

CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

ULGASTRAN, 1 g/5 ml, zawiesina doustna

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

5 ml zawiesiny doustnej zawiera 1 g sukralfatu (*Sucralfatum*).

Substancje pomocnicze o znanym działaniu:

5 ml zawiesiny doustnej zawiera 5,7 mg metylu parahydroksybenzoesanu, 2,8 mg propylu parahydroksybenzoesanu, 85,9 mg sorbitolu oraz 572,5 mg glicerolu.

Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Zawiesina doustna.

Biała zawiesina o zapachu cytrynowo-waniliowym. Zawiesina może lekko sedymentować, ale po wstrząśnięciu butelki powraca do stanu jednorodnego rozproszenia.

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1 Wskazania do stosowania

Choroba wrzodowa żołądka i dwunastnicy.

4.2 Dawkowanie i sposób podawania

Dawkowanie

Produkt leczniczy przeznaczony do stosowania doustnego.

Dorośli: 1 g (1 łyżeczka) 4 razy na dobę (co 6 godzin), na 0,5 - 1 godz. przed każdym posiłkiem i bezpośrednio przed snem. Produkt leczniczy należy popijać dużą ilością wody. Leczenie kontynuować przez 4 do 6 tygodni. Maksymalna dawka dobową produktu leczniczego wynosi 8 g (8 łyżeczek).

Wstrząsnąć przed użyciem.

Dawkowanie u pacjentów z niewydolnością nerek

U pacjentów z niewydolnością nerek produkt leczniczy Ulgastran należy stosować ostrożnie (patrz punkt 4.3 i 4.4).

Dawkowanie u pacjentów w podeszłym wieku

Dostosowanie dawkowania nie jest konieczne.

Dawkowanie u dzieci i młodzieży w wieku poniżej 18 lat

Nie ma doświadczenia dotyczącego stosowania u dzieci.

Dzieci i młodzież

Nie określono dotychczas bezpieczeństwa stosowania ani skuteczności produktu leczniczego Ulgastran u dzieci w wieku do 14 lat.

Aktualne dane przedstawiono w punkcie 5.1.

4.3 Przeciwwskazania

- Nadwrażliwość na substancję czynną lub na którąkolwiek substancję pomocniczą wymienioną w punkcie 6.1.
- Nie należy stosować długotrwale u pacjentów z ciężką niewydolnością nerek, mocznicą lub hipofosfatemią oraz u pacjentów poddawanych dializoterapii.

4.4 Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

Należy zachować szczególną ostrożność podczas stosowania sukralfatu u pacjentów z niewydolnością nerek. U pacjentów z niewydolnością nerek dochodzi do zmniejszenia wydalania glinu przez nerki. Glin słabo przenika przez błony dializacyjne ze względu na wiązanie z albuminami osocza. U pacjentów poddawanych dializoterapii produkt leczniczy stosować tylko w przypadku bezwzględnej konieczności i przez krótki okres czasu. Należy wówczas kontrolować stężenie glinu i fosforanów w surowicy oraz ocenić po zakończeniu terapii, czy nie występują objawy kumulacji glinu (osteodystrofia, osteomalacja, encefalopatia). Leki zobojętniające kwas solny należy stosować 30 minut przed podaniem lub po podaniu sukralfatu. Nie zaleca się jednoczesnego stosowania innych produktów leczniczych zawierających glin ze względu na możliwość zwiększonego wchłaniania glinu i możliwość działania toksycznego.

Notowano powstawanie bezoarów po podaniu sukralfatu głównie u ciężko chorych pacjentów w oddziałach intensywnej terapii. U większości pacjentów (w tym u noworodków, u których sukralfat nie jest zalecany) występowały choroby, które mogą predysponować do powstania bezoarów (np. opóźnione opróżnianie żołądka z powodu przyjmowania innych leków, zabiegów chirurgicznych lub chorób, które zmniejszają ruchliwość), albo byli odżywiani za pomocą zgłębnika dojelitowego.

Ważne informacje o niektórych substancjach pomocniczych produktu leczniczego Ulgastran

Produkt leczniczy Ulgastran zawiera 85,9 mg sorbitolu w 5 ml. Należy wziąć pod uwagę addytywne działanie podawanych jednocześnie produktów zawierających fruktozę (lub sorbitol) oraz pokarmu zawierającego fruktozę (lub sorbitol). Sorbitol zawarty w produkcie leczniczym może wpływać na biodostępność innych, podawanych równocześnie drogą doustną, produktów leczniczych. Pacjenci z dziedziczną nietolerancją fruktozy nie mogą przyjmować tego produktu leczniczego.

Produkt leczniczy Ulgastran zawiera metylu parahydroksybenzoesan. Lek może powodować reakcje alergiczne (możliwe reakcje typu późnego).

Produkt leczniczy Ulgastran zawiera propylu parahydroksybenzoesan. Lek może powodować reakcje alergiczne (możliwe reakcje typu późnego).

Produkt leczniczy Ulgastran zawiera sód. Lek zawiera mniej niż 1 mmol (23 mg) sodu na 40 ml, to znaczy lek uznaje się za „wolny od sodu”.

Dzieci i młodzież

Nie zaleca się stosowania produktu leczniczego Ulgastran u dzieci i młodzieży w wieku poniżej 14 lat z powodu braku danych dotyczących bezpieczeństwa i skuteczności.

4.5 Interakcje z innymi produktami leczniczymi i inne rodzaje interakcji

Na etapie wchłaniania może dochodzić do interakcji sukralfatu z pokarmem. Ze względu na możliwość wiązania się sukralfatu z białkami pokarmowymi oraz zwiększania biodostępności indukowanej pokarmem zaleca się podawanie sukralfatu na 1 godzinę przed posiłkiem lub 2 godziny po posiłku.

Na podstawie licznych badań stwierdzono, że sukralfat podawany równocześnie z innymi produktami leczniczymi stosowanymi doustnie może opóźniać lub zmniejszać ich wchłanianie (interakcja farmakokinetyczna, etap biodostępności) poprzez tworzenie fizycznej bariery w przewodzie pokarmowym

lub poprzez chelatowanie produktów leczniczych. Dotyczy to w szczególności następujących grup produktów leczniczych:

- chemioterapeutyki z grupy chinolonów;
- tetracykliny;
- leki przeciwgrzybicze;
- blokery receptorów histaminowych H₂;
- leki przeciwzakrzepowe pochodne kumaryny;
- niesteroidowe leki przeciwzapalne;
- fosforany;
- glikozydy nasercowe;
- fenytoina;
- teofilina.

Leki zobojętniające (z grupy *antacida*) zwiększając pH soku żołądkowego zmniejszają skuteczność sukralfatu.

Sukralfat w środowisku kwaśnym soku żołądkowego uwalnia jony glinu, dlatego należy zwracać uwagę na możliwość zachodzenia interakcji jonów glinu także z innymi grupami produktów leczniczych:

- leki przeciwwirusowe, np. inhibitory proteazy;
- inhibitory ACE;
- beta-adrenolityki;
- leki przeciwcukrzycowe;
- leki immunosupresyjne;
- leki przeciwpsychotyczne;
- pochodne benzodiazepiny;
- kortykosteroidy doustne;
- sole żelaza.

Zaleca się, aby stosować odstęp czasowy pomiędzy podawaniem sukralfatu i innych produktów leczniczych. Podawanie innych produktów leczniczych 2 godziny przed sukralfatem eliminuje występowanie szeregu interakcji.

4.6 Wpływ na płodność, ciążę i laktację

Ciąża

Brak jest wystarczających danych dotyczących stosowania sukralfatu u kobiet w ciąży.

Badania na zwierzętach dotyczące wpływu na przebieg ciąży, rozwój zarodka i płodu, przebieg porodu i (lub) rozwój pourodzeniowy są niewystarczające (patrz 5.3). Potencjalne zagrożenie dla człowieka nie jest znane.

Produktu leczniczego Ulgastran nie należy stosować w okresie ciąży jeśli nie jest to bezwzględnie konieczne.

Karmienie piersią

Kobiety karmiące piersią nie powinny stosować produktu leczniczego Ulgastran.

4.7 Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn

Ulgastran nie ma wpływu na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn.

4.8 Działania niepożądane

Działania niepożądane po zastosowaniu sukralfatu mają niewielkie nasilenie i rzadko są przyczyną przerwania terapii.

Każde zdarzenie zostało opisane według częstości występowania.

Częstość występowania działań niepożądanych podano zgodnie z następującą klasyfikacją:

często ($\geq 1/100$ do $< 1/10$);

niezbyt często ($\geq 1/1\,000$ do $< 1/100$);

rzadko ($\geq 1/10\,000$ do $< 1/1\,000$).

W obrębie każdej grupy o określonej częstotliwości występowania objawy niepożądane są wymienione zgodnie ze zmniejszającym się nasileniem.

często	zaparcia
niezbyt często	biegunka, wymioty, nudności, ból głowy, wzrost stężenia glinu i wapnia zjonizowanego oraz spadek stężenia fosforu organicznego w surowicy
rzadko	zawroty głowy, bezsenność, nadmierna senność, niestrawność, wzdęcia, suchota w jamie ustnej, zapalenie błony śluzowej nosa, osteoporoza, osteopenia, obrzęk twarzy, świąd, wysypka, hepatotoksyczność, toksyczne uszkodzenie nerek, bezoary (patrz punkt 4.4)

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

PL-02 222 Warszawa

Tel.: + 48 22 49 21 301

Faks: + 48 22 49 21 309

e-mail: ndl@urpl.gov.pl

4.9 Przedawkowanie

Objawy charakterystyczne dla przedawkowania sukralfatu nie są znane.

Badania na zwierzętach, dotyczące toksyczności ostrej, wykazały brak efektu toksycznego przy zastosowaniu dawek 12 g/kg masy ciała. Sukralfat jest tylko w minimalnych ilościach wchłaniany do krwi. W razie przyjęcia dużych dawek produktu leczniczego w okresie do 2 godzin od zastosowania można rozważyć płukanie żołądka.

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

5.1 Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: inne leki stosowane w chorobie wrzodowej i refluksowej; kod ATC: A02BX02

Sukralfat jest kompleksowym związkiem wodorotlenku glinu i siarczanu sacharozy (zasadowa sól glinowa ośmiosisarczanu sacharozy). Związek ten należy do leków osłonowych, stosowanych w leczeniu choroby wrzodowej, które nie mają ani działania zobojętniającego, ani nie hamują sekrecji żołądkowej. W środowisku kwaśnym sukralfat staje się wysoce polarny i wiąże się z tkankami dna owrzodzenia na około 12 godzin, przy stosunkowo niewielkim wiązaniu z prawidłową błoną śluzową żołądka i dwunastnicy. W obecności kwasu solnego wiąże się z dodatnio naładowanymi grupami glikoprotein. Może tworzyć kompleksowe połączenie o charakterze żelu z cząsteczkami śluzu, co ma zapobiegać enzymatycznemu rozkładowi tego ostatniego przez pepsynę. Uważa się, że jego przyleganie do ziarniny uniemożliwia dyfuzję jonów wodorowych do dna owrzodzenia. Ponadto, wiąże sole kwasów żółciowych oraz pepsynę i w ten sposób ogranicza ich działanie uszkodzające. Sukralfat zwiększa tkankowe stężenie endogennych prostaglandyn i łączy się z naskórkowym czynnikiem wzrostu oraz innymi czynnikami wzrostowymi, angażując je w miejscową reakcję obrony śluzówkowej. Jego skuteczność w gojeniu owrzodzeń i

zapobieganiu nawrotom choroby wrzodowej jest podobna do leków z grupy *antacida* (alkaliów) i antagonistów receptora H₂. W obecności kwasu solnego polimery cząsteczek produktu leczniczego tworzą lepką pastę powlekającą ściany żołądka; jeszcze po 3 godzinach od podania w żołądku znajduje się około 3% podanej dawki. Nie wpływa na czas opróżniania żołądka, ani na trawienie. Nie wykazano działania sukralfatu na układ sercowo-naczyniowy, ani na ośrodkowy układ nerwowy.

Dzieci i młodzież

W literaturze istnieją ograniczone dane kliniczne dotyczące stosowania sukralfatu u dzieci, głównie w profilaktyce wrzodów stresowych, refluksowym zapaleniu przełyku i zapaleniu błon śluzowych. Dawka podawana w tych badaniach to 0,5 - 1 g cztery razy na dobę, w zależności od wieku dziecka i nasilenia choroby, była stosowana bez zagrożenia bezpieczeństwa. Ze względu na ograniczoną ilość danych, nie zaleca się obecnie stosowania sukralfatu u dzieci w wieku poniżej 14 lat.

5.2 Właściwości farmakokinetyczne

Po podaniu doustnym sukralfat w niewielkim stopniu (od 2 do 5%) jest wchłaniany z przewodu pokarmowego. Sukralfat ulega w żołądku częściowej dysocjacji (około 10%) do Al(OH)₃ oraz ośmiosiarczanu sacharozy. Uwalniane jony glinu ulegają związaniu z fosforanami oraz innymi anionami w żołądku oraz jelicie do nierozpuszczalnych i słabo ulegających absorpcji związków lub do związków rozpuszczalnych, lecz w małym stopniu przyswajalnych. Wchłanianie jonów glinu wynosi od 0,1 do 10%. U pacjentów stosujących długotrwałą terapię z zastosowaniem sukralfatu oznaczono średnio 8,41 mg jonów glinu/l i nie stwierdzono statystycznie istotnej różnicy w porównaniu z grupą stosującą placebo.

Na etapie wchłaniania może dochodzić do interakcji sukralfatu z pokarmem. Ze względu na możliwość wiązania się sukralfatu z białkami pokarmowymi oraz zwiększania biodostępności indukowanej pokarmem zaleca się podawanie sukralfatu na 1 godzinę przed posiłkiem lub 2 godziny po posiłku.

Celem terapii z zastosowaniem sukralfatu jest wywieranie działania w obrębie błony śluzowej żołądka i dwunastnicy. Ze względu na niewielkie wchłanianie największe stężenie jonów glinu występuje w żołądku i dwunastnicy. Przy prawidłowej czynności nerek głównym kompartmentem dla sukralfatu jest światło przewodu pokarmowego.

Sukralfat w obecności kwasu solnego w żołądku uwalnia jony glinowe, które wiążą się z dodatnio naładowanymi grupami białek błony śluzowej. Siarczan sacharozy powstały pod wpływem kwasu solnego nie jest metabolizowany i jest wydalany w postaci niezmienionej wraz z kałem w ciągu 48 godzin (ponad 90% przyjętej dawki).

Wydalenie sukralfatu następuje głównie przez przewód pokarmowy, zaledwie 0,5 - 2,2 % jest wydalone przez nerki z moczem.

5.3 Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

Dane niekliniczne, uzyskane na podstawie konwencjonalnych badań farmakologicznych dotyczących bezpieczeństwa stosowania, toksyczności po podaniu wielokrotnym, genotoksyczności, potencjalnego działania rakotwórczego i toksycznego wpływu na reprodukcję, nie ujawniają występowania szczególnego zagrożenia dla człowieka.

6. DANE FARMACEUTYCZNE

6.1 Wykaz substancji pomocniczych

Hypromeloza
Symetykon emulsja 30%
Metylu parahydroksybenzoesan
Propylu parahydroksybenzoesan
Glicerol
Sorbitol

Sacharyna sodowa
Kwas cytrynowy
Wanilina
Olejek cytrynowy
Woda oczyszczona

6.2 Niezgodności farmaceutyczne

Nie dotyczy.

6.3 Okres ważności

2 lata.

6.4 Specjalne środki ostrożności podczas przechowywania

Przechowywać w temperaturze poniżej 25°C.

6.5 Rodzaj i zawartość opakowania

Butelka z oranżowego szkła w tekturowym pudełku.
250 ml w butelce.

6.6 Specjalne środki ostrożności dotyczące usuwania

Bez specjalnych wymagań.

7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

GEDEON RICHTER POLSKA Sp. z o.o.
ul. Ks. J. Poniatowskiego 5
05 - 825 Grodzisk Mazowiecki
tel.: (22) 755 50 81

8. NUMER POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Pozwolenie nr R/1646

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

Data wydania pierwszego pozwolenia na dopuszczenie do obrotu: 29.12.1992 r.
Data ostatniego przedłużenia pozwolenia: 02.10.2013 r.

10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO