

SÚHRN CHARAKTERISTICKÝCH VLASTNOSTÍ LIEKU

1. NÁZOV LIEKU

LAXYGAL

7,5 mg/ml perorálne roztokové kvapky

2. KVALITATÍVNE A KVANTITATÍVNE ZLOŽENIE

Jeden ml roztoku (1 ml = 18 kvapiek) obsahuje 7,5 mg pikosíranu disodného.

Pomocné látky so známym účinkom: Jeden ml roztoku obsahuje 680 mg sorbitolu (E 420) a 0,66 mg sodnej soli etylparabénu (E 215).

Úplný zoznam pomocných látok, pozri časť 6.1.

3. LIEKOVÁ FORMA

Perorálne roztokové kvapky.

Číra, slabo žltohnedá kvapalina.

4. KLINICKÉ ÚDAJE

4.1 Terapeutické indikácie

LAXYGAL sa používa na liečbu zápchy a iných stavov vyžadujúcich uľahčené vyprázdnenie obsahu čriev.

4.2 Dávkovanie a spôsoby podávania

Dávkovanie

Dospelí: 12 až 24 kvapiek (5 – 10 mg) denne.

Pediatrická populácia

Deti staršie ako 10 rokov: 12 až 24 kvapiek (5 – 10 mg) denne.

Deti vo veku 4 až 10 rokov: 6 až 12 kvapiek (2,5 – 5 mg) denne.

Pre deti mladšie ako 4 roky je odporúčaná dávka 0,25 mg na kilogram telesnej hmotnosti na deň. (1 kvapka obsahuje 0,42 mg pikosíranu disodného).

Spôsob podávania

Na perorálne použitie. LAXYGAL možno užiť s tekutinou alebo bez nej. Liek sa odporúča užiť večer, aby vyprázdnenie nastalo nasledujúci deň ráno. Odporúča sa začať s najnižšou dávkou. Dávka sa môže upraviť až na maximálnu odporúčanú dávku, aby stolica bola pravidelná. Maximálna odporúčaná denná dávka sa nesmie prekročiť.

4.3 Kontraindikácie

LAXYGAL je kontraindikovaný u pacientov:

- so známou precitlivosťou na pikosíran disodný alebo na ktorúkoľvek z pomocných látok uvedených v časti 6.1,
- s ileom alebo s črevnou obštrukciou,
- so závažnými bolestivými a/alebo horúčkovými akútnymi brušnými príhodami (napr. apendicitída) prípadne spojenými s nauzeou a vracaním,
- s akútnym zápalovým ochorením čriev,
- so závažnou dehydratáciou,
- so zriedkavými dedičnými ochoreniami, ktoré nemusia byť kompatibilné s pomocnými látkami lieku (pozri časť 4.4).

4.4 Osobitné upozornenia a opatrenia pri používaní

Podobne ako pri iných laxatívach, neodporúča sa užívať LAXYGAL bez prestávky každodenne alebo dlhodobo bez zistenia príčiny zápchy. Dlhodobé užívanie v nadmernom množstve môže spôsobiť porušenie rovnováhy elektrolytov a hypokaliémiu.

U pacientov, ktorí užívajú LAXYGAL, sa zaznamenali závraty a/alebo synkopa. Dostupné údaje o týchto prípadoch naznačujú, že tieto príhody zodpovedajú defekáčnej synkope (alebo synkope súvisiacej s tlakom pri vyprázdňovaní) alebo vazovagálnemu reflexu pri bolesti brucha spojennej so zápchou a nie nevyhnutne s podaním samotného pikosíranu disodného.

Deti nesmú užívať LAXYGAL bez lekárskeho odporúčania.

Tento liek obsahuje sorbitol, etylparabén a sodík

LAXYGAL obsahuje 680 mg sorbitolu v 1 ml roztoku. Pacienti s hereditárnou intoleranciou fruktózy (HFI) nesmú užiť/nesmie im byť podaný tento liek. Musí sa vziať do úvahy aditívny účinok súbežne podávaných liekov obsahujúcich sorbitol (alebo fruktózu) a príjem sorbitolu (alebo fruktózy) v strave. Obsah sorbitolu v liekoch na perorálne použitie môže ovplyvniť biologickú dostupnosť iných liekov na perorálne použitie podávaných súbežne.

LAXYGAL obsahuje sodnú soľ etylparabénu. Môže vyvolať alergické reakcie (možno oneskorené).

Tento liek obsahuje menej ako 1 mmol sodíka (23 mg) v 1 ml roztoku, t.j. v podstate zanedbateľné množstvo sodíka.

4.5 Liekové a iné interakcie

Podávanie zvýšených dávok LAXYGALu súbežne s diuretikami alebo kortikosteroidmi môže spôsobiť poruchu rovnováhy elektrolytov.

Nerovnováha elektrolytov môže mať za následok zvýšenú citlivosť na pôsobenie srdcových glykozidov.

Súbežné užívanie antibiotík môže znížiť laxatívny účinok lieku LAXYGAL.

4.6 Fertilita, gravidita a laktácia

Gravidita

Nie sú k dispozícii žiadne primerané a dobre kontrolované štúdie u gravidných žien. Dlhodobé skúsenosti nepotvrdili výskyt nežiaducich alebo škodlivých účinkov počas gravidity. Napriek tomu, tak ako pri iných liekoch sa LAXYGAL môže užívať počas gravidity iba po konzultácii s lekárom.

Dojčenie

Klinické údaje preukázali, že ani aktívny podiel pikosíranu disodného ani jeho glukuronidy sa nevyučujú do materského mlieka zdravých matiek počas dojčenia. Preto sa LAXYGAL môže bezpečne užívať počas dojčenia.

Fertilita

Nevykonal sa žiadne štúdie ohľadom účinku na fertilitu u ľudí. Predklinické štúdie nepreukázali žiadny účinok na fertilitu (pozri časť 5.3).

4.7 Ovplynenie schopnosti viesť vozidlá a obsluhovať stroje

Nevykonal sa žiadne štúdie o účinkoch na schopnosť viesť vozidlá a obsluhovať stroje.

Avšak pacienti majú byť poučení, že v dôsledku vazovagálnej reakcie (napr. kŕče v oblasti brucha) sa u nich môže prejaviť závrat alebo synkopa. Ak sa u pacientov vyskytnú kŕče v oblasti brucha, majú sa vyhnúť potenciálne rizikovým prácam, ako je vedenie vozidiel alebo obsluha strojov.

4.8 Nežiaduce účinky

Frekvencie výskytu podľa konvencií MedDRA:

veľmi časté	$\geq 1/10$
časté	$\geq 1/100$ až $< 1/10$
menej časté	$\geq 1/1000$ až $< 1/100$
zriedkavé	$\geq 1/10\,000$ až $< 1/1000$
veľmi zriedkavé	$< 1/10\,000$
neznáme (z dostupných údajov)	

Poruchy imunitného systému

Neznáme*: hypersenzitivita

Poruchy nervového systému

Menej časté: závrat

Neznáme*: synkopa

Zdá sa, že závrat a synkopa, ktoré sa vyskytujú po užití pikosíranu disodného, súvisia s vazovagálnou reakciou (napr. kŕče v oblasti brucha, vyprázdnenie čriev).

Poruchy gastrointestinálneho traktu

Veľmi časté: hnačka

Časté: kŕče v bruchu, bolesť brucha, pocit brušnej nepohody

Menej časté: vracanie, nevoľnosť

Poruchy kože a podkožného tkaniva

Neznáme*: kožné reakcie, ako angioedém, poliekový exantém, vyrážka, svrbenie

*Tieto nežiaduce účinky boli zaznamenané na základe skúseností po uvedení lieku na trh. S 95 % istotou nie je kategória frekvencie výskytu vyššia než menej častá, ale môže byť aj nižšia. Presné stanovenie frekvencie výskytu nie je možné, nakoľko sa nežiaduci účinok v databáze 1 020 pacientov v rámci klinickej štúdie nevyskytol.

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 Predávkovanie

Symptómy

Vysoké dávky môžu spôsobiť vodnatú stolicu (hnačka), kŕče v bruchu a klinicky závažné straty tekutín, draslíkových iónov a ďalších elektrolytov.

Okrem toho boli v súvislosti s podávaním LAXYGALU v dávkach značne vyšších, ako je odporúčané pri liečbe zápchy, hlásené prípady ischémie sliznice hrubého čreva.

LAXYGAL môže podobne ako iné laxatíva pri chronickom predávkovaní spôsobiť prípady chronickej hnačky, bolesti brucha, hypokaliémie, sekundárneho hyperaldosteronizmu a obličkových kameňov. V súvislosti s chronickým podávaním vysokých dávok laxatív boli popísané prípady renálneho tubulárneho poškodenia, metabolickej alkalózy a svalovej slabosti ako následok hypokaliémie.

Liečba

Po užití LAXYGALU môže byť absorpcia minimalizovaná alebo zamedzená vyvolaním vracania alebo výplachom žalúdka. Môže byť potrebné doplnenie tekutín a korekcia nerovnováhy elektrolytov. Toto je špeciálne dôležité pre starších ľudí a mladistvých. Odporúča sa podávanie spazmolytík.

5. FARMAKOLOGICKÉ VLASTNOSTI

5.1 Farmakodynamické vlastnosti

Farmakoterapeutická skupina: liečivá na zápchu, kontaktné laxanciá, ATC kód: A06AB08.

Mechanizmus účinku

Pikosíran disodný, liečivo LAXYGALu, je lokálne pôsobiace prehľadadlo, ktoré po bakteriálnom štiepení v hrubom čreve pôsobí na sliznicu hrubého čreva, a tak zvyšuje črevnú peristaltiku a podporuje nahromadenie vody a následkom toho elektrolytov v črevnom trakte.

To má za následok stimuláciu defekácie, zníženie prechodného času a zmäkčenie stolice.

Ako laxatívum, ktoré pôsobí v hrubom čreve, pikosíran disodný špecificky stimuluje prirodzený vyprázdňovací proces v dolnej časti gastrointestinálneho traktu. Preto je pikosíran disodný neúčinný v ovplyvňovaní trávenia alebo absorpcie kalórií alebo esenciálnych živín v tenkom čreve.

5.2 Farmakokinetické vlastnosti

Absorpcia a distribúcia

Po perorálnom užití sa pikosíran disodný dostane do hrubého čreva bez predchádzajúcej absorpcie. Nepodlieha tak enterohepatálnej cirkulácii.

Biotransformácia

Pikosíran disodný sa konvertuje na aktívnu laxatívnu zlúčeninu bis-(p-hydroxyfenyl)-pyridyl-2-metán (BHPM) prostredníctvom bakteriálneho štiepenia v čreve.

Eliminácia

Následne po konverzii sa len malé množstvo BHPM absorbuje a takmer úplne sa konjuguje v črevnej stene a v pečeni na inaktívnu formu BHPM glukuronidu. Po perorálnom podaní 10 mg pikosíranu disodného sa 10,4 % celkovej dávky úplne vylúči močom ako BHPM glukuronid do 48 hodín.

Vo všeobecnosti sa exkrécia močom znižuje, ak sa podávajú vyššie dávky pikosíranu disodného.

Farmakokinetický/farmakodynamický vzťah

Čas od podania do nástupu účinku je 6 až 12 hodín, čo je podmienené uvoľnením liečiva (BHPM). Nie je priamy ani inverzný vzťah medzi laxatívnym účinkom a plazmatickou hladinou liečiva.

5.3 Predklinické údaje o bezpečnosti

Pikosíran disodný preukázal nízku akútnu toxicitu na laboratórnych zvieratách. Perorálne hodnoty LD₅₀ boli > 17 g/kg (myš), > 16 g/kg (potkan) a > 6 g/kg (králik, pes), v uvedenom poradí. Hlavné znaky toxicity u myši a potkanov boli polydipsia, piloerekcia, hnačka, vracanie v uvedenom poradí.

V štúdiách zameraných na subchronickú a chronickú toxicitu, trvajúcich 6 mesiacov na potkanoch (do 100 mg/kg) a psoch (do 1000 mg/kg) s pikosíranom disodným, sa vyskytli hnačka a strata telesnej hmotnosti, pri podávaní dávok vyšších ako je 500 a 5000-násobok terapeutickú dávku u ľudí (na 50 kg základe). Ako následok vystavenia vysokým dávkam sa vyskytla atrofia gastrointestinálnej sliznice. Zmeny spojené s liečbou boli spôsobené chronickou iritáciou prepojenou s kachexiou. Všetky toxické vedľajšie účinky boli reverzibilné. Pikosíran disodný nemal žiadny nežiaduci účinok na srdcovú frekvenciu potkanov, krvný tlak a dýchanie pri vedomí aj v priebehu anestézie.

Pikosíran disodný nevykazoval žiadny genotoxický potenciál v baktériách a materských bunkách v podmienkach *in vitro* a *in vivo*. Nie sú dostupné chronické biologické štúdie na karcinogenitu u potkanov a myši.

Vykonal sa štúdie zamerané na účinok pikosírany disodného na teratogenitu (Segment II) u potkanov (1; 10; 1 000 a 10 000 mg/kg) a králikov (1;10 a 1 000 mg/kg) po podaní perorálnej dávky. Dávky toxické počas tehotenstva zapríčiňujúce závažnú hnačku súviseli s embryotoxicitou (zvýšenie skorej resorpcie) bez akýchkoľvek teratogénnych účinkov alebo nežiaducich účinkov na reprodukčné schopnosti potomkov. Plodnosť a celkový embryonálny vývoj (Segment I) a peri- a postnatálny vývoj (Segment III) u potkanov nebol poškodený perorálnymi dávkami 1;10 a 100 mg/kg.

Stručne povedané, vzhľadom na nízku biodostupnosť po perorálnom podaní, je akútna a chronická toxicita pikosírany disodného nízka.

6. FARMACEUTICKÉ INFORMÁCIE

6.1 Zoznam pomocných látok

sodná soľ etylparabénu (E 215)
sorbitol 70 % nekryštalizujúci (E 420)
kyselina chlorovodíková (E 507)
čistená voda

6.2 Inkompatibility

Fyzikálne ani chemické inkompatibility nie sú doteraz známe.

6.3 Čas použiteľnosti

2 roky

6.4 Špeciálne upozornenia na uchovávanie

Uchovávať pri teplote do 25 °C v pôvodnom obale na ochranu pred svetlom.
Neuchovávať v chladničke alebo mrazničke.

6.5 Druh obalu a obsah balenia

Hnedá fľaška s originálnym uzáverom z plastickej hmoty a kvapkacou vložkou, písomná informácia pre používateľa, papierová škatuľka.

Veľkosť balenia: 10 ml, 25 ml alebo 30 ml
Na trh nemusia byť uvedené všetky veľkosti balenia.

6.6 Špeciálne opatrenia na likvidáciu a iné zaobchádzanie s liekom

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

7. DRŽITEĽ ROZHODNUTIA O REGISTRÁCII

Teva B.V.
Swensweg 5
2031 GA Haarlem
Holandsko

8. REGISTRAČNÉ ČÍSLO

61/0018/97-S

9. DÁTUM PRVEJ REGISTRÁCIE/PREDĹŽENIA REGISTRÁCIE

Dátum prvej registrácie: 21. januára 1997
Dátum posledného predĺženia registrácie: 17. decembra 2003

10. DÁTUM REVÍZIE TEXTU

12/2024