

Opatrenia

- Po upozornení na prípady hyperglykémie u pacientov liečených atypickými antipsychotikami, musí sa u pacientov s diagnostikovaným diabetes mellitus alebo s rizikovými faktormi pre diabetes, ktorí začali liečbu sulpiridom, primerane monitorovať hladina glukózy v krvi.
- Neuroleptiká, vrátane sulpiridu, môžu znižovať prah záchvatov, a pri sulpiride boli zaznamenané prípady záchvatov (pozri časť 4.8). Preto pacienti s epilepsiou v anamnéze musia byť počas liečby sulpiridom starostlivo sledovaní.
- Sulpirid sa vylučuje obličkami. Pri poruche funkcie obličiek sa musí dávka znížiť (pozri časť 4.2).
- Sulpirid, podobne ako iné neuroleptiká, musí byť u starších pacientov používaný s opatrnosťou, pretože môže dôjsť k zvýšeniu rizika ortostatickej hypotenzie, sedácie a extrapyramídových porúch ako je tardívna dyskinéza. Počas liečby sa odporúča sledovanie skorých príznakov tardívnej dyskinézy a zníženie dávky alebo vysadenie liečby, aby sa zabránilo prejavom závažnejších symptómov. Rovnako je odporúčané sledovanie funkcie srdca. Starší pacienti môžu potrebovať nižšiu počiatočnú dávku a jej postupnú úpravu (pozri časť 4.2).
- U pacientov s agresívnym správaním alebo agitáciou s impulzívnosťou môže byť sulpirid podávaný so sedatívom.
- U antipsychotík, vrátane sulpiridu, boli hlásené prípady leukopénie, neutropénie a agranulocytózy. Infekcie alebo horúčka neznámeho pôvodu môžu byť príznakom krvnej dyskrázie (pozri časť 4.8), preto vyžadujú okamžité hematologické vyšetrenie.
- Sulpirid má anticholinergický účinok, a preto musí byť používaný s opatrnosťou u pacientov, ktorí majú v anamnéze glaukóm, ileus, vrodenú gastrointestinálnu stenózu, retenciu moču alebo hyperpláziu prostaty.
- Kvôli riziku hypertenznej krízy sa sulpirid musí používať s opatrnosťou u pacientov s hypertenziou, najmä u staršej populácie.

Tento liek obsahuje laktózu. Pacienti so zriedkavými dedičnými problémami galaktózovej intolerancie, celkovým deficitom laktázy alebo glukózo-galaktózovou malabsorpciou nesmú užívať tento liek.

4.5 Liekové a iné interakcie

Kontraindikované súbežné použitie

- Levodopa: recipročný antagonizmus účinkov medzi levodopou a neuroleptikami (pozri časť 4.3).

Neodporúčané súbežné použitie

- Alkohol môže potenciovat' sedatívny účinok neuroleptík. Je potrebné vyhnúť sa konzumácii alkoholických nápojov a liekov obsahujúcich alkohol.
- Antiparkinsoniká (vrátane ropinirolu): recipročný antagonizmus.
- Kombinácia s liekmi, ktoré môžu predĺžiť QT interval alebo vyvolať *torsade de pointes* (pozri časť 4.4):
 - Lieky vyvolávajúce bradykardiu ako napr. betablokátory, blokátory kalciového kanála a lieky vyvolávajúce bradykardiu ako napr. diltiazem a verapamil, klonidín, guanfacín; digitalis.
 - Lieky, ktoré indukujú hypokaliémiu: hypokaliemické diuretiká, stimulačné laxatíva, amfotericín B i.v., glukokortikoidy, tetrakozaktidy. Hypokaliémia sa musí upraviť.
 - Antiarytmiká triedy Ia, ako je chinidín a disopyramid.
 - Antiarytmiká triedy III, ako je amiodarón a sotalol.
 - Iné lieky ako je pimozid, sultoprid, haloperidol, thioridazín, metadón, imipramínové antidepresíva, lítium, bepridil, cisaprid, erytromycín i.v., vinkamín i.v., halofantrín, pentamidín a sparfloxacín.

Interakcie, ktoré treba zvážiť

- Sukralfát: po súbežnom podaní sulpiridu a sukralfátu sa zníži absorpcia sulpiridu, a plazmatické hladiny sulpiridu môžu byť znížené, čo môže spôsobiť zníženie alebo stratu terapeutickkej aktivity. Preto má byť sulpirid podaný najmenej dve hodiny pred sukralfátom.
- Antacidá: po súbežnom podaní sulpiridu s antacidami obsahujúcimi horčík alebo hliník sa zníži absorpcia sulpiridu, a plazmatické hladiny sulpiridu môžu byť znížené, čo môže spôsobiť zníženie alebo stratu terapeutickkej aktivity. Preto má byť sulpirid podaný najmenej dve hodiny pred antacidami.
- Antihypertenzíva: antihypertenzívny účinok a možnosť zvýšenia výskytu posturálnej hypotenzie (aditívny účinok).
- Lieky tlmiace CNS vrátane narkotík, analgetík, sedatívnych H1 antihistaminík, barbiturátov, benzodiazepínov a iných anxiolytík, klonidínu a derivátov.
- Lítium: lítium zvyšuje riziko extrapyramídových vedľajších účinkov. Pri prvom príznaku neurotoxicity je odporúčané prerušenie podávania oboch liekov.
- Iné lieky, ktoré môžu spôsobiť kŕče: neuroleptiká znižujúce epileptogénny prah; pro podávaní s inými liekmi, ktoré môžu spôsobiť kŕče (haloperidol), je potrebná opatrnosť.

4.6 Fertilita, gravidita a laktácia

Gravidita

O použití sulpiridu u tehotných žien sú k dispozícii iba veľmi obmedzené údaje. Bezpečnosť sulpiridu počas gravidity u ľudí nebola stanovená.

Sulpirid prechádza placentou. Štúdie reprodukčnej toxicity na zvieratách nie sú dostatočné (pozri časť 5.3).

Užívanie sulpiridu sa neodporúča počas tehotenstva a u žien vo fertilnom veku, ktoré nepoužívajú účinnú antikoncepciu, pokiaľ prínos nepreváži potenciálne riziká. U novorodencov vystavených pôsobeniu antipsychotík, vrátane Betamaksu, počas tretieho trimestra tehotenstva existuje riziko nežiaducich reakcií vrátane extrapyramídových symptómov a/alebo abstinenčného syndrómu, ktoré sa môžu líšiť v stupni závažnosti a dĺžke trvania po narodení (pozri časť 4.8). Boli hlásené prípady agitácie, hypertónie, hypotónie, trasu, ospalosti, dýchacích ťažkostí alebo porúch kŕmenia. Novorodenci preto musia byť starostlivo sledovaní.

Dojčenie

Sulpirid sa vylučuje do materského mlieka v dost' veľkých množstvách, vysoko nad akceptovanou hodnotou 10 % dávky užíwanej matkou upravenej podľa telesnej hmotnosti, ale jeho koncentrácie v krvi dojčených detí neboli hodnotené. Informácie o účinkoch sulpiridu u novorodencov/dojčiat nie sú dostačujúce.

Po zvážení prínosu dojčenia pre dieťa a prínosu liečby pre ženu sa musí urobiť rozhodnutie, či ukončiť dojčenie alebo ukončiť liečbu sulpiridom.

Fertilita

U liečených zvierat bol pozorovaný pokles fertility spojený s farmakologickými účinkami liečiva (účinnok sprostredkovaný prolaktínom).

4.7 Ovplyvnenie schopnosti viesť vozidlá a obsluhovať stroje

Liek môže spôsobiť ospalosť, závrat, poruchy zraku a zhoršiť duševné a/alebo fyzické schopnosti potrebné na výkon nebezpečných úloh, ako je obsluha strojov alebo vedenie vozidla. Pri vedení vozidla alebo obsluhu strojov je potrebná opatrnosť, najmä preto, že osobitná citlivosť každého pacienta na liek nebola stanovená.

4.8 Nežiaduce účinky

Súhrn bezpečnostného profilu

Klinicky dôležité a terapeuticky limitujúce sú neurologické poruchy extrapyramídových vedľajších účinkov. Extrapyramídové symptómy (akatízia, akútna dystónia a parkinsonizmus) sú spojené so sulpiridom, vyskytujú sa u 12,8 % pacientov užívajúcich dávky ≤ 1200 mg/deň.

Veľmi zriedkavým, ale dramatickým nežiaducim účinkom je neuroleptický malígny syndróm (NMS) (rigidita kostrového svalstva, hypertermia, stupor), ktorý môže pri absencii intenzívnych protiopatrení skončiť smrťou.

Rovnako ako aj u iných neuroleptík je neuroleptický malígny syndróm potenciálne fatálnou komplikáciou.

Sulpirid môže vyvolať predĺženie QT intervalu. Je známe, že tento účinok potenciuje riziko závažných ventrikulárnych arytmií, ako je *torsade de pointes* (TdP). Pred podaním, a ak je to s prihliadnutím na klinický stav pacienta možné, sa odporúča monitorovať faktory, ktoré by mohli podporiť výskyt týchto porúch rytmu.

Ako najčastejšie nežiaduce reakcie sa môžu vyskytnúť hyperprolaktinémia, poruchy spánku, zápcha, zvýšenie pečenej enzýmov, makulopapulárna vyrážka, bolesť na hrudníku, galaktorea a zvýšenie telesnej hmotnosti.

Nežiaduce reakcie sú uvedené podľa tried orgánových systémov MedDRA a konvencie frekvencie MedDRA: veľmi časté ($\geq 1/10$), časté ($\geq 1/100$ až $< 1/10$), menej časté ($\geq 1/1\ 000$ až $< 1/100$), zriedkavé ($\geq 1/10\ 000$ až $< 1/1\ 000$), veľmi zriedkavé ($< 1/10\ 000$), neznáme (z dostupných údajov).

Tabuľkový súhrn nežiaducich reakcií

Poruchy krvi a lymfatického systému	menej časté	leukopénia (pozri časť 4.4)
	neznáme	neutropénia, agranulocytóza (pozri časť 4.4)
Poruchy imunitného systému	neznáme	anafylaktické reakcie: urtikária, dyspnoe, hypotenzia, anafylaktický šok
Poruchy metabolizmu a výživy	neznáme	hyponatrémia, syndróm neprimeranej sekrécie antidiuretického hormónu (SIADH)
Poruchy endokrinného systému	časté	hyperprolaktinémia
Psychické poruchy	časté	nespavosť
	neznáme	zmätenosť
Poruchy nervového systému	časté	sedácia alebo ospalosť, extrapyramídové symptómy (tieto symptómy sú zvyčajne reverzibilné po podaní antiparkinsoník), parkinsonizmus, tras, akatízia
	menej časté	hypertónia, dyskinéza, dystónia
	zriedkavé	okulogyrická kríza

	neznáme	záchvaty, neuroleptický malígny syndróm (rovnako ako u všetkých neuroleptík je neuroleptický malígny syndróm (pozri časť 4.4) život ohrozujúca komplikácia), hypokinéza, tardívna dyskinéza (charakterizovaná rytmickými a mimovoľnými pohybmi hlavne jazyka a/alebo tváre, ako u všetkých neuroleptík bola hlásená po ich podávaní dlhšom ako 3 mesiace. Liečba antiparkinsonikami je neúčinná alebo môže vyvolať zhoršenie príznakov.)
Poruchy srdca a srdcovej činnosti	zriedkavé	ventrikulárna arytmia, ventrikulárna tachykardia, ventrikulárna fibrilácia
	neznáme	predĺženie QT intervalu na elektrokardiograme, zástava srdca, <i>torsades de pointes</i> , náhla smrť (pozri časť 4.4)
Poruchy ciev	menej časté	ortostatická hypotenzia
	neznáme	venózna tromboembólia, pľúcna embólia, hlboká žilová trombóza, zvýšený krvný tlak (pozri časť 4.4)
Poruchy dýchacej sústavy, hrudníka a mediastína	neznáme	aspiračná pneumónia (najmä v spojení s inými látkami tlmiacimi CNS)
Poruchy gastrointestinálneho traktu	časté	Zápcha
	menej časté	hypersekrécia slinných žliaz
Poruchy pečene a žlčových ciest	časté	zvýšenie pečeňových enzýmov
	neznáme	hepatocelulárne, cholestatické alebo zmiešané poškodenie pečene
Poruchy kože a podkožného tkaniva	časté	makulopapulárna vyrážka
Poruchy kostrovej a svalovej sústavy a spojivového tkaniva	neznáme	tortikolis, trizmus, rabdomyolýza
Stavy v gravidite, šestonedelí a perinatálnom období	neznáme	extrapyramídové symptómy, abstinenčný syndróm u novorodencov (pozri časť 4.6)
Poruchy reprodukčného systému a prsníkov	časté	bolesť na hrudníku, galaktorea
	menej časté	zväčšenie prsníkov, amenorea, abnormálny orgazmus, erektilná dysfunkcia
	neznáme	gynekomastia
Celkové poruchy a reakcie v mieste podania	časté	zvýšenie telesnej hmotnosti
	neznáme	hypertermia
Laboratórne a funkčné vyšetrenia	neznáme	zvýšená hladina kreatínfosfokinázy v krvi

Hlásenie podozrení na nežiaduce reakcie

Hlásenie podozrení na nežiaduce reakcie po registrácii lieku je dôležité. Umožňuje priebežné monitorovanie pomeru prínosu a rizika lieku. Od zdravotníckych pracovníkov sa vyžaduje, aby hlásili akékoľvek podozrenia na nežiaduce reakcie na **národné centrum hlásenia uvedené v Prílohe V**.

4.9 PredávkovaniePrejavy a symptómy

Skúsenosti s predávkovaním sulpiridom sú obmedzené.

V prípade predávkovania sa môžu vyskytnúť motorické poruchy, najmä vo forme poruchy hybnosti svalov šije a tonický kŕč čeľusťových svalov s vysunutím jazyka. U niektorých pacientov sa môže vyvinúť život ohrozujúci parkinsonovský syndróm a kóma.

Prípady fatálnych následkov boli hlásené najmä v kombinácii s inými psychotropnými látkami.

Sulpirid je čiastočne odstránený hemodialýzou.

Liečba

Neexistuje žiadne špecifické antidotum sulpiridu. Liečba je iba symptomatická. Musia sa však zaviesť vhodné podporné opatrenia s dôsledným monitorovaním životných funkcií; odporúča sa monitorovanie činnosti srdca až do zotavenia pacienta (riziko predĺženia QT a následné ventrikulárnej arytmie).

V prípade závažných extrapyramídových príznakov musia byť podané anticholinergiká.

5. FARMAKOLOGICKÉ VLASTNOSTI

5.1 Farmakodynamické vlastnosti

Farmakoterapeutická skupina: Antipsychotiká, benzamidy, ATC kód: N05AL01

Mechanizmus účinku

Sulpirid je atypické neuroleptikum, člen skupiny substituovaných benzamidov.

Sulpirid špecificky antagonizuje D2 a D3 dopamínové receptory.

Liek sa selektívne viaže na dopamínové D2 a D3 receptory v limbickom systéme. Nízke dávky sulpiridu prednostne blokujú presynaptické dopamínové D2/D3 autoreceptory, čím sa zvyšuje dopaminergný prenos, zatiaľ čo vyššie dávky blokujú postsynaptické receptory, a tak inhibujú dopaminergnú hyperaktivitu.

Farmakodynamické účinky

U pacientov s psychotickými ochoreniami s negatívnymi symptómami je sulpirid účinný v dávkach 150 až 600 mg/deň. V tomto rozsahu dávok nemá sulpirid prakticky žiadny účinok na pozitívne symptómy. Dávky 600-1600 mg/deň zlepšuje pozitívne symptómy u pacientov s akútnou alebo chronickou psychózou. Iba veľmi vysoké dávky sulpiridu vyvolávajú sedatívne účinky.

5.2 Farmakokinetické vlastnosti

Absorpcia

Po intramuskulárnej injekcii 100 mg sulpiridu boli maximálne koncentrácie v plazme (C_{max}) 2,2 mg/l dosiahnuté v priebehu 30 minút.

Po perorálnom podaní sa sulpirid absorbuje počas 4,5 hodiny po podaní. C_{max} odpovedajúci orálnej dávke 200 mg (tableta) je medzi 0,5 a 1,8 mg/l, a medzi 0,1 mg a 0,6 mg/l po 50 mg kapsule. Po dávke 50 mg perorálneho roztoku bola C_{max} 0,28 mg/l.

Distribúcia

Biologická dostupnosť perorálnych liekových foriem je medzi 25 % a 35 %, s veľkou variabilitou medzi jedincami. Plazmatické hladiny sulpiridu sú úmerné podanej dávke.

Sulpirid rýchlo preniká do telesných tkanív, najmä pečene a obličiek. Prestup do mozgu je malý. Menej ako 40 % liečiva sa viaže na plazmatické bielkoviny. Koeficient distribúcie plazmou je pre erytrocyty rovný 1.

Metabolizmus

Sulpirid nie je u človeka aktívne metabolizovaný.

Eliminácia

Sulpirid sa vylučuje hlavne obličkami glomerulárnou filtráciou. Renálny klírens sa zvyčajne rovná celkovému klírnsu. 92 % intramuskulárnej dávky sa vylučuje v nezmenenej forme močom. Množstvo vylučované materským mliekom sa odhaduje na 1/1000 dennej dávky.

Plazmatický eliminačný polčas je 7 hodín. Distribučný objem v rovnovážnom stave je 0,94 l/kg (0,6 až 1,5 l/kg). Celkový klírens je 126 ml/min.

5.3 Predklinické údaje o bezpečnosti

Experimentálne štúdie na zvieratách nepreukázali priamy alebo nepriamy dôkaz teratogénnych účinkov na embryo-fetálny vývoj, pôrod alebo postnatálny vývoj.

U zvierat liečených sulpiridom sa pozorovalo zníženie fertility, čo súvisí s farmakologickými účinkami lieku (účinnok sprostredkovaný prolaktínom). Tento účinok je po prerušení liečby reverzibilný.

Dlhodobé podávanie neuroleptík, ako napríklad sulpirid, bolo spojené so zvýšeným výskytom endokrinných nádorov, hoci takéto nálezy neboli u všetkých sledovaných potkanov a myši časté a význam týchto nálezov pre človeka je neistý.

6. FARMACEUTICKÉ INFORMÁCIE

6.1 Zoznam pomocných látok

Monohydrát laktózy
Metylcelulóza
Zemiakový škrob
Kolooidný oxid kremičitý, bezvodý
Stearát horečnatý
Mastenec

6.2 Inkompatibility

Neaplikovateľné.

6.3 Čas použiteľnosti

3 roky

6.4 Špeciálne upozornenia na uchovávanie

Tento liek nevyžaduje žiadne zvláštne podmienky na uchovávanie.

6.5 Druh obalu a obsah balenia

PVC/Al blister.
10 tabliet v blistri. 3 alebo 10 blistrov v kartónovej škatuľke.

6.6 Špeciálne opatrenia na likvidáciu a iné zaobchádzanie s liekom

Žiadne zvláštne požiadavky.

Všetok nepoužitý liek alebo odpad vzniknutý z lieku sa má zlikvidovať v súlade s národnými požiadavkami.

7. DRŽITEĽ ROZHODNUTIA O REGISTRÁCI

AS GRINDEKS.
Krustpils iela 53, Rīga, LV-1057, Lotyšsko
Tel: +371 67083205
Fax: +371 67083505

e-mail: grindeks@grindeks.com

8. REGISTRÁČNÉ ČÍSLA

Betamaks 50 mg tablety: 68/0207/19-S

Betamaks 100 mg tablety: 68/0208/19-S

Betamaks 200 mg tablety: 68/0209/19-S

9. DÁTUM PRVEJ REGISTRÁCIE/PREDĹŽENIA REGISTRÁCIE

Dátum prvej registrácie: 25. júla 2019

10. DÁTUM REVÍZIE TEXTU

02/2024