

SOUHRN ÚDAJŮ O PŘÍPRAVKU

1. NÁZEV PŘÍPRAVKU

GUTTALAX

5 mg, tablety

2. KVALITATIVNÍ A KVANTITATIVNÍ SLOŽENÍ

Jedna tableta obsahuje natrii picosulfas 5 mg (jako natrii picosulfas monohydricus).

Pomocná látka se známým účinkem:

Jedna tableta obsahuje 70,813 mg monohydrátu laktózy.

Úplný seznam pomocných látek viz bod 6.1.

3. LÉKOVÁ FORMA

Tableta

Bílé, kulaté, ploché tablety se zkosenými hranami s půlicí rýhou a značením 5L po obou stranách půlicí rýhy na jedné straně tablety.

Tabletu lze rozdělit na stejné dávky.

4. KLINICKÉ ÚDAJE

4.1 Terapeutické indikace

GUTTALAX je indikován u dospělých, dospívajících a dětí od 4 let v případech akutní funkční zácpy a k občasnému použití pro usnadnění vyprázdnění při chronické zácpě.

4.2 Dávkování a způsob podání

Perorální podání

Následující dávky se doporučuje podat večer před spaním, k vyprázdnění dochází zpravidla následující den ráno. Doporučuje se začít s nejnižší dávkou. Dávka může být upravena až do maximální doporučené dávky pro navození pravidelné stolice. Maximální doporučená denní dávka nemá být překročena.

Dospělí: 1 - 2 tablety (5 - 10 mg) denně

Pediatrická populace

Děti nad 10 let a dospívající: 1 - 2 tablety (5 - 10 mg) denně

Děti ve věku 4 - 10 let: ½ - 1 tableta (2,5 - 5 mg) denně

GUTTALAX lze pravidelně, při každodenním podávání, užívat (nebo podávat dětem) po dobu maximálně dvou týdnů, a to jak po konzultaci, tak i bez konzultace s lékařem.

Způsob podání

Tablety se zapíjejí dostatečným množstvím tekutiny.

4.3 Kontraindikace

GUTTALAX je kontraindikován u pacientů:

- s hypersenzitivitou na pikosulfát sodný nebo kteroukoli pomocnou látku uvedenou v bodě 6.1.
- se střevní neprůchodností nebo střevní obstrukcí,
- se silnou bolestí břicha a/nebo horečnatými akutními břišními příhodami (např. při appendicitis) spojenými s nauzeou a zvracením
- v akutní fázi zánětlivých střevních onemocnění (např. ulcerózní kolitida)
- se závažnou dehydratací

4.4 Zvláštní upozornění a opatření pro použití

Podobně jako u jiných laxativ není doporučeno podávat GUTTALAX každodenně nebo po delší dobu bez zjištění příčiny zácpy.

Dlouhodobé podávání vyšších dávek může vyvolat poruchy rovnováhy tekutin a elektrolytů a hypokalemii.

U pacientů, kteří užívali přípravek GUTTALAX, byly popsány závratě a/nebo mdloby. Podrobnosti, které jsou dostupné k těmto případům, naznačují, že tyto účinky mohou souviset s mdlobou při defekaci (nebo s mdlobou související s namáháním při stolici) nebo s vazovagální reakcí na bolest břicha při zácpě. Nemusí nutně souviset s podáním samotného pikosulfátu sodného.

Děti by neměly užívat GUTTALAX bez doporučení lékaře.

Jedna tableta přípravku GUTTALAX obsahuje 67,5 mg laktózy, což znamená 135,0 mg laktózy v maximální doporučené denní dávce k léčbě dospělých, dospívajících a dětí od 10 let. Pacienti se vzácnými dědičnými problémy s intolerancí galaktózy, vrozeným nedostatkem laktázy nebo malabsorpcí glukózy a galaktózy by tento přípravek neměli užívat.

4.5 Interakce s jinými léčivými přípravky a jiné formy interakce

Při podávání zvýšených dávek přípravku GUTTALAX v kombinaci s diuretiky nebo kortikosteroidy se může zvyšovat riziko vzniku elektrolytové nerovnováhy.

Porušená elektrolytová rovnováha může způsobit zvýšení citlivosti k působení srdečních glykosidů.

Současné podávání antibiotik může snížit laxativní účinek přípravku GUTTALAX.

4.6 Fertilita, těhotenství a kojení

Těhotenství

Odpovídající studie u těhotných žen nejsou k dispozici. Dlouhodobé zkušenosti nepřinesly důkazy o nežádoucích nebo škodlivých účincích přípravku při užívání během těhotenství.

Užívání přípravku GUTTALAX v průběhu těhotenství se doporučuje pouze pokud je to nezbytně nutné.

Kojení

Klinické údaje prokázaly, že ani léčivá složka pikosulfátu sodného BHPM (bis-(p-hydroxyfenyl)-pyridyl-2-methan) ani jeho glukuronidy nejsou vylučovány do mateřského mléka zdravých kojících žen. Z toho důvodu je možné přípravek GUTTALAX užívat během kojení.

Fertilita

Nebyly provedeny žádné studie fertility u člověka. Neklinické studie neprokázaly žádný vliv na fertilitu (viz bod 5.3).

4.7 Účinky na schopnost řídit a obsluhovat stroje

Studie hodnotící účinky na schopnost řídit nebo obsluhovat stroje nebyly provedeny.

Pacienti musí být poučeni, že v důsledku vazovagální odpovědi (např. v důsledku abdominálního spazmu) mohou pocítit závrať a/nebo mdlobu. Pokud se u pacienta projeví abdominální spasmus, musí se vyvarovat potenciálně nebezpečných činností, jako je řízení nebo obsluha strojů.

4.8 Nežádoucí účinky

Frekvence výskytu je vyjádřena za použití následujícího pravidla: velmi časté ($\geq 1/10$); časté ($\geq 1/100$ až $< 1/10$); méně časté ($\geq 1/1000$ až $< 1/100$); vzácné ($\geq 1/10\ 000$ až $< 1/1000$); velmi vzácné ($< 1/10\ 000$); není známo (z dostupných údajů nelze určit).

Poruchy imunitního systému

Není známo*: hypersenzitivita

Poruchy nervového systému

Méně časté: závrať

Není známo*: mdloby

Závrať a mdloby, které se objeví po požití pikosulfátu sodného, jsou spojeny s vazovagální odpovědí (např. abdominální spasmus, defekace).

Gastrointestinální poruchy

Velmi časté: průjem

Časté: abdominální křeče, abdominální bolest, abdominální obtíže

Méně časté: zvracení, nauzea

Poruchy kůže a podkožní tkáň

Není známo*: kožní reakce jako je angioedém, polékový výsev, vyrážka, svědění.

**= tyto nežádoucí účinky byly pozorovány při post-marketingovém sledování. S 95% jistotou není uvedena frekvence vyšší než méně častá, ale může být nižší. Přesný odhad frekvence není možný, protože se nežádoucí účinek nevyskytoval v databázi klinické studie s 1020 pacienty.*

Hlášení podezření na nežádoucí účinky

Hlášení podezření na nežádoucí účinky po registraci léčivého přípravku je důležité. Umožňuje to pokračovat ve sledování poměru přínosů a rizik léčivého přípravku. Žádáme zdravotnické pracovníky, aby hlásili podezření na nežádoucí účinky na adresu:

Státní ústav pro kontrolu léčiv

Šrobárova 48

100 41 Praha 10

Webové stránky: www.sukl.cz/nahlasit-nezadouci-ucinek

4.9 Předávkování

Příznaky

Při vysokých dávkách se může objevit vodnatá stolice (průjem), abdominální křeče a klinicky závažné ztráty tekutin, draslíku a dalších elektrolytů.

Pokud se pro běžné zvládnutí zácpy podávají dávky vyšší než doporučené, může dojít k ischemii střevní sliznice.

GUTTALAX, podobně jako jiná laxativa, může při chronickém předávkování způsobit chronický průjem, bolesti břicha, hypokalemii, sekundární hyperaldosteronismus a ledvinové kameny.

V souvislosti s chronickým předávkováním laxativy bylo dále popsáno poškození ledvinných kanálků, metabolická alkalóza a svalová slabost sekundárně způsobená hypokalemií.

Terapie

V průběhu krátké doby po užití lze zabránit působení přípravku (nebo je minimalizovat) vyvoláním zvracení nebo výplachem žaludku. Podle stupně postižení je zpravidla třeba náhrada tekutin a úprava porušené elektrolytové rovnováhy, zejména u dětí a starších osob. V některých případech je vhodné podání spasmolytik.

5. FARMAKOLOGICKÉ VLASTNOSTI

5.1 Farmakodynamické vlastnosti

Farmakoterapeutická skupina: kontaktní laxativa, ATC kód: A06AB08

Pikosulfát sodný, léčivá látka přípravku GUTTALAX, je lokálně působícím projímadlem difenylmethanové skupiny. Po bakteriálním štěpení pikosulfátu v tlustém střevě dochází ke stimulaci sliznice tlustého střeva, která způsobí zvýšení peristaltiky tlustého střeva a napomáhá zadržování vody a elektrolytů v lumen tlustého střeva. To vede ke stimulaci defekace, snížení času střevní pasáže a změknutí stolice.

Jelikož pikosulfát sodný působí v tlustém střevě, nedochází ke změně (porušení) vstřebávání energetických složek stravy a esenciálních živin v tenkém střevě.

5.2 Farmakokinetické vlastnosti

Absorpce a distribuce

Po perorálním podání prochází pikosulfát sodný do tlustého střeva bez významné předchozí absorpce. Nedochází k enterohepatální cirkulaci.

Biotransformace

Pikosulfát sodný je změněn na laxativní složku, bis-(p-hydroxyfenyl)-pyridyl-2-methan (BHPM) prostřednictvím bakteriálního štěpení v distální části střeva.

Eliminace

Během následující přeměny je jen malé množství BHPM absorbováno a téměř zcela konjugováno ve střevní stěně a v játrech za vzniku neaktivního glukuronidu BHPM. Po perorálním podání 10 mg pikosulfátu sodného bylo 10,4 % celkové dávky jako glukuronid BHPM po 48 hodinách vyloučeno močí. Obecně platí, že se při podávání vyšších dávek pikosulfátu sodného vylučování močí snížilo.

Farmakokinetické/farmakodynamické vztahy

Účinek nastupuje za 6 - 12 hodin v závislosti na uvolňování léčivé látky (BHPM) z přípravku.

Nebyl nalezen přímý nebo opačný vztah mezi plazmatickou hladinou aktivní složky a projímavým účinkem.

5.3 Předklinické údaje vztahující se k bezpečnosti

U pikosulfátu sodného byla prokázána nízká akutní toxicita u laboratorních zvířat. Hodnoty LD₅₀ po perorálním podání byly >17 g/kg (u myší), >16 g/kg (u potkanů) a >6 g/kg (u králíků, psů). Hlavními příznaky toxicity byla polydipsie, piloerekce, průjem a zvracení.

Ve studiích subchronické a chronické toxicity na potkanech (až do 100 mg/kg) a psech (až do 1000 mg/kg) v délce až 6 měsíců vyvolával pikosulfát sodný v dávkách 500x a 5000x převyšující terapeutické dávky doporučené lidem (vztaženo na 50 kg tělesné hmotnosti) průjem a způsoboval úbytek tělesné hmotnosti. Následně tyto vysoké dávky vyvolávaly atrofii gastrointestinální sliznice. Změny vzniklé v souvislosti s léčbou byly způsobeny chronickým drážděním střev spolu s kachexií. Všechny toxické nežádoucí účinky byly reverzibilní. Pikosulfát sodný neovlivňoval srdeční frekvenci, krevní tlak a dýchání zvířat ani při plném vědomí, ani při anestezii.

Pikosulfát sodný nevykazoval genotoxický potenciál u bakterií a savčích buněk za podmínek *in vitro* a *in vivo*. Dlouhodobé běžné studie kancerogenity u potkanů a myší nejsou k dispozici.

Byl zkoumán teratogenní účinek pikosulfátu sodného (fáze II) u potkanů (v dávkách 1, 10, 1000 a 10 000 mg/kg tělesné hmotnosti) a králíků (1, 10 a 1000 mg/kg) po perorálním podání.

Toxické dávky podávané v těhotenství vyvolávají silný průjem spolu s embryotoxicitou (zvýšení prvotního vstřebávání) bez teratogenních účinků nebo nežádoucích účinků na reprodukci potomstva. Plodnost a vývoj embrya (fáze I), stejně jako pre- a postnatální vývoj (fáze III) u potkanů nebyly ovlivněny po perorálním podání dávek 1, 10 a 100 mg/kg.

Celkově vzhledem k nízké celkové biologické dostupnosti po perorálním podání je akutní a chronická toxicita pikosulfátu sodného nízká.

6. FARMACEUTICKÉ ÚDAJE

6.1 Seznam pomocných látek

Monohydrát laktózy, sušený kukuřičný škrob, koloidní bezvodý oxid křemičitý, oxidovaný kukuřičný škrob, magnesium-stearát, předbobtnalý bramborový škrob.

6.2 Inkompatibility

Neuplatňuje se.

6.3 Doba použitelnosti

3 roky

6.4 Zvláštní opatření pro uchování

Žádné zvláštní podmínky uchování.

6.5 Druh obalu a obsah balení

Bílá PP tuba s bílou PE zátkou, krabička.

5, 10, 20 a 30 tablet

Na trhu nemusí být všechny velikosti balení.

6.6 Zvláštní opatření pro likvidaci přípravku

Žádné zvláštní požadavky.

7. DRŽITEL ROZHODNUTÍ O REGISTRACI

sanofi-aventis, s.r.o.
Evropská 846/176a
160 00 Praha 6
Česká republika

8. REGISTRAČNÍ ČÍSLO

61/510/05-C

9. DATUM PRVNÍ REGISTRACE/ PRODLOUŽENÍ REGISTRACE

Datum první registrace : 14. 12. 2005
Datum posledního prodloužení registrace: 20. 1. 2016

10. DATUM REVIZE TEXTU

3. 4. 2019