

CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

ULGASTRAN, 1 g, tabletki

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

Jedna tabletki zawiera 1 g sukralfatu (*Sucralfatum*).
Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Tabletki.

Białe lub prawie białe tabletki, okrągłe, obustronnie płaskie, o średnicy 16 mm.

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1 Wskazania do stosowania

Choroba wrzodowa żołądka i dwunastnicy.

4.2 Dawkowanie i sposób podawania

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

Dzieci i młodzież

Nie określono dotychczas bezpieczeństwa stosowania i 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 wydalanie glinu przez nerki jest zmniejszone. 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 czas. 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 min 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.

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 (*antacida*), zwiększając pH soku żołądkowego zmniejszają skuteczność sukralfatu.

Sukralfat w środowisku kwaśnym soku żołądkowego uwalnia jony glinu, dlatego należy zwracać uwagę na możliwość 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 zachowanie odstępu czasowego między 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 punkt 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 zaburza sprawności psychofizycznej, zdolności prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn.

4.8 Działania niepożądane

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

Częstość możliwych działań niepożądanych określono następująco: bardzo często: ($\geq 1/10$); często: ($\geq 1/100$ do $< 1/10$); niezbyt często: ($\geq 1/1,000$ do $< 1/100$); rzadko: ($\geq 1/10,000$ do $< 1/1,000$). Zdarzenia uszeregowano zgodnie z częstością występowania oraz ciężkością.

<i>często:</i>	zaparcia
<i>niezbyt często:</i>	ból głowy, nudności, wymioty, biegunka wzrost stężenia glinu i wapnia zjonizowanego oraz spadek stężenia fosforu organicznego w surowicy
<i>rzadko:</i>	zawroty głowy, bezsenność, nadmierna senność, nieżyt błony śluzowej nosa, niestrawność, wzdęcia, suchość w ustach, zapalenie krtani osteopenia, osteoporoza 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 ośmiosiarczanu 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 śluzu 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 wzrostu, 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%) wchłania się z przewodu pokarmowego. Sukralfat ulega w żołądku częściowej dysocjacji (około 10%) do wodorotlenku glinu oraz ośmiosiarczanu sacharozy. Uwalniane jony glinu wiążą się z fosforanami oraz innymi anionami w żołądku oraz jelicie do nierozpuszczalnych i źle wchłanianych związków lub do związków rozpuszczalnych, lecz w małym stopniu przyswajalnych. Wchłanianie jonów glinu wynosi od 0,1 do 10%. U pacjentów długotrwale leczonych sukralfatem oznaczano 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 wydalane przez nerki z moczem.

5.3 Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

Nie stwierdzono działania rakotwórczego w badaniach przeprowadzonych na myszach, szczurach i królikach, którym podawano sukralfat w dawkach do 1 mg/kg na dobę (dawka 12 razy większa od dawki stosowanej u ludzi) przez 2 lata. W badaniach na zwierzętach nie stwierdzono również zmniejszenia płodności ani efektów embriotoksycznych. Badań oceniających mutagenność nie prowadzono.

6. DANE FARMACEUTYCZNE

6.1 Wykaz substancji pomocniczych

Celuloza mikrokrystaliczna
Krzemionka koloidalna bezwodna
Magnezu stearynian
Powidon K-30

6.2 Niezgodności farmaceutyczne

Nie dotyczy.

6.3 Okres ważności

3 lata

6.4 Specjalne środki ostrożności podczas przechowywania

Przechowywać w temperaturze poniżej 25°C .

6.5 Rodzaj i zawartość opakowania

Blistry z folii Aluminium/PCV w tekturowym pudełku.
50 tabletek.

6.6 Specjalne środki ostrożności dotyczące usuwania

Bez specjalnych wymagań.

7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Gedeon Richter Plc.
Gyömrői út 19-21
1103 Budapeszt
Węgry

8. NUMER POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Pozwolenie nr R/2236

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: 28.02.2014 r.

**10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU
CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO**