

**ИНСТРУКЦИЯ**  
(информация для специалистов)  
по медицинскому применению препарата  
**СЕРДОЛЕКТ (SERDOLECT®)**

**Регистрационный номер:** №ЛС-000615

**Торговое название:** сердолект

**Международное непатентованное название:** сертиндол

**Химическое название:**

1-(2-(4-(5-хлоро-1-(4-фторфенил)-1H-индол-3-ил)-1-пипериденил)этил)-2-имидазолидинон

**Лекарственная форма:** таблетки, покрытые оболочкой

**Состав:** активное вещество - сертиндол.

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

*Оболочка* - гипромеллоза, титана диоксид (E171), макрагол 400 и

4 мг – железа оксид желтый (E172),

12 мг – железа оксид желтый (E172), железа оксид красный (E172),

16 мг – железа оксид красный (E172),

20 мг – железа оксид желтый (E172), железа оксид красный (E172), железа оксид черный (E172).

**Описание**

4 мг - овальные, двояковыпуклые таблетки, покрытые оболочкой, бледно-желтого цвета, помеченные с одной стороны символами “S4”;

12 мг - овальные, двояковыпуклые таблетки, покрытые оболочкой, бледно-желто-коричневато-розового цвета, помеченные с одной стороны символами “S12”;

16 мг - овальные, двояковыпуклые таблетки, покрытые оболочкой, коричневатого-розового цвета, помеченные с одной стороны символами “S16”;

20 мг - овальные, двояковыпуклые таблетки, покрытые оболочкой, бледно-розового цвета, помеченные с одной стороны символами “S20”.

**Фармакотерапевтическая группа:** антипсихотики. Код АТХ: N 05 AE 03.

**Фармакологические свойства**

Сердолект является атипичным нейролептиком, производным фенилиндола, селективно воздействующим на лимбические структуры. Обладает антипсихотическим действием.

**Фармакодинамика**

Нейрофармакологический профиль сертиндола, как антипсихотического средства, обусловлен селективной блокадой мезолимбических дофаминергических нейронов и сбалансированным ингибирующим действием на центральные дофаминовые D<sub>2</sub> рецепторы и серотониновые 5-HT<sub>2</sub> рецепторы, а также на α<sub>1</sub> - адренергические рецепторы.

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

Сертиндол не влияет на мускариновые и гистаминовые H<sub>1</sub> рецепторы, что подтверждается отсутствием антихолинергического и седативного эффектов, которые связаны с воздействием на эти рецепторы.

### **Фармакокинетика**

Сертиндол хорошо абсорбируется из кишечника, максимальная концентрация достигается примерно через 10 часов после приема. Прием пищи на скорость и величину абсорбции влияния не оказывает.

Кажущийся объем распределения сертиндола после многократного применения – около 20 л/кг. Сертиндол на 99,5% связывается с белками плазмы крови. Сертиндол проникает через гематоэнцефалический и плацентарный барьеры.

Метаболизируется сертиндол в печени при участии цитохромов P<sub>450</sub> 2D6 и P<sub>450</sub> 3A. Метаболиты не имеют нейрорептической активности.

Период полувыведения составляет около 3 дней.

Сертиндол и его метаболиты выделяются, в основном, с калом и, частично, с мочой.

### **Показания к применению**

Лечение шизофрении.

Сертиндол не рекомендуется назначать в экстренных ситуациях для купирования острых психотических расстройств.

### **Противопоказания**

Повышенная чувствительность к препарату или его составляющим.

Сердолект противопоказан при некорректируемых гипокалиемии или гипомagneмии.

Сердолект не должен назначаться при наличии в статусе или анамнезе больных выраженных сердечно-сосудистых заболеваний, застойной сердечной недостаточности, гипертрофии миокарда, аритмии или брадикардии (меньше 50 ударов в минуту).

Препарат не должен назначаться больным с врожденным синдромом удлиненного QT интервала или при наличии этого синдрома у родственников больного, а также в случаях приобретенного удлиненного QT интервала (свыше 450 мсек у мужчин и 470 мсек у женщин).

Не следует назначать Сердолект совместно с препаратами, удлиняющими QT интервал: антиаритмиками IA и III классов (хинидин, соталол, амиодарон, дофетилид и др), некоторыми антипсихотиками (тиоридазин), некоторыми антибиотиками-макролидами (эритромицин) и антибиотиками хинолонового ряда (гatifлоксацин), некоторыми антигистаминными средствами (терфенадин, астемизол), а также цизапридом, литием и другими лекарственными средствами, увеличивающими QT интервал.

Не следует также назначать Сердолект совместно с препаратами, ингибирующими цитохром P<sub>450</sub> 3A: «азоловыми» противогрибковыми средствами (кетоназол, итраконазол), антибиотиками-макролидами (эритромицин, кларитромицин), ингибиторами ВИЧ протеиназы (индинавир), некоторыми блокаторами кальциевых каналов (верапамил, дилтиазем), а также циметидином и другими лекарственными средствами, являющимися ингибиторами цитохрома P<sub>450</sub> 3A.

Сердолект противопоказан при выраженной печеночной недостаточности.

Беременность, период лактации, возраст до 18 лет (безопасность и эффективность препарата у этих групп пациентов не установлены).

### **Способ применения и дозы**

Сердолект назначается внутрь один раз в день, вне зависимости от приема пищи.

Начинать лечение Сердолектом всем больным следует с 4 мг в сутки. Суточная доза должна увеличиваться на 4 мг каждые 4 - 5 дней до достижения оптимальной дозы в интервале от 12 до 20 мг/сут. Максимальная доза составляет 24 мг/сут. Максимальная доза назначается в исключительных случаях вследствие риска удлинения QT интервала с увеличением дозы.

*Пожилые больные:*

Назначению Сердолекта должно предшествовать тщательное обследование сердечно-сосудистой системы. Требуется более медленное наращивание дозировки, должны использоваться более низкие дозы.

#### *Снижение функции почек:*

Сердолект может применяться в обычных дозировках у больных с почечной недостаточностью. Гемодиализ не влияет на фармакокинетику препарата.

#### *Снижение функции печени:*

Более медленное наращивание дозировки и более низкие дозы должны использоваться у пациентов с легкой или умеренной печеночной недостаточностью.

#### *Повторное назначение Сердолекта после перерыва в лечении:*

Если с момента прекращения приема Сердолекта прошло меньше недели, то постепенное повышение дозировки не обязательно (возможно назначение прежней дозировки). В остальных случаях следует наращивать дозировку до оптимальной постепенно, методом титрования, при этом перед титрованием необходимо провести ЭКГ исследование.

#### *Переход с приема другого нейролептика:*

Лечение Сердолектом может начинаться с рекомендуемого постепенного наращивания дозы одновременно с прекращением приема другого перорально применяемого нейролептика. Для пациентов, находящихся на лечении нейролептиками-депо, Сердолект назначается вместо следующей инъекции депо.

### **Побочное действие**

Наблюдаются следующие побочные эффекты (в порядке уменьшения частоты возникновения): ринит и затруднение дыхания носом, уменьшение объема эякулята, головокружение, сухость во рту, постуральная гипотензия, увеличение веса, периферические отеки, одышка, парестезии, удлинение QT интервала, лейкоцитурия и гематурия, гипергликемия, синкопальные состояния, судорожные расстройства, двигательные нарушения, включая позднюю дискинезию, пароксизмы желудочковой тахикардии (типа «torsade de pointes»).

Экстрапирамидные симптомы на фоне приема сертиндола возникают с той же частотой, что и при использовании плацебо.

Злокачественный нейролептический синдром – очень редко.

Некоторые побочные эффекты, например, постуральная гипотензия, носят транзиторный характер и возникают в начале терапии.

### **Передозировка препаратом**

#### *Симптомы.*

Сонливость, невнятная речь, тахикардия, снижение АД и транзиторное увеличение QT интервала. Возможно развитие пароксизмов желудочковой тахикардии (типа «torsade de pointes»), особенно в случаях применения сертиндола совместно с препаратами, способными вызывать этот вид побочного действия.

#### *Лечение.*

В случае передозировки следует немедленно отменить препарат, должны быть приняты меры для поддержания проходимости дыхательных путей и адекватной оксигенации.

Должен быть немедленно начат мониторинг ЭКГ и основных соматических показателей. В случаях увеличения QT интервала контроль ЭКГ проводится до нормализации этого показателя, при этом должен учитываться период полувыведения сертиндола (от 2 до 4 дней).

Следует установить внутривенный катетер, назначить промывание желудка, активированный уголь и слабительные средства.

Специфического антидота не существует и препарат не может быть выведен путем диализа. Поэтому должна быть назначена поддерживающая терапия.

Коррекцию снижения АД и проявлений сосудистого коллапса проводят с использованием внутривенного введения растворов. Если при этом используются симпатомиметики, то адреналин или дофамин следует применять с осторожностью, поскольку стимуляция  $\beta$ -адренорецепторов вместе со свойственным сертиндолу антагонистическим воздействием на  $\alpha_1$ -адренорецепторы может привести к выраженному снижению АД.

Если применяются антиаритмики, то следует учитывать, что такие препараты, как хинидин, дизопирамид, прокаинамид потенциально могут увеличивать QT интервал. В случае развития тяжелых экстрапирамидных нарушений должны быть назначены антихолинергические препараты. Пациент должен находиться под постоянным медицинским наблюдением до полного выздоровления.

### **Взаимодействие с другими лекарственными средствами**

Риск увеличения QT интервала увеличивается при сопутствующем лечении препаратами, удлиняющими QT интервал или ингибирующими метаболизм сертиндола. Использование Сердолекта одновременно с такими препаратами запрещено.

Сертиндол метаболизируется с помощью цитохромов P<sub>450</sub> 2D6 и P<sub>450</sub> 3A.

Концентрация сертиндола в плазме увеличивается при одновременном приеме с препаратами, которые ингибируют цитохром P<sub>450</sub> 2D6 (флуоксетин, пароксетин, хинидин и др.). Может потребоваться назначение более низкой поддерживающей дозы, а также проведение ЭКГ обследования до и после изменения дозы этих препаратов.

В свою очередь, сертиндол и его главные метаболиты оказывают слабое ингибирующее воздействие на активность цитохрома P<sub>450</sub> 2D6, с помощью которого метаболизируются β-адреноблокаторы, антиаритмики, некоторые гипотензивные средства, большое число антипсихотических препаратов и антидепрессантов.

Одновременное использование сертиндола и антибиотиков-макролидов (эритромицин) и блокаторов кальциевых каналов (дилтиазем, верапамил) может привести к незначительному увеличению (<25%) концентрации сертиндола в плазме. Однако степень увеличения может быть выше у пациентов со слабой активностью цитохрома P<sub>450</sub> 2D6. Так как установить в плановом порядке этих пациентов достаточно сложно, одновременное применение сертиндола и препаратов, ингибирующих цитохром P<sub>450</sub> 3A противопоказано, так как это может привести к значительному повышению уровня концентрации сертиндола в плазме.

Метаболизм сертиндола может значительно усиливаться, приводя к снижению его концентрации в плазме крови, под воздействием следующих препаратов – рифампицин, карбамазепин, фенитоин, фенобарбитал. Снижение антипсихотической активности сертиндола в подобных случаях может потребовать повышения его дозы.

### **Особые указания**

Вследствие мер предосторожности, связанных с увеличением QT интервала и мониторингом ЭКГ, сертиндол должен назначаться в случаях, где уже имеется непереносимость как минимум одного другого антипсихотика.

Опасность удлинения QT интервала больше при приеме более высоких доз (20-24 мг/сут). Удлинение QT интервала при приеме ряда препаратов может приводить к развитию пароксизмов желудочковой тахикардии и внезапной смерти.

Мониторинг артериального давления необходим в период титрования дозы и в начале периода поддерживающей терапии.

#### *Сердечно-сосудистая система*

До назначения Сердолекта необходимо провести ЭКГ исследование. При QT интервале свыше 450 мсек у мужчин и 470 мсек у женщин Сердолект назначать не следует.

ЭКГ исследование должно проводиться до назначения препарата, при достижении равновесной концентрации примерно через 3 недели после начала приема или суточной дозы 16 мг, а также через 3 месяца после начала лечения. В течение поддерживающей терапии ЭКГ исследование необходимо проводить каждые 3 месяца.

Во время поддерживающего лечения ЭКГ исследование должно проводиться до и после увеличения дозы сертиндола или после присоединения/увеличения дозы препарата, который может повысить концентрацию сертиндола в крови.

При удлинении QT интервала свыше 500 мсек сертиндол следует отменить.

При появлении у больного таких симптомов как сердцебиение, судороги, обмороки, указывающих на возможность наличия аритмии, лечащий врач должен немедленно начать обследование больного, включая ЭКГ.

Проводить ЭКГ исследование предпочтительно в утреннее время.

#### *Электролитные нарушения*

У больных с риском развития выраженных электролитных нарушений следует перед началом лечения Сердолектом измерить уровень калия и магния в сыворотке крови. Гипокалиемию и гипوماгниемию следует скорректировать до начала применения сертиндола. Рекомендуется контроль концентрации калия в плазме крови у больных с рвотой и диареей, у больных, принимающих калийвыводящие диуретики, а также при других электролитных нарушениях.

#### *Болезнь Паркинсона*

Антипсихотические средства могут ингибировать эффекты дофаминовых агонистов. Сердолект должен с осторожностью использоваться у пациентов с болезнью Паркинсона.

#### *Сниженная функция печени*

При незначительной или умеренной степени нарушения функции печени необходимо тщательное наблюдение за состоянием больного. Рекомендуется более медленное наращивание дозировки и меньшая поддерживающая доза.

#### *Судорожные припадки*

Сердолект должен назначаться с осторожностью у пациентов с судорожными припадками в анамнезе.

#### *Поздняя дискинезия*

Длительное применение антипсихотических препаратов, особенно в высоких дозах, связано с риском развития поздней дискинезии. Если на фоне приема сертиндола появляются ее симптомы, то следует уменьшить дозировку или совсем отменить препарат.

#### *Злокачественный нейролептический синдром (ЗНС)*

В случаях развития ЗНС необходима немедленная отмена препарата.

#### *Синдром отмены*

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

#### *Вспомогательные вещества*

Таблетки содержат моногидрат лактозы. Пациентам с наследственной непереносимостью галактозы, недостаточностью лактазы или нарушением абсорбции глюкозы и галактозы препарат назначаться не должен.

#### *Беременность и кормление грудью*

Поскольку безопасность Сердолекта при беременности у человека не изучалась, то этот препарат не должен назначаться беременным.

Безопасность применения Сердолекта у кормящих грудью женщин не изучалась. В случаях, где применение сертиндола признано необходимым, следует прекратить грудное вскармливание.

#### *Детский и юношеский возраст (до 18 лет)*

Безопасность и эффективность Сердолекта у детей и юношей не изучалась, поэтому препарат не должен применяться в детском и юношеском возрасте.

### *Влияние на способность управлять автомобилем или другими механизмами*

Хотя Сердолект не обладает седативным действием, пациентам не рекомендуется на фоне его приема управлять автомобилем или другими механизмами до тех пор, пока не будет установлена индивидуальная переносимость препарата.

### **Форма выпуска**

Таблетки, покрытые оболочкой 4 мг, 12 мг, 16 мг, 20 мг.

#### **Упаковка:**

4 мг – 20 шт., 30 шт.

По 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку (блистер) из ПВХ и Al-фольги. 3 блистера с инструкцией по применению в картонную пачку.

При упаковке на ЗАО «ЗиО-Здоровье»: по 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку (блистер) из ПВХ и Al-фольги. 2 блистера с инструкцией по применению в картонную пачку.

12 мг – 14 шт., 28 шт., 56 шт.

16 мг – 14 шт., 28 шт., 56 шт.

20 мг – 14 шт., 28 шт., 56 шт.

По 14 таблеток в контурную ячейковую упаковку (блистер) из ПВХ и Al-фольги. 2 блистера с инструкцией по применению в картонную пачку.

При упаковке на ЗАО «ЗиО-Здоровье»: по 14 таблеток в контурную ячейковую упаковку (блистер) из ПВХ и Al-фольги. 1 или 4 блистера с инструкцией по применению в картонную пачку.

### **Условия хранения**

Список Б.

В защищенном от света месте при температуре не выше 25°C.

Хранить в недоступных для детей местах.

### **Срок хранения – 5 лет.**

Не использовать после окончания срока годности, указанного на упаковке.

### **Условия отпуска из аптек**

По рецепту врача.

### **Название и адрес производителя**

Х. Лундбек АО

Оттилиавай 9,

ДК-2500 Вальбю,

Копенгаген, Дания

### **Представительство компании**

Хорошевское шоссе, 32А,

Москва, 123007

Тел. (495) 380-31-97